



**LATVIJAS REPUBLIKAS PATENTU VALDES
OFICIĀLAIS IZDEVUMS**

**IZGUDROJUMI,
PREČU ZĪMES UN
DIZAINPARAUGI**

8/2014

Latvijas Republikas Patentu valde
Patent Office of the Republic of Latvia

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

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

The Official Gazette of the Patent Office of the Republic of Latvia - "Izgdrojumi, Preču Zīmes un Dizainparaugi" - contains recordings in the Registers of Inventions, Trademarks, Industrial designs and Topographies of Semiconductor Products.

Date of publication of the registered inventions and trademarks - August 20, 2014.

IZGUDROJUMI, PREČU ZĪMES UN DIZAINPARAUGI

LATVIJAS REPUBLIKAS PATENTU VALDES
OFICIĀLAIS IZDEVUMS

8/2014
20. augusts

1119. - 1308. lappuse

S A T U R S

IZGUDROJUMI

Izgudrojumu pieteikumu publikācijas	1120
Izgudrojumu patentu publikācijas	1125
Attiecināto Eiropas patentu publikācijas (Patentu likuma 19. panta 2. un 4. daļa)	1130
Attiecināto Eiropas patentu publikācijas (Patentu likuma 19. panta 3. daļa)	1138
Eiropas patentu pieteikumu publikācijas Latvijā (Patentu likuma 70. panta 2. daļa)	1139
Latvijā apstiprināto Eiropas patentu publikācijas (Patentu likuma 71. panta 5. daļa)	1140
Latvijā apstiprināto Eiropas patentu publikācijas (Patentu likuma 71. panta 3. un 5. daļa)	1270
Papildu aizsardzības sertifikāti	1272
Pieteicēju, izgudrotāju un īpašnieku alfabētiskais rādītājs	1274
Izgudrojumu pieteikumu un patentu numuru rādītājs	1276

PREČU ZĪMES

Reģistrētās preču zīmes	1277
Preču zīmju pieteikumu numerācijas rādītājs	1298
Preču zīmju īpašnieku rādītājs	1299
Preču zīmju rādītājs pēc preču un pakalpojumu klasēm	1300

GROZĪJUMI VALSTS REĢISTROS

Grozījumi Patentu reģistrā	1301
Grozījumi Valsts dizainparaugu reģistrā	1302
Grozījumi Valsts preču zīmju reģistrā	1303
Pamanīto kļūdu labojums	1308

C O N T E N T S

INVENTIONS

Publication of Patent Applications	1120
Publication of Invention Patents	1125
Publication of Extended European Patents (Patent Law, Article 19, Paragraphs 2 and 4)	1130
Publication of Extended European Patents (Patent Law, Article 19, Paragraph 3)	1138
Publication of European Patent Applications in Latvia (Patent Law, Article 70, Paragraph 2)	1139
Publication of European Patents Validated in Latvia (Patent Law, Article 71, Paragraph 5)	1140
Publication of European Patents Validated in Latvia (Patent Law, Article 71, Paragraphs 3 and 5)	1270
Supplementary Protection Certificates	1272
Name Index of Applicants, Inventors and Owners	1274
Application and Patent Number Index of Inventions	1276

TRADEMARKS

Registered Trademarks	1277
Application Number Index of Trademarks	1298
Name Index of Trademark Owners	1299
Trademark Registrations Listed by Classes of Goods and Services	1300

CHANGES IN THE STATE REGISTERS

Changes in the Patent Register	1301
Changes in the Industrial Designs Register	1302
Changes in the Trademarks Register	1303
Correction of Mistakes	1308

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) **Izgudrojuma nosaukums.**
Title of the invention.
- (57) Kopsavilkums vai formulas neatkarīgie punkti.
Abstract or independent claims.
- (92) Ārstniecības līdzekļa reģistrācijas apliecības numurs un izsniegšanas datums Latvijā.
Number and date of marketing authorization in Latvia.
- (93) Ārstniecības līdzekļa reģistrācijas apliecības numurs un 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.

Izgudrojumu pieteikumu publikācijas

A sekcija

A23C21/00 14890

- (51) **A23G3/46** (11) **14890 A**
A23C21/00
- (21) P-13-224 (22) 20.12.2013
(41) 20.08.2014
(71) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;
Lielā iela 2, Jelgava, LV-3001, LV
(72) Santa ROZENBERGA (LV),
Daiga KUNKULBERGA (LV)
(54) **CIETO KARAMEĻU GATAVOŠANAS PAŅĒMIENS**
METHOD OF PRODUCING HARD CARAMEL
(57) Izgudrojums attiecas uz cieto karamelu gatavošanas paņēmienu, kurā izmanto no siera sūkalām ražotu glikozes-galaktozes sīrupu.

Invention refers to hard candy preparation wherein glucose-galactose syrup made of cheese whey is used.

- (51) **A23L3/44** (11) **14891 A**
(21) P-13-223 (22) 20.12.2013
(41) 20.08.2014
(71) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;
Lielā iela 2, Jelgava, LV-3001, LV
(72) Emīls STOČKA (LV),
Mārtiņš RUCIŅŠ (LV),
Imants SKRUPSKIS (LV),
Anita BLIJA (LV)
(54) **LIOFILIZĒTA PUSDIENU PRODUKTA GATAVOŠANAS**
METODE
METHOD OF MAKING LYOPHILIZED FOOD FOR LUNCH
(57) Izgudrojums attiecas uz pārtikas nozari, konkrēti uz liofilizētu ēdienu koncentrātu izgatavošanu. Piedāvātais paņēmiens paredz, ka pēc liofilizācijas procesa beigām ēdiena koncentrāts papildus tiek izturēts +2° līdz +6 °C vidē 24 stundas. Tas nodrošina atlikušā mitruma viendabīgu izlīdzināšanos visā produktā.

The invention relates to the food industry, in particular, to production of lyophilized meal concentrate. Proposed method suggests that after finishing lyophilisation process meal concentrate has been matured for 24 hours in the temperature from +2° till +6 °C. As a result smoothing of residual moisture in meal is provided.

- (51) **A61B17/34** (11) **14892 A**
(21) P-14-34 (22) 29.04.2014
(41) 20.08.2014
(71) RĪGAS STRADIŅA UNIVERSITĀTE; Dzirciema iela 16, Rīga,
LV-1007, LV
(72) Vladimirs FOKINS (LV),
Guntars PUPELIS (LV)

- (74) Ludmila IVANOVA; Dzirciema iela 16, Rīga, LV-1007, LV
 (54) **ADATA AIZKUŅĢA DZIEDZERA GALVENĀ IZVADA PUNKCIJAI UN ATVĒRŠANAI**
THE NEEDLE FOR THE PUNCTURE AND OPENING OF THE MAIN PANCREATIC DUCT

(57) Izgudrojums attiecas uz medicīnas tehniku, konkrēti, uz instrumentiem, kuri var būt izmantojami aizkuņģa dziedzera operatīvā ārstēšanā, kā arī aizkuņģa dziedzera galvenā izvada (DGI) vienlaicīgai punkcijai un atvēršanai. Adata sastāv no dobas caurulītes (1) ar taisnu daļu (AB) un izliektu daļu (BC) ar puselipses formu, kuras izliektajam lokam (DF) ir pusapļa forma, taisnās daļas (AB) garums ir 3 mm, izliektās daļas (BC) garums ir 57 mm, leņķis α starp taisno (AB) un izliekto (BC) daļu ir 90° , izliektā loka (DF) rādiuss (DE, EF) ir 15 mm, attālums (BC) starp taisno daļu (AB) un slīpā griezumā (2) smailo galu ir 60 mm, izliektās daļas (BC) posms (BD) vienāds ar izliektās daļas (BC) posmu (CF) un ir 5 mm, dobas caurules (1) diametrs ir 0,9 – 1,3 mm.

The invention relates to medical device, in particular to instruments that could be used in the operative treatment of the pancreas as well as in coincident puncture and opening of the main pancreatic duct (MPD). A needle consists of a hollow tube (1) with a straight part (AB) and a curved part (BC) having a shape of semi-ellipse and a curved arch (DF) of the semiellipse has a shape of semicircle, a length of the straight part (AB) is 3 mm, a length of the curved part (BC) is 57 mm, an angle α between the straight part (AB) and the curved part (BC) is 90° , a radius (DE, EF) of the curved arch (DF) is 15 mm, the distance (BC) between the straight part (AB) and pointed end of a sloping cut (2) is 60 mm, a section (BD) of the curved part (BC) is equal to a section (CF) of the curved part (BC) and is 5 mm long, a diameter of the hollow tube (1) is 0,9 – 1,3 mm.

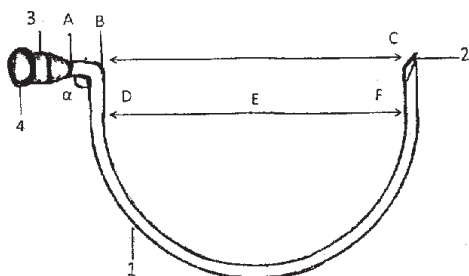


Fig. 1

A61P17/18 14895

B sekcija

- (51) **B32B21/06** (11) 14893 A
 (21) P-13-217 (22) 20.12.2013
 (41) 20.08.2014
 (71) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;
 Lielā iela 2, Jelgava, LV-3001, LV
 (72) Juris METUMS (LV)
 (54) **VAIRĀKKĀRTU KOMPOZĪTMATERIĀLS AR GOFRĒTĀ KARTONA VIDUSKĀRTU UN PAŅĒMIENS TĀ IZGATAVOŠANAI**
MULTI-LAYER COMPOSITE MATERIAL HAVING CORRUGATED CARDBOARD LAYER AND A METHOD FOR MAKING THEREOF

(57) Izgudrojums attiecas uz kārtainu vieglu masas plātni un tās ražošanas paņēmieni. Plātne sastāv no viduskārtas, kura ir izveidota no daudzkārtu materiāla, piemēram, vairākkārtu gofrēta kartona loksne ar savstarpēji perpendikulāru gofrējuma virzienu, un ārējām kārtām, kas var būt plāns koksnes plātņu materiāls, piemēram, MDF plātnes.

The invention relates to a multiple layer light weight panel and its manufacturing method. The panel consists of a middle layer, made from multiple layer material, such as sheets of multi-layer corrugated cardboard layers of which are sorted perpendicularly to each other by their flute direction, and the outer layers, which may be a thin wood panel material such as MDF boards.

- (51) **B60G17/00** (11) 14894 A
 (21) P-13-14 (22) 28.01.2013
 (41) 20.08.2014
 (71) Māris Ralfs MUNDI; Vaļņu iela 3-7, Rīga, LV-1050, LV
 (72) Māris Ralfs MUNDI (LV)
 (74) Artis KROMANIS, PĒTERSONA PATENTS; p/k 61, Rīga, LV-1010, LV
 (54) **SISTĒMA UN METODE MOTOCIKLA PIEKARES VADĪBAI**
SYSTEM AND METHOD FOR CONTROL OF MOTOR-CYCLE SUSPENSION

(57) Izgudrojums attiecas uz sistēmu un metodi motocikla vadīšanas raksturlielumu uzlabošanai, jo īpaši vadot priekšējās piekares raksturlielumus, bremzējot un/vai veicot līkuma izbraukšanas manevru. Piedāvātā sistēma (Fig. 1) satur priekšējā riteņa piekari (1), kurā ietilpst dakša (2) un ritenis (5), un regulēšanas mehānismu (6), kas pielāgots, lai mainītu priekšējā riteņa piekares (1) stingumu un/vai amortizāciju. Sistēma papildus satur izpildmehānismu (20), kas ir instalēts motocikla braucēja ceļgala tuvumā un ir darbotiespējīgi savienots ar regulēšanas mehānismu (6), pie kam tas ir konfigurēts tā, lai būtu manuāli vadāms ar braucēja ceļgala (8) palīdzību, kā rezultātā var vadīt priekšējā riteņa piekares (1) stinguma raksturlielumus.

The invention relates to a system and a method for improving handling characteristics of a motorcycle in braking and/or cornering, especially for controlling characteristics of front suspension. The offered system (Fig. 1) comprises a front wheel suspension (1) having fork (2) and a wheel (5), and adjusting mechanism (6) adapted to change the stiffness and/or dampening of the front wheel suspension (1). The system further comprises an actuator (20) installed on a bike in the proximity of the rider's knee and is operatively connected to the adjusting mechanism (6), wherein it is configured to be manually controlled by the rider's (9) knee (8), in result of which the stiffness characteristics of the front wheel suspension (1) can be controlled.

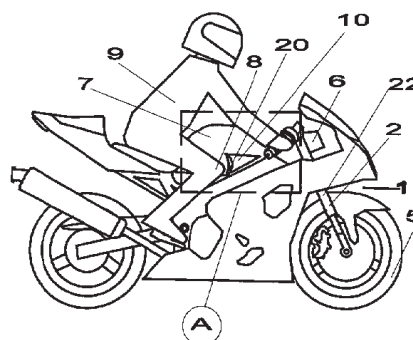


Fig. 1

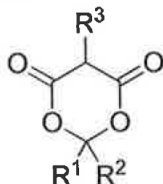
C sekcija

- (51) **C07D319/04** (11) 14895 A
A61P17/18
 (21) P-14-52 (22) 20.06.2014
 (41) 20.08.2014
 (71) RĪGAS TEHNISKĀ UNIVERSITĀTE; Kaļķu iela 1, Rīga, LV-1658, LV
 (72) Inese MIERIŅA (LV),
 Māra JURE (LV),

Sindija ZĒBERGA (LV),
Daina ZICĀNE (LV),
Zenta TETERE (LV),
Irisa RĀVIŅA (LV)

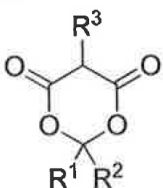
- (54) **5-MONOĀIZVIETOTU 2-MONO- VAI 2,2-DIAIZVIETOTU 1,3-DIOKSĀN-4,6-DIONU SAVIENOJUMI KĀ ANTIRADIKĀĻU AĢENTI UN ANTIOKSIDANTI**
COMPOUNDS OF 5-MONOSUBSTITUTED 2-MONO- OR 2,2-DISUBSTITUTED 1,3-DIOXANE-4,6-DIONE AS ANTI-RADICAL AGENTS AND ANTIOXIDANTS

(57) Izgudrojums attiecas uz ķīmijas nozari, konkrēti uz organiskiem savienojumiem, kas pielietojami nepiesātināto taukskābju atvasinājumu oksidatīvās stabilitātes uzlabošanai. Aprakstīti 5-monoaizvietoti-2-mono- un 5-monoaizvietoti-2,2-diaizvietoti-1,3-dioksān-4,6-dioni ar formulu



kā antiradikāļu aģenti un antioksidanti.

The present invention relates to the field of chemistry, particularly to organic compounds, which can be used for the increase of the oxidative stability of the derivatives of unsaturated fatty acids, particularly to 5-monosubstituted-2-mono- and 5-monosubstituted-2,2-disubstituted-1,3-dioxane-4,6-diones having formula



as antiradical agents and antioxidants.

- (51) **C12C7/053** (11) **14896 A**
(21) P-13-226 (22) 20.12.2013
(41) 20.08.2014
(71) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;
Lielā iela 2, Jelgava, LV-3001, LV
(72) Ingmārs CINKMANIS (LV),
Ilze ČAKSTE (LV),
Sanita VUCĀNE (LV)
(54) **MISAS IEGŪŠANAS METODE NO NETRADICIONĀLĀM IZEJVIELĀM**
METHOD FOR MAKING WORT FROM NON-TRADITIONAL RAW MATERIALS

(57) Izgudrojums attiecas uz alus darīšanas procesu. Tiek piedāvāts misas vārīšanas procesā apiņus pilnīgi vai daļēji aizstāt ar rūgtvielām bagātu augu piedevām. Par šādiem augiem var izmantot pelašķus, vērmeles, ozolu mizas un zīles.

The invention relates to the brewing process. It is offered to replace the hops partially or completely with plants that are rich in bitter substances during the boiling process of the wort. For these plants yarrow, wormwood, oak bark or acorn can be used.

- (51) **C12P19/34** (11) **14897 A**
(21) P-13-16 (22) 05.02.2013
(41) 20.08.2014
(71) Guna FELDMANE; Konsula iela 19, Rīga, LV-1007, LV;
Roberts FELDMANIS; Konsula iela 19, Rīga, LV-1007, LV
(72) Guna FELDMANE (LV),
Andrejs BĒRZIŅŠ (LV),

Kristīne SALENIECE (LV),
Andris KOĻESŅIKOVŠ (LV)

- (54) **INTERFERONĀ INDUKTORA - DUBULTSPIRĀLISKAS RNS IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS**
METHOD FOR PRODUCTION OF INTERFERON INDUCER DOUBLE HELIX RNA

(57) Izgudrojums attiecas uz dubultspirāliskas RNS iegūšanas paņēmieni, kurā *E. coli* Q13 kultūru inficē ar bakteriofāga f2 mutantu sus₁₁, barotnes sastāvu papildina ar rauga hidrolizātu un glikozi, bet peptonu daļēji aizstāj ar amonija sulfātu.

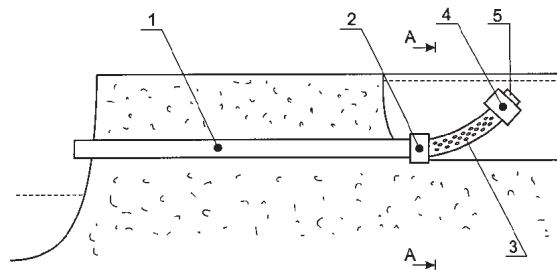
Invention relates to a method for production of double-helix RNA in which *E. coli* Q13 culture is infected with a mutant sus₁₁ of the bacteriophage f2 and a cultural medium is supplemented by yeast hydrolysate and glucose and peptone is partially substituted by ammonium sulphate.

E sekcija

- (51) **E02B11/00** (11) **14898 A**
(21) P-14-41 (22) 19.05.2014
(41) 20.08.2014
(71) Uldis AMERIKS; Raiņa iela 6, Piņķi, Babītes pag., Babītes nov., LV-2107, LV;
Sergejs ŠAKUNS; Kūdras iela 11-30, Olaine, Olaines nov., LV-2114, LV
(72) Uldis AMERIKS (LV),
Sergejs ŠAKUNS (LV)
(74) Ludmila IVANOVA; Kronvalda bulvāris 3, Rīga, LV-1010, LV
(54) **DRENĀŽAS IEKĀRTA AR LOKANU PELDOŠU ŪDENS ŅĒMĒJIETAISI**
DRAINAGE FACILITY WITH FLEXIBLE FLOATING WATER INTAKE

(57) Izgudrojums attiecas uz hidromeliorācijas tehniku un var tikt izmantots kūdras izstrādņu meliorācijas sistēmās, lauksaimniecības zemju un citās meliorācijas sistēmās. Pieteiktā drenāžas iekārta satur ūdens ņēmējietaisi (3), kas ir lokana, peldoša caurule, pievienota pie ūdens novadcaurules (1), savienojumu (2), pludiņu-ierobežotāju (4) un aizsargsietu (5). Šī iekārta ļauj samazināt drenāžas ūdens novadcauruļu tīrīšanas un nomaiņas biežumu.

The invention refers to hydro-reclamation machinery and can be applied in the peat extraction field reclamation systems, agricultural land and other reclamation systems. The claimed drainage facility contains a water intake (3), which is a flexible floating hose connected to the water drainpipe (1), a connection (2), a float-dog (4) and a protecting riddle (5). Application of the said facility enables to reduce the frequency of water drainpipe cleaning and replacement.



1. zīm.

- (51) **E04C1/41** (11) **14899 A**
(21) P-13-17 (22) 05.02.2013
(41) 20.08.2014
(71) LATVIJAS UNIVERSITĀTE; Raiņa bulvāris 19, Rīga, LV-1586, LV

- (72) Jānis KĻAVIŅŠ (LV),
Andris JAKOVIČS (LV)
- (74) Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA; a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
- (54) **MŪRA ELEMENTS AR MAINĀMĀM SILTUMA IZOLĀCIJAS, KĀ ARĪ SILTUMA UN MITRUMA AKUMULĀCIJAS ĪPAŠĪBĀM**
BUILDING ELEMENT WITH CHANGEABLE PROPERTIES OF HEAT INSULATION AS WELL AS HEAT AND MOISTURE ACCUMULATION

(57) Izgudrojums attiecas uz celtniecības elementiem, konkrēti, uz celtniecības mūra elementiem ar maināmām būvfizikālajām siltuma izolācijas, kā arī siltuma un mitruma akumulācijas īpašībām. Piedāvāts mūra elements, kas satur divas daļas: daļu (A) un daļu (B), kur daļa (A) ietver elementa ārējo sienīņu (1), vairākus dobumus (2), kas ir pielāgoti, lai tos piepildītu ar siltumizolācijas materiālu, dobumu (2) sienīņas (3), kas ir perpendikulāras siltuma plūsmas virzienam, un dobumu (2) sienīņas (4), kas ir paralēlas siltuma plūsmas virzienam; daļa (B) ietver vairākus dobumus (6), kas ir pielāgoti, lai tos piepildītu ar fāžu pārejas materiālu, un dobumu (6) sienīņas (5), turklāt dobumiem (2) ir lielāks šķērsriezuma laukums nekā dobumiem (6). Piedāvātais mūra elements ir paredzēts telpas mikroklimate nodrošināšanai dinamiskos ekspluatācijas režīmos.

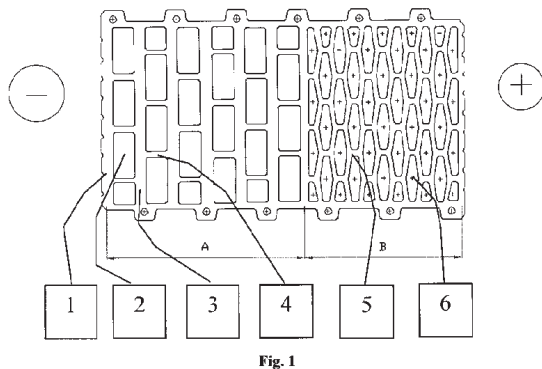


Fig. 1

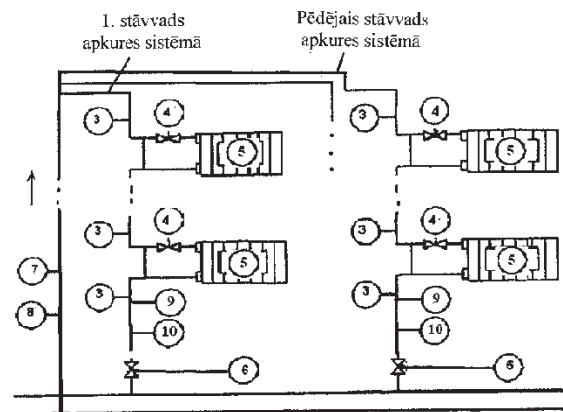
G sekcija

- (51) **G01K17/00** (11) **14900 A**
(21) P-13-13 (22) 22.01.2013
(41) 20.08.2014
(71) Manfreds Leontijs ŠNEPS-ŠNEPE; Lielais prospekts 35-10, Ventspils, LV-3601, LV
- (72) Manfreds Leontijs ŠNEPS-ŠNEPE (LV),
Anatolijs MAKŠIMENKO (LV),
Dmitrijs MALOVS (LV),
Dmitrijs RIGALINS (RU)
- (54) **INDIVIDUĀLĀ SILTUMA PATĒRIŅA UZSKAITES PAŅĒMIENS DAUDZDZĪVOKĻU MĀJĀ AR VERTIKĀLU VIENCAURULES SADALI**
CALCULATION METHOD FOR INDIVIDUAL CHARGEABLE HEAT IN THE APARTMENT HOUSES WITH A VERTICAL ONE-PIPE ALLOCATION

(57) Izgudrojums attiecas uz komunālo pakalpojumu mērījumu uzskaites līdzekļiem, īpaši uz sistēmām, kas veido un vāc datus, kas nosaka individuālo siltuma enerģijas patēriņu daudzdzīvokļu mājās ar vertikālu viencaurules sadali, proti, apkures apakšsistēmā (1) un karstā ūdens piegādes apakšsistēmā (2). Katra dzīvokļa mērījumu rezultāti no apkures sistēmas temperatūras sensoriem (3), karstā ūdens temperatūras sensoriem (11) un karstā ūdens skaitītājiem (12) tiek pārraidīti uz dzīvokļa mikroprocesoru (19). Katra dzīvokļa mikroprocesors (19) ir saistīts ar mājas procesoru (20). Apkures sistēmas kopējie siltuma enerģijas patēriņa dati no ienākošās kopējās ūdens plūsmas sensoriem (9) un izejošā kopējā ūdens temperatūras sensoriem (10) nonāk mājas procesorā (20). Karstā ūdens piegādes sistēmas kopējie siltuma enerģijas patēriņa dati no ienākošās kopējās ūdens plūsmas sensora (15), ienākošā kopējā

ūdens temperatūras sensora (16), izejošās kopējās ūdens plūsmas sensoriem (17), izejošā kopējā ūdens temperatūras sensoriem (18) nonāk mājas procesorā (20). Mājas procesors (20) aprēķina katra dzīvokļa siltumenerģijas patēriņu.

Invention relates to measurement systems of utilities, especially, which determine the individual heat energy consumption in multi-tenant house with a vertical single-pipe distribution, namely: in heating sub-system (1) and hot tap water supply sub-system (2). Results from heating system temperature sensors (3), hot water temperature sensors (11) and hot water meters (12) of each apartment are transferred to the apartment microprocessor (19). Each apartment microprocessor (19) is linked to house processor (20). The total heat energy consumption data from incoming total water flow sensor (7), incoming total water temperature sensor (8), outgoing total water flow sensors (9) and outgoing total water temperature sensors (10) of heating sub-system (1) are transmitted to the house processor (20). The total heat energy consumption data from incoming total water flow sensor (15), incoming total water temperature sensor (16), total outgoing water flow sensors (17), total outgoing water temperature sensors (18) of hot tap water supply sub-system (2) are transmitted to the house processor (20). The house processor (20) calculates energy consumption of each apartment.



Att. 1

- (51) **G01N33/50** (11) **14901 A**
(21) P-14-33 (22) 29.04.2014
(41) 20.08.2014
(71) RĪGAS STRADIŅA UNIVERSITĀTE; Dzirciema iela 16, Rīga, LV-1007, LV
- (72) Jeļena EGLĪTE (LV),
Vladislavs JASINSKIS (LV),
Gunta STŪRE (LV),
Diana KASJKO (LV),
Ludmila VĪKSNA (LV),
Artūrs SOČNEVS (LV)
- (74) Ludmila IVANOVA; Dzirciema iela 16, Rīga, LV-1007, LV
- (54) **IMŪNDEFICĪTA TERMINĀLĀ STĀVOKĻA ATTĪSTĪBAS RĪSKA NOTEIKŠANAS PAŅĒMIENS HIV INFCĪTIEM PACIENTIEM**
THE METHOD OF DETERMINING THE DEVELOPMENT RISK OF THE TERMINAL STATE OF THE IMMUNO-DEFICIENCY FOR THE HIV-INFECTED PATIENTS

(57) Izgudrojums attiecas uz medicīnu, konkrēti, uz molekulāro ģenētiku un infekcijas slimībām, var būt izmantojams cilvēka genoma mutācijas atklāšanā, lai noteiktu imūndeficīta stāvokļa attīstības risku HIV inficētiem pacientiem. Pieteikta metode, kurā minētā riska noteikšanai tiek konstatētas 2. eksona HLA-DRB1*01:01 gēna punktveida mutācijas, konkrēti, 2. eksona punktveida mutācijas 9., 11., 13., 28., 30., 38., 47. un 82. kodonā.

Invention relates to medicine, particularly to molecular genetics and infection diseases, may be used in the discovery of human

genome mutation to determine the risk of the development of the state of the immunodeficiency in HIV infected patients. The method, wherein to determine the said risk dots mutation, in particular, second exon dot mutation in codon 9, 11, 13, 28, 30, 38, 47, and 82, in the second exon of the HLA-DRB1*01:01 gene are established, is introduced.

(51) **G01N33/52** (11) **14902 A**

(21) P-14-35 (22) 29.04.2014

(41) 20.08.2014

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

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

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

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

**METHOD FOR PREDICTING RISK OF OVARIAN CAN-
CER IN WOMEN HAVING ADNEXAL TUMOR**

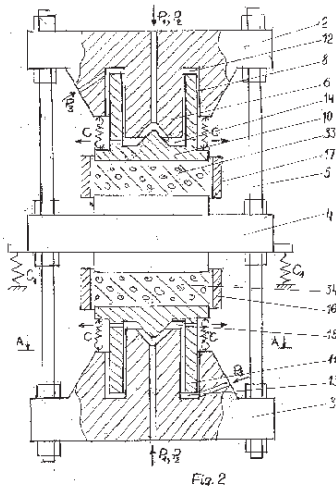
(57) Izgudrojums attiecas uz olnīcu vēža riska noteikšanas metodēm. Tiek piedāvāts kā biomarkieri izmantot cilvēka *epididimis* sekretorā proteīna 4 un kreatinīna rādītājus urīnā. Tiek noteikta šo divu vielu attiecība. Ja attiecība ir 1,34 vai lielāka, prognozē augstu olnīcu vēža rašanās risku.

Invention relates to methods for prognosing risk of development of ovarian cancer in women having adnexal tumor. The method provides for a measuring level of human epididymis secretory protein 4 and creatinine in urine and calculation of their ratio. If the ratio is 1.34 or higher there is a high risk of development of ovarian cancer.

Izgdrojumu patentu publikācijas

- (51) **A61F2/06** (11) **14807 B**
 (21) P-13-196 (22) 29.11.2013
 (45) 20.08.2014
 (73) RĪGAS TEHNISKĀ UNIVERSITĀTE; Kaļķu iela 1, Rīga, LV-1658, LV
 (72) Viktorija KANCEVIČA (LV), Leonīds RIBICKIS (LV), Andrejs LUKJANČIKOVŠ (LV)
 (54) **ASINSVADU PROTĒZE NO DABĪGĀ ZĪDA ĶIRURĢISKIEM PAVEDIENIEM**
 (57) 1. No tekstilmateriālu pavedieniem austā asinsvadu protēze, kas raksturīga ar to, ka protēzes sienīņās ir veidotas no ķirurģiskiem dabīgā zīda un poliuretāna pavedieniem, kas armēti ar poliestera pavedieniem.

- (51) **B28B1/08** (11) **14824 B**
 (21) P-12-137 (22) 24.08.2012
 (45) 20.08.2014
 (73) Pēteris AUZIŅŠ; Maskavas iela 319-95, Rīga, LV-1063, LV
 (72) Pēteris AUZIŅŠ (LV)
 (54) **BETONA IZSTRĀDĀJUMU FORMĒŠANAS METODE UN IEKĀRTA TĀS REALIZĒŠANAI**
 (57) 1. Betona izstrādājumu formēšanas metode, pielietojot tilpuma presēšanu, kas raksturīga ar to, ka, lai paaugstinātu betona izstrādājumu kvalitāti, tos formē, fāzē svārstot divas vienu virs otras novietotas presformas, pakļaujot tajās esošo, ar vibrācijām iepriekš noblīvēto, betona maisījumu secīgi ar fāžu nobīdi π/w triecienimpulsiem, kas vērsti pretēji kustības virzienam, presformas kustības ātruma kosinusoīdas maksimumos līdz brīdim, kad betona maisījuma iekšējā pretestība presēšanas spēkiem triecienimpulsu ietekmē nemazinās, kamēr tajā pašā laikā otras divas presformas, kas atrodas katra savā pusē iepriekš minētajām, tiek atbrīvotas no gatavās produkcijas un piepildītas no jauna ar formmaisījumu.
 2. Iekārta 1. pretenzijā definētās metodes realizēšanai, kas sastāv no presēšanas aprīkojuma un svārstību sistēmas, raksturīga ar to, ka ir uzbūvēta no viena vai vairākiem identiskiem blokiem, kas izpildīti kā trīs nekustīgas ar kolonnām kopā sastiprinātas traversas, malējās no kurām satur opozīti uz cilindriskiem serdeniem uzstādītus un gredzenveida iedobēs ap tiem ievietotus dobus darba virzuļus-puasonus, iedobēs veidojot darba tilpumus, pievienotus hidrotriecienu impulsu sistēmai, bet vidējā traversa un presformas veido augšējo un apakšējo izstrādājuma formēšanas līmeņus, pie kam hidrotriecienu impulsu sistēma ir apgādāta ar atšķirīgas ražības, kas ir apgriezti proporcionāla to spiedieniem, sūkņu stacijām, pie tam augstākas ražības un zemāka spiediena primārie izejas atzari ar vienvirziena vārstu palīdzību ir pieslēgti pie sekundārajiem augstāka spiediena un zemākas ražības sūkņu stacijās padeves atzariem izejā uz darba virzuļiem un plūsmas pārtraucēju aiz tiem.



- (51) **A01H4/00** (11) **14835 B**
A01H1/04
 (21) P-14-10 (22) 31.01.2014
 (45) 20.08.2014
 (73) LATVIJAS VALSTS AUGĻKOPĪBAS INSTITŪTS; Graudu iela 1, Dobeles, Dobeles nov., LV-3701, LV
 (72) Gunārs LĀCIS (LV), Inga MOROČKO-BIČEVSKA (LV), Irita KOTA-DOMBROVSKA (LV), Līga LEPSE (LV), Ineta SAMSONE (LV)
 (74) Gunārs LĀCIS, Latvijas Valsts augļkopības institūts; Graudu iela 1, Dobeles, Dobeles nov., LV-3701, LV
 (54) **ĀBEĻU UN BUMBIERU SOMAKLONĀLĀS MAINĪBAS AGRĪNAS DIAGNOSTIKAS PAŅĒMIENS**
 (57) 1. Somaklonālās mainības noteikšanas paņēmiens ģenētiskās identitātes noteikšanā ar meristēmu kultūrām *in vitro* pavairotā un atveseļotā augu materiālā, izmantojot SSR (mikrosatelītu) un MSAP (metilācijas specifiskās amplifikācijas polimorfisms) molekulāro marķieru kopu, kas satur:
 (a) sākotnējās somaklonālās mainības identificēšanas un novērtēšanas etapu, pielietojot 14 SSR molekulāros marķierus (CH0af07a, CH01h02, CH02g01, CH02h11a, CH03b06, CH04h02, CH05a02, CH05a05, CH05c06, CH05d03, CH05e06, CH05g07, EB177464, Hi05b09),
 (b) detalizētās somaklonālās mainības identificēšanas un novērtēšanas etapu, pielietojot četrus MSAP molekulāros marķierus (MSAP1, MSAP2, MSAP4, MSAP5) divās restrikcijas grupās EcoR1 + HpaI un EcoR1 + MspI.

2. Sākotnējās somaklonālās mainības identificēšanas un novērtēšanas paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā (a) darbībā izmanto:

- (a) dezoksiribonukleīnskābes (DNS) izdalīšanu no (i) izejas augu materiāla pirms ievadīšanas meristēmu kultūrā un (ii) *in vitro* ar meristēmām atveseļotā vai pavairotā augu materiāla;
 (b) augu materiāla ģenētiskās līdzības noteikšanu ar SSR (mikrosatelītu) molekulārajiem marķieriem, izmantojot polimerāzes ķēdes reakciju (PĶR);
 (c) SSR marķieru amplifikācijas rezultātu statistisko analīzi, ģenētiskās līdzības novērtēšanu;
 (d) ģenētiski atšķirīgo paraugu atlasīšanu un izslēgšanu no tālākas izmantošanas kā neatbilstošus sākotnējam auga materiālam, ja konstatēta atšķirība ir lielāka par 10 %.

3. Detalizētās somaklonālās mainības identificēšanas un novērtēšanas paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā (b) darbībā izmanto:

- (a) DNS izdalīšanu no (i) izejas augu materiāla pirms ievadīšanas meristēmu kultūrā un (ii) *in vitro* ar meristēmām atveseļotā vai pavairotā augu materiāla;
 (b) augu materiāla ģenētiskās līdzības noteikšanu ar MSAP (metilācijas specifiskās amplifikācijas polimorfisms) molekulārajiem marķieriem, izmantojot polimerāzes ķēdes reakciju (PĶR);
 (c) MSAP marķieru amplifikācijas rezultātu statistisko analīzi, ģenētiskās līdzības novērtēšanu;
 (d) ģenētiski atšķirīgo paraugu atlasīšanu un izslēgšanu no tālākas izmantošanas kā neatbilstošus sākotnējam auga materiālam, ja konstatēta atšķirība ir lielāka par 10 %.

4. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētais augu materiāls ir *Malus domestica* Borkh. – mājas ābele, *Pyrus communis* L. – mājas bumbiere.

5. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā kā minētos molekulāros marķierus pielieto kopējo šūnas DNS, kas ietver kodola, mitochondriju, hloroplastu DNS, kā arī to savstarpēju kombināciju.

- (51) **C02F9/00** (11) **14838 B**
C02F9/02
C02F9/14
 (21) P-13-214 (22) 18.12.2013
 (45) 20.08.2014
 (73) Sintija LORENCE; Kļavu iela 1, Roja, Rojas nov., LV-3264, LV;

Jiri HOUZVICKA; U Sparty 513/12, Bubeneč, 170 00 Praha 7, CZ

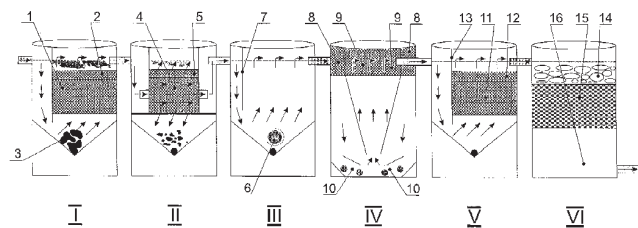
(72) Ainars LORENCS (LV)

(74) Ludmila IVANOVA; Kronvalda bulvāris 3, Rīga, LV-1010, LV

(54) **RAŽOŠANAS UN KOMUNĀLO NOTEKŪDEŅU MOBILĀ ATTĪRĪŠANAS IEKĀRTA**

(57) 1. Ražošanas un komunālo notekūdeņu mobilā attīrīšanas iekārta raksturīga ar to, ka ietver sešus cilindra, kuba vai paralēlskaldņa formas pamatblokus, kur pirmais pamatbloks satur vismaz divus secīgus rupjos mehāniskos filtrus, bet bloka apakšējā daļa ir izveidota konusa veidā 45° leņķī, kurā ir iemontēts elektriskais ventilis ar vakuuma sūkni un laika releju; otrais pamatbloks satur vismaz divus secīgus vidējos mehāniskos filtrus, bloka apakšējā daļa ir izveidota konusa veidā 45° leņķī, kurā ir iemontēts elektriskais ventilis un laika relejs, bloka augšējās daļas iekšpuse ir aprīkota ar starpsienu, kas nodrošina atdzesēto notekūdeņu izplūšanu bloka augšdaļā pēc nitrifikācijas procesa; ceturtais pamatbloka apakšējā daļā ir iemontēti vismaz divi mehāniskie filtri, zem mehāniskajiem filtriem ir ierīkoti aerācijas elementi ar iemontētiem sīkburbuļu aeratoriem ar membrānām, kas nodrošina skābekļa padevi bioloģiskam procesam, pirms notekūdeņu izplūdes papildus novietoti vismaz divi bioloģiskie filtri; piektā pamatbloka apakšējā daļā ir izveidota konusa veidā 45° leņķī, kurā iemontēts vakuuma sūkns ar laika releju un ventilis cieto vielu un nosēdumu izvadīšanai no iekārtas, bloka augšējās daļas iekšpuse ir aprīkota ar starpsienu, aiz kuras izvietoti vismaz divi secīgi smalkie mehāniskie filtri; sestā pamatbloka infiltrācijas laiks satur antracīta ogļu slāni, mazgātos oļus ar diametra izmēriem 10-24 mm un skalotu smilšu slāni ar graudiņu diametra izmēriem 0,1-2,0 mm.

2. Ražošanas un komunālo notekūdeņu attīrīšanas paņēmieni, izmantojot iekārtu saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīgi ar to, ka pirmajā pamatblokā veic cieto vielu atdalīšanu no notekūdeņiem, novirzot tos bloka apakšdaļā, vienlaicīgi atdalot no notekūdeņiem arī taukus un eļļas, novirzot tos bloka virspusē, atdalot un mehāniski novadot pie temperatūras 12 °C savākšanas konteineros; otrajā pamatblokā veic eļļas un tauku atdalīšanu no notekūdeņiem; trešajā pamatblokā veic jau daļēji mehāniski attīrīto notekūdeņu atdzesēšanu pirms bioloģiskā procesa un nitrifikāciju; ceturtajā pamatblokā veic jau daļēji attīrīto notekūdeņu bioloģisko procesu; piektajā pamatblokā veic izstrādāto bioloģisko dūņu un citu iespējamo piemaisījumu nostādīšanu; sestajā pamatblokā notekūdeņi plūst caur infiltrācijas sistēmas lauku un tiek novadīti.



(51) **C07D495/04** (11) **14853 B**
C07D333/38
A61K31/55

(21) P-12-172 (22) 12.11.2012

(45) 20.08.2014

(73) LATVIJAS ORGANISKĀS SINTĒZES INSTITŪTS; Aizkraukles iela 21, Rīga, LV-1006, LV

(72) Aleksandrs ČERNOBROVIJS (LV),

Antons ĻEBEDEVIS (LV),

Jurijs PŌNOMARJOVS (LV),

Diāna BOROVIKA (LV)

(74) Kristīne ČĀPASE JASTRŽEMBSKA, Latvijas Organiskās sintēzes institūts; Aizkraukles iela 21, Rīga, LV-1006, LV

(54) **2-METIL-4-(4-METILPIPERAZIN-1-IL)-10H-TIENO[2,3-B][1,5]BENZODIAZEPĪNA IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS**

(57) 1. 2-metil-4-(4-metilpiperazin-1-il)-10H-tieno[2,3-b][1,5]benzodiazepīna iegūšanas paņēmieni, kas sastāv no sekojošām stadijām:

a) 2-halogēnanilīna acilēšana ar ciānietikskābes hloranhidrīdu;

b) iegūtā amīda reakcija ar sēru un propanālu, veidojot tiofēna ciklu;

c) iegūtā amīda reakciju ar 1-metilpiperazīnu $TiCl_4$ -anizola sistēmā;

d) iegūtā amidīna iekšmolekulārā ciklizācija šķīdinātājā bāzes un katalizatora klātbūtnē.

2. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurš atšķiras ar to, ka ciklizācija tiek katalizēta ar palādija katalizatoru ar ligandu, kas izvēlēts no grupas, kura ietver PPh_3 , BINAP, Xantphos, X-Phos un John-Phos.

3. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurš atšķiras ar to, ka katalizators ir varu saturošs katalizators.

4. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurš atšķiras ar to, ka katalizators ir varu saturošs katalizators, kas izvēlēts no grupas, kura ietver $Cu(PPh_3)_3I$ un $Cu(PPh_3)_3Br$.

5. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurš atšķiras ar to, ka katalizators ir niķeli saturošs katalizators.

6. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurš atšķiras ar to, ka katalizators ir $Ni(cod)_2$.

7. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurš atšķiras ar to, ka katalizators ir bāze, izvēlēta no grupas, kura ietver n-BuLi, NaH, LiHMDS, 1-metilpiperazīna litija sāls.

8. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurš atšķiras ar to, ka amidīna ciklizāciju veic šķīdinātājā, kas izvēlēts no grupas, kura sastāv no benzola, toluola, ksilola un dioksāna.

9. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurš atšķiras ar to, ka amidīna ciklizāciju veic bāzes klātbūtnē, kas izvēlēta no grupas, kura ietver Na_2CO_3 , K_2CO_3 , Cs_2CO_3 , K_3PO_4 , NaO-tBu, LiHMDS un DBU.

(51) **G01R23/16** (11) **14855 B**

(21) P-14-15 (22) 14.02.2014

(45) 20.08.2014

(73) SAF TEHNIKA, AS; Ganību dambis 24A, Rīga, LV-1005, LV

(72) Didzis LIEPKALNS (LV),

Anrijs LAZDIŅŠ (LV),

Tims PEČERSKIS (LV)

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

(54) **ZEMAS STARPFREKVENCES SPEKTRA ANALIZATORS**

(57) 1. Zemas starpfrekvences spektra analizators, kas ietver elektriski savienotus: maztrokšņojošu pastiprinātāju (LNA); signāla jaucēju (MIX); zemfrekvences filtru (LPF) ar nogriešanas frekvenci F_{LPF} un augstfrekvences filtru (HPF) ar nogriešanas frekvenci F_{HPF} , ar kuriem tiek uzdots analīzes izšķirtspēja; amplitūdas detektoru (DET), kura izejas spriegums ir logaritmiski proporcionāls ieejas signāla amplitūdai; videofiltru (VF), kas vājina amplitūdas trokšņus; analogciparu pārveidotāju (ADC), kurā signāls tiek ciparots; kontrolleri; ekrānu; pārskatājamo ģeneratoru (VCO) un fāzes pieskaņošanas cilpu (PLL), pie kam:

pastiprinātāja (LNA) ieeja ir savienota ar spektra analizatora ieeju; pastiprinātāja (LNA) izeja ir savienota ar jaucēja (MIX) vienu ieeju; jaucēja (MIX) izeja ir savienota ar zemfrekvences filtra (LPF) ieeju; filtra (LPF) izeja ir savienota ar augstfrekvences filtra (HPF) ieeju; filtra (HPF) izeja ir savienota ar amplitūdas detektora (DET) ieeju; detektora (DET) izeja ir savienota ar videofiltru (VF) ieeju; videofiltru (VF) izeja ir savienota ar analogciparu pārveidotāja (ADC) ieeju; pārveidotāja (ADC) izeja ir savienota ar kontrollera ieeju; kontrollera viena izeja ir savienota ar ekrāna ieeju, bet otra izeja ir savienota fāzes pieskaņošanas cilpu (PLL), kas ir savienota ar pārskatājamo ģeneratora (VCO) ieeju; ģeneratora (VCO) izeja ir savienota ar signāla jaucēja (MIX) otro ieeju; kontrolleris ir pielāgots veikt visas nepieciešamās matemātiskās operācijas un nosūtīt attēlošanai uz ekrāna signāla jaudu pie attiecīgas frekvences, kā arī ir pielāgots vadīt pārskatājamo ģeneratoru (VCO) ar fāzes pieskaņošanas cilpas (PLL) palīdzību, pārskatājot tam frekvenci ar uzdoto soli F_{st} .

2. Zemas starpfrekvences spektra analizators saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver otru signāla zaru, kas satur elektriski savienotus: joslas filtru (BPF) ar centrālo frekvenci F_{IF} , kur $F_{IF} \gg F_{LPF}$ un filtra joslas platumu, kas nav šaurāks par $2 \times F_{LPF}$; otru amplitūdas detektoru (DET2); otru videofiltru (VF2) un otru analogciparu pārveidotāju (ADC2), turklāt:

joslas filtra (BPF) ieeja ir elektriski savienota ar signāla jaucēja (MIX) izeju; joslas filtra (BPF) izeja ir savienota ar otrā amplitūdas detektora (DET2) ieeju; amplitūdas detektora (DET2) izeja ir savienota ar otrā videofiltru (VF2) ieeju; videofiltru (VF2) izeja ir savienota ar otrā analogciparu pārveidotāja (ADC2) ieeju; analogciparu pārveidotāja (ADC2) izeja ir savienota ar kontrolera otru ieeju,

kontrolerī paralēli tiek ierakstītas trīs saņemto signālu rindas: viena signālu rinda no pirmā zara, otra signālu rinda no otrā zara, kas ir nobīdīta par $+F_{IF}$ vērtību, bet trešā signālu rinda no otrā zara, kas ir nobīdīta par $-F_{IF}$ vērtību pa frekvenču koordinātu asi, pie tam katram frekvences solim atbilstošās triju rindu nolases vērtības kontrolerī tiek savstarpēji salīdzinātas un no tām tiek izvēlēta mazākā amplitūdas vērtība, ko parāda uz ekrāna.

3. Paņēmiens zemas starpfrekvences spektra analīzei, kas ietver šādus secīgus soļus:

(i) padodamā signāla - toņa ar frekvenci F_{CW} - pastiprināšanu maztrokšņojošā pastiprinātājā (LNA);

(ii) pastiprinātā signāla sajaukšanu ar ģenerators (VCO) signālu ar frekvenci F_{VCO} jaucējā (MIX), iegūstot signālu ar frekvenci $F_{MIXout} = |(F_{VCO} - F_{in})|$;

(iii) iegūtā signāla analīzes izšķirtspēju F_{LPF} un F_{HPF} uzdošanu atbilstoši zemfrekvences filtrā (LPF) un augstfrekvences filtrā (HPF), izslēdzot F_{MIXout} signālus ar frekvencēm, kas ir lielākas par F_{LPF} , mazākas par F_{HPF} un vienādas ar F_{VCO} ;

(iv) iegūtā signāla amplitūdas noteikšanu amplitūdas detektorā (DET), pie tam amplitūdas detektora izejas spriegums ir logaritmiski proporcionāls ieejas signāla amplitūdai;

(v) noteiktās signāla amplitūdas trokšņu vājināšanu videofiltrā (VF);

(vi) signāla ciparošanu analogciparu pārveidotājā (ADC);

(vii) izslēgto signālu atjaunošanu diapazonā $0 < F_{MIXout} < F_{HPF}$, salīdzinot divus blakus mērījumus ar atšķirīgām par soli f_{st} F_{VCO} vērtībām un izvēloties signālu ar lielāko amplitūdu kontrolerī, kā arī frekvenču diapazona analizēšanu, vadot pārskatājamo ģeneratoru (VCO) ar fāzes pieskaņošanas cilpas (PLL) palīdzību, pārskatējot tam frekvenci ar uzdoto soli f_{st} , pie tam F_{VCO} pārskatāšanas solis f_{st} tiek izvēlēts, lai atbilstu nevienādībai $F_{LPF} > f_{st} > 2 \times F_{HPF}$;

(viii) signāla jaudas pie attiecīgas frekvences attēlošanu uz ekrāna.

4. Paņēmiens saskaņā ar 3. pretenziju, kas pēc soļa (ii) - pastiprinātā signāla sajaukšanas ar (VCO) signālu - ietver šādus paralēlus soļus (iii) līdz (vi), kurus veic shēmas otrajā zarā:

(iii) iegūtā signāla filtrēšanu caur joslas filtru (BPF) ar centrālo frekvenci F_{IF} , kur $F_{IF} \gg F_{HPF}$;

(iv) iegūtā signāla amplitūdas noteikšanu amplitūdas detektorā (DET2), pie tam amplitūdas detektora izejas spriegums ir logaritmiski proporcionāls ieejas signāla amplitūdai;

(v) noteiktās signāla amplitūdas trokšņu vājināšanu videofiltrā (VF2);

(vi) signāla ciparošanu analogciparu pārveidotājā (ADC2);

turklāt tālāk (vii) solī kontrolerī paralēli tiek ierakstītas trīs signālu rindas, kontrolerim pārskatējot F_{VCO} pa soļiem: viena rinda no pirmā zara (ADC1), otra rinda no otrā zara (ADC2), kas ir nobīdīta par $+F_{IF}$ vērtību, trešā rinda no otrā zara (ADC2), kas ir nobīdīta par $-F_{IF}$ vērtību pa frekvenču koordinātu asi, pie tam katram frekvences solim atbilstošās triju rindu nolases vērtības tiek savstarpēji salīdzinātas un no tām tiek izvēlēta mazākā amplitūdas vērtība, ko parāda uz ekrāna solī (viii).

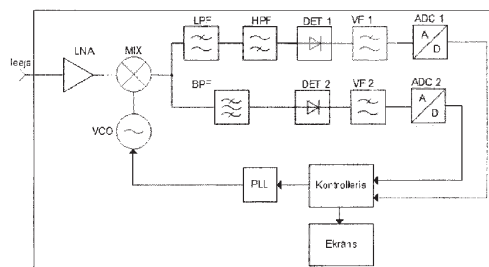


Fig. 4

(51) **A63B69/12** (11) **14865 B**
 (21) P-14-32 (22) 16.04.2014
 (45) 20.08.2014

(73) Imants UPĪTIS; Sesku iela 33, Rīga, LV-1082, LV

(72) Imants UPĪTIS (LV)

(54) **IERĪCE PELDĒŠANAS MĀCĪŠANAI, TĀS MONTĀŽAS PAŅĒMIENS UN PIELIETOŠANA**

(57) 1. Ierīce peldēšanas mācīšanai, kas raksturīga ar to, ka sastāv no divām daļām A un B, katru no kurām veido divi pludiņi 1' un 1'' un kuras savā starpā ir savienotas vismaz ar vienu elastīga materiāla šļūteni 2, kuras katrs gals ciešā sēžā ir izvadīts caur vismaz vienu apaļu plāksnīti 3, kas piekļaujas pludiņiem no augšas.

2. Ierīce saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam šļūtene 2 katrā daļā A un B ir izvadīta cauri divām plāksnītēm 3, viena no kurām piekļaujas pludiņiem no augšas, bet otra no apakšas.

3. Ierīce saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam šļūtenes 2 fiksācijai papildus ir izmantoti sprūdi 5, kas ir ievirzīti spraugā starp šļūtenes 2 āršiem un plāksnīšu 3 iekšējo malu, vai elastīgi sprūdgredzeni, kas aptver šļūteni no ārpusē.

4. Ierīce saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kurai attālums starp daļām A un B ir maināms, regulējot šļūtenes 2 posma garumu starp tām un fiksējot ar plāksnīšu 3 un sprūdu 5 palīdzību.

5. Ierīce saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kurai šļūtenes gali ir noslēgti ar vāciņiem.

6. Ierīces saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju montāžas paņēmiens, kas ietver sekojošas darbības:

- no gataviem pludiņiem 1' un 1'', tos savstarpēji savienojot izjaucamā veidā, izveidojot ierīces daļas A un B,

- izvēlēta garuma šļūteni 2 katrā galā izvelk cauri urbūmam pirmajā (apakšējā) plāksnītē 3, pēc tam izvada cauri pludiņu 1' un 1'' iekšējai starpsienai un tālāk cauri urbūmam otrajā (augšējā) plāksnītē 3 vai

- izvēlēta garuma šļūteni 2 izvada cauri pludiņu 1' un 1'' iekšējai starpsienai un tālāk cauri urbūmam augšējā plāksnītē 3,

- noregulē attālumu starp daļām A un B, tās slidinot pa šļūtenes 2 virsmu, atbilstoši trenējamās personas ķermeņa izmēriem, un nofiksē ar sprūdu palīdzību.

7. Ierīces saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai izmantotā treniņprocesā peldēšanas veidā brass, izpildot sekojošas darbības:

- pateicoties caurumiem šļūtenes galos un sprūdiem, ierīce tiek noregulēta atbilstoši mācāmā ķermeņa izmēriem;

- pēc iegremdēšanās ūdenī mācāmais novieto ierīci zem krūtīm (skat. 2. zīm.);

- pēc ieelpas galva tiek iegremdēta ūdenī, kad peldētājs aiztur elpu, izjūtot savu ķermeņa stāvokli ūdenī, vispirms tiek apgūta kāju darbība;

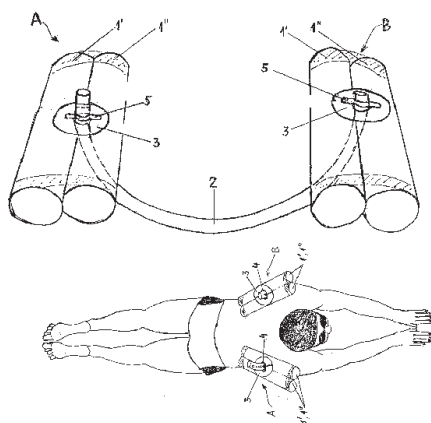
- nākošajā etapā mācāmais apgūst elpošanu un turpina pilnveidot kāju darbību;

- nākošajā peldēšanas mācīšanas etapā tiek apgūta roku darbība;

- pēc elpošanas un roku darbības apgūšanas mācāmais sāk peldēt pilnā kustību koordinācijā, no sākuma ar piedāvāto ierīci, bet vēlāk jau bez tās.

8. Ierīces saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai pielietošana, mācot peldēšanas veidus krauls uz krūtīm, krauls uz muguras un tauriņstils.

9. Ierīces saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai izmantošana ūdens aerobikas nodarbībās.



(51) **B29B17/00** (11) **14868 B**
C08J11/10

(21) P-13-206 (22) 06.12.2013
(45) 20.08.2014

(73) Igors JEVMEŅOVŠ; Jūrkalnes iela 15/25-111, Rīga, LV-1046, LV

(72) Igors JEVMEŅOVŠ (LV)

(74) Artis KROMANIS, PĒTERSONA PATENTS; p/k 61, Rīga, LV-1010, LV

(54) **METODE GUMIJAS DEVULKANIZĀCIJAI UN KATALIZATORŠIM NOLŪKAM**

(57) 1. Metode gumijas izstrādājumu, jo īpaši transportlīdzekļu gumijas riepu, devulkanizācijai, kas ietver gumijas izstrādājumu padevi mehāniskās apstrādes stacijā, kurā gumijas izstrādājumi tiek pakļauti mehāniskai apstrādei, un gumijas izstrādājumu apstrādi ar devulkanizācijas katalizatoru, turklāt gumijas izstrādājumu mehāniskā apstrāde noris vienlaicīgi ar devulkanizācijas katalizatora padevi uz minētajiem gumijas izstrādājumiem, kas raksturīga ar to, ka gumijas izstrādājumi apstrādes laikā tiek uzkarsti no 30 līdz 70 °C un devulkanizācijas katalizatora padeve uz apstrādājamiem gumijas izstrādājumiem ir cikliska.

2. Metode gumijas izstrādājumu devulkanizācijai saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka mehāniskās apstrādes stacijā gumijas izstrādājumi tiek padoti caur kaskādes veidā izvietotiem veltnu pāriem, pie kam sprauga starp dažādiem veltnu pāriem tiek konfigurēta tā, lai nodrošinātu atšķirīgus spraugu izmērus.

3. Metode gumijas izstrādājumu devulkanizācijai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka minēto veltnu rotācijas frekvence ir regulējama no 50 līdz 2000 Hz.

4. Devulkanizācijas katalizators, kas izmantojams gumijas izstrādājumu devulkanizācijā saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurš ietver 30 līdz 60 tilpuma % slāpekli saturošu vielu, 5 līdz 20 tilpuma % spriegumu nodrošinošu vielu un 10 līdz 40 tilpuma % koncentrāciju nodrošinošu vielu.

5. Devulkanizācijas katalizators saskaņā ar 4. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka slāpekli saturošā viela ir izvēlēta no grupas, kas ietver karbamīdu vai urīnvielu.

6. Devulkanizācijas katalizators saskaņā ar 4. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka spriegumu nodrošinošā viela ir cinka stearāts.

7. Devulkanizācijas katalizators saskaņā ar 4. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka koncentrāciju nodrošinošā viela ir izvēlēta no grupas, kas ietver steatītu vai talku.

(51) **C04B38/00** (11) **14870 B**

(21) P-14-28 (22) 21.03.2014
(45) 20.08.2014

(73) RĪGAS TEHNISKĀ UNIVERSITĀTE; Kaļķu iela 1, Rīga, LV-1658, LV

(72) Ruta ŠVINKA (LV),
Visvaldis ŠVINKA (LV),

Oskars LEŠČINSKIS (LV),

Līga DABARE (LV)

(54) **KERAMISKĀ SORBENTA IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS**

(57) 1. Keramiskā sorbenta no mālu izejvielām, kuras satur Fe_2O_3 un TiO_2 , un izdegošas piedevas, iegūšanas paņēmieni, kas ietver izejvielu sajaukšanu, granulā veidošanu, žāvēšanu un termisko apstrādi, atšķiras ar to, ka iegūto keramisko sorbentu (granulātu) pēc termiskās apstrādes apstāro ar jonizējošu starojumu.

2. Keramiskā sorbenta iegūšanas paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju atšķiras ar to, ka izejvielu termisko apstrādi veic gaisā temperatūras diapazonā no 800 līdz 1050 °C.

3. Keramiskā sorbenta iegūšanas paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju atšķiras ar to, ka apstārošanu veic elektronu plūsmā ar starojuma dozu 5 MGy.

(51) **C10L1/02** (11) **14871 B**
C09F7/10

(21) P-14-25 (22) 12.03.2014

(45) 20.08.2014

(73) RĪGAS TEHNISKĀ UNIVERSITĀTE; Kaļķu iela 1, Rīga, LV-1658, LV

(72) Jānis BRINKS (LV),
Kristaps MĀLIŅŠ (LV),
Valdis KAMPARS (LV)

(54) **SULFURĒTAS OGLEKĻA MATRICES KATALIZATORA SINTĒZES PAŅĒMIENS UN IZMANTOŠANA BIODZĒL-DEGVIELAS IEGŪŠANAI**

(57) 1. Sulfurētās oglekļa matricē katalizatora sintēzes paņēmieni, kas ietver karbonizācijas un sulfurēšanas reakcijas, kas atšķiras ar to, ka karbonizācijas un sulfurēšanas reakcijas tiek veiktas vienlaicīgi, turklāt par izejvielām izmanto koncentrētu sērskābi un celulozi ar masas attiecību 5:1 līdz 30:1, ieteicamāk 15:1 līdz 25:1, un karbonizācijas-sulfurēšanas stadiju veic 50 līdz 180 °C, ieteicamāk 80 līdz 120 °C temperatūrā 60 līdz 600 minūtes, ieteicamāk 150 līdz 210 minūtes.

2. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju atšķiras ar to, ka sērskābe pirms celulozes ievadīšanas tiek uzkarstēta līdz karbonizācijas-sulfurēšanas stadijas temperatūrai.

3. Sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 1. vai 2. pretenzijas, kas atšķiras ar to, ka pēc mazgāšanas ar ūdeni katalizators tiek mazgāts ar organiskajiem šķīdinātājiem, piemēram, etilacetātu, tetrahidrofurānu, toluolu vai citu.

4. Sulfurētās oglekļa matricē katalizators, kas iegūts ar sintēzes paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas ietver mezoporainu amorfu ogles matrici ar kovalenti saistītām sulfoskābes grupām, kas atšķiras ar sulfoskābes grupu blīvumu no 0,4 līdz 1,1 mmol/g, pKa vērtību no -11 līdz -6, daļiņu izmēru no 1 līdz 80 mikrometri, īpatnējo virsmas laukumu 1,1 līdz 1,5 m²/g, porainību 0,004 līdz 0,005 cm³/g, vidējo poru rādiusu 6 līdz 7 Å.

5. Katalizatora saskaņā ar 4. pretenziju pielietojums, kur esterifikācijas reakcijā izmanto taukskābes un spirtus, ieteicamāk metanolu vai etanolu.

(51) **F25B21/02** (11) **14876 B**

F25B27/00
H01H35/30

(21) P-12-180 (22) 28.11.2012

(45) 20.08.2014

(73) Marks GINOVKERS; Salnas iela 9-30, Rīga, LV-1021, LV;
Vladislavs DREMAKOVŠ; Salnas iela 9-30, Rīga, LV-1021, LV

(72) Marks GINOVKERS (LV),
Vladislavs DREMAKOVŠ (LV)

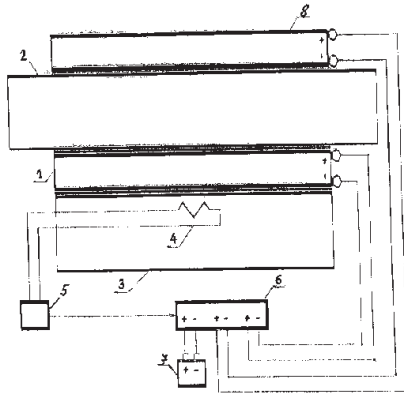
(74) Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra INTELS Latvija;
Akadēmijas laukums 1, Rīga, LV-1050, LV

(54) **CIETVIELAS SATUROŠA SOLĀRĀ DZESĒŠANAS IEKĀRTA**

(57) 1. Cietvielas saturoša solārā dzesēšanas iekārta, kas satur Peltjē tipa dzesēšanas elementu, kura viena puse savienota ar virsmas siltās puses plāti, bet otra puse savienota ar virsmas aukstās puses plāti, uz kuras izvietots termistors, pie kam termistora izeja

savienota ar temperatūras regulatora ieeju, kura izeja savienota ar saules enerģijas regulatora pirmo ieeju, bet Peltjē tipa dzesēšanas elementa izeja savienota ar saules enerģijas regulatora otro ieeju, pie tam saules enerģijas regulatora izeja savienota ar baterijas ieeju,

kas atšķiras ar to, ka dzesēšanas iekārta papildus satur solāro paneli, kura aktīvā puse ir vērsta pret sauli, bet pasīvā puse piestiprināta pie virsmas siltās puses plates, pie kam solārā paneļa izeja savienota ar saules enerģijas regulatora trešo ieeju.



(51) **H01L31/02** (11) **14879 B**
H01L31/04

(21) P-13-179 (22) 13.11.2013
(45) 20.08.2014

(73) LATVIJAS UNIVERSITĀTES CIETVIELU FIZIKAS INSTITŪTS; Ķengaraga iela 8, Rīga, LV-1063, LV

(72) Ivars TĀLE (LV),
Boriss POĻAKOVS (LV),
Jeļena BUTIKOVA (LV),
Pēteris KŪLIS (LV),
Guntis MĀRCIŅŠ (LV)

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

(54) **AMORFA SI SLĀŅU LĀZERKRISTALIZĀCIJAS PAŅĒMIENS MIKRO-SI UN POLI-SI SAULES ŠŪNU IEGŪŠANAI**

(57) 1. Paņēmiens mikro-Si un poli-Si saules šūnu iegūšanai, kas ietver amorfa silīcija slāņu uzklāšanu uz pamatnes, amorfa silīcija slāņu lāzera kristalizāciju un slāņu virsmas metalizāciju, kas raksturīgs ar to, ka:

uz pamatnes tiek uzklāti slāņi ar kopēju biezumu vismaz 1,5 μm, pie kam: pirmais slānis ir p-dopēts amorfa silīcija slānis, kas vienlaicīgi veido saules šūnas kolektora slāni un optiski caurspīdīgu elektrodu; nākamie slāņi ir nedopēti amorfa silīcija slāņi vai p-dopēti amorfa silīcija slāņi, kas veido saules šūnas absorbera slāni un saules šūnas emitera slāni, tad tiek veikta mikro-Si saules šūnas visu amorfa silīcija slāņu vienlaicīga lāzera kristalizācija, kurā graudu izmēri ir mazāki par slāņu biezumu; turklāt poli-Si saules šūnas ietver visu amorfa silīcija slāņu vienlaicīgu kušanu un rekristalizāciju, kas pārsniedz slāņu biezumu, sekojošu kolektora un emitera slāņu formēšanu ar impulsu lāzera kūli, tos attiecīgi dopējot ar boru un fosforu, un gaismu reflektējošu elektrisko metāla kontaktslāņu uznešanu.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju poli-Si saules šūnas iegūšanai no mikro-Si slāņiem uz borsilikāta stikla pamatnes virsmas, kas ietver sekojošus soļus: (i) a-Si slāņu paketes uzklāšanu, kas paredz: (a) elektrovadoša, optiski caurspīdīga SnO₂:F kontaktslāņa uzklāšanu uz pamatnes virsmas (31) pēc PECVD tehnoloģijas; (ii) p⁺-leģēta a-Si silīcija slāņa uzklāšanu uz pamatnes virsmas pēc PECVD tehnoloģijas saules šūnas kolektoram un caurspīdīgam kontaktam; (iii) neleģēta (i[']) a-Si slāņa uzklāšanu uz pirmā slāņa pēc PECVD tehnoloģijas saules šūnas absorbera un emitera formēšanai (33) ar biezumu no 800 nm līdz 1000 nm, pie kam poli-Si slāni iegūst: (a) ar lineāri fokusētu CW 800 nm lāzera kūli skenējot a-Si slāņa ārējo virsmu ar ātrumu, kas atbilst kristalizācijai nepieciešamās enerģijas blīvumam 40 līdz 50 J/cm², vai (b) ar lineāri fokusētu 512 nm YAG 10 kHz impulsu lāzera ar maināmu

impulsa garumu līdz 1500 ns a-Si slāņa ārējo virsmu skenējot ar ātrumu, kas atbilst kristalizācijai nepieciešamās enerģijas blīvumam 2 līdz 3 J/cm², pie kam: p⁺ tipa poli-Si kolektora leģēšanu veic, skenējot kolektora slāni caur bora silikāta stikla pamatni ar 355 nm Nd-YAG nanosekunžu impulsu lāzera kūli; lāzera kūļa skenēšanas ātrums atbilst absorbētās enerģijas blīvumam 200 līdz 300 nJ/cm², turklāt: n⁺ emitera slāņa iegūšanu veic, fosfora nitrīdu (PN) uzklājot uz poli-Si slāņa augšējās virsmas emitera slāņa formēšanai; ar fosforu leģētu emitera slāni iegūst PN slāni skenējot ar Nd-YAG ns-impulsu kūli, pie tam kūļa skenēšanas ātrums atbilst absorbētās enerģijas blīvumam 200 līdz 300 nJ/cm²; emitera slāni ar atklātu augšējo virsmu iegūst, izšķīdinot minēto PN slāni destilētā ūdenī pie temperatūras 80 līdz 90 °C, un gaismu atstarojoši metāliski Al vai Ag kontaktslāņi tiek termiski uzklāti, uzklājot uz emitera un kolektora SnO₂ interfeisa slāni uz borsilikāta stikla pamatnes.

3. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam: tiek veikta a-Si slāņu paketes lāzera kristalizācija ar kristalizācijas enerģiju 260 līdz 300 mJ/cm²; mikro-Si slāņu pakete tiek iegūta, skenējot a-Si paketes ārējo virsmu ar Q-komutēta Nd-YAG nanosekunžu lāzera otrās 512 nm harmonikas impulsiem ar enerģiju 0,9 mJ un atkārtotās frekvenci 1 kHz; gaismu atstarojošie Al vai Ag kontaktslāņi tiek termiski uzklāti uz emitera slāņa un uz kolektora slāņa slejas ārpus saules šūnas fotoaktīvās virsmas.

4. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam mikro-Si vai poli-Si saules šūnas iegūšanai a-Si uzklāšanas temperatūra ir no 150 līdz 200 °C.

5. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam: kolektora slānis ir ar biezumu no 30 nm līdz 50 nm un leģēšanas līmenī tam ir no 10¹⁹ līdz 2x10²² cm⁻³ dopanta atomu; absorbera slāņa biezums ir no 500 nm līdz 1000 nm, tas ir neleģēts (i) vai leģēts līdz līmenim no 10¹⁵ līdz 10¹⁸ cm⁻³, ir homogēns vai pakāpeniski samazināts līdz emitera slānim; emitera slāņa biezums no 20 līdz 70 nm un leģēšanas līmenī tam ir no 10¹⁹ līdz 2x10²² cm⁻³ dopanta atomu.

(51) **H02K19/10** (11) **14880 B**
H02K7/09

(21) P-14-38 (22) 09.05.2014
(45) 20.08.2014

(73) FIZIKĀLĀS ENERĢĒTIKAS INSTITŪTS; Aizkraukles iela 21, Rīga, LV-1006, LV

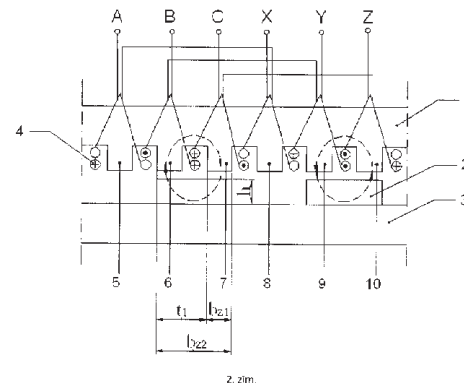
(72) Vladislavs PUGAČEVŠ (LV),
Nikolajs LEVINS (LV),
Svetlana ORLOVA (LV),
Jānis DIRBA (LV)

(54) **PĀRSLĒDZAMS RELAKTANCES DZINĒJS**

(57) 1. Pārslēdzams relaktances dzinējs, kas satur statoru ar zobiem, uz kuriem novietotas trīsfāžu tinuma spoles, un zobotu rotoru bez tinuma, kas atšķiras ar to, ka, ar mērķi palielināt īpatnējo jaudu, rotora zobi ir izveidoti kā savā starpā magnētiski nesaisīti segmenti, kas novietoti uz nemagnētiska rotora ieliktna, turklāt to augstums h vienāds ar statora zobu platumu b_{z1} , bet rotora zobu platumu b_{z2} nosaka sakarība

$$b_{z2} = t_1 + b_{z1}$$

kurā t_1 ir statora zobu iedaļa.



Uz Latviju attiecināto Eiropas patentu publikācijas

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

Publikācijas sakārtotas Eiropas patentu numuru kārtībā.

- (51) **C07K 14/705^(2006.01)** (11) **1149114**
C12N 15/00^(2006.01)
C07K 16/28^(2006.01)
- (21) 00907027.7 (22) 27.01.2000
(43) 31.10.2001
(45) 02.04.2014
(31) 244448 (32) 03.02.1999 (33) US
264527 08.03.1999 US
(86) PCT/US2000/001871 27.01.2000
(87) WO 2000/046240 10.08.2000
(73) AMGEN INC., One Amgen Center Drive, Thousand Oaks, CA 91320-1799, US
(72) YOSHINAGA, Steven, Kiyoshi, US
(74) Grünecker, Kinkeldey, Stockmair & Schwanhäusser, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **IMŪNAJĀ ATBILDES REAKCIJĀ IESAISTĪTI POLIPEPTĪDI POLYPEPTIDES INVOLVED IN IMMUNE RESPONSE**
- (57) 1. Izolēta nukleīnskābes molekula, kas satur nukleoīdu sekvenci, kas ir izvēlēta no:
a) nukleoīdu sekvenču, kā parādīts Fig. 12A (SEQ ID NO: 16),
b) nukleoīdu sekvenču, kas kodē Fig. 12A (SEQ ID NO: 17) parādīto polipeptīdu no 1. līdz 302. atlikumam vai no 19. līdz 302., no 20. līdz 302., no 21. līdz 302., no 22. līdz 302., no 24. līdz 302. vai no 28. līdz 302. atlikumam, vai
c) nukleoīdu sekvenču, kas ir komplementāra jebkurai no (a) un (b).
2. Nukleīnskābes molekula saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt nukleoīdu sekvence ir funkcionēspējīgi saistīta ar ekspresiju regulējošu sekvenci.
3. Saimniekšūna, kas satur 2. pretenzijas nukleīnskābes molekulu.
6. Paņēmiens 1. vai 2. pretenzijas nukleīnskābes kodēta polipeptīda ražošanai, kas ietver 3. pretenzijas saimniekšūnu kultūras kultivēšanu piemērotā barotnē un polipeptīda izdalīšanu no kultūras.
7. Polipeptīds, kas iegūts ar 6. pretenzijas paņēmienu.
8. Polipeptīds, kas ir kodēts ar 1. pretenzijas nukleīnskābes molekulu.
9. Izolēts polipeptīds, kas satur aminoskābju sekvenci, kas ir izvēlēta no:
a) aminoskābju sekvenču, kā parādīts Fig. 3A (SEQ ID NO: 12) vai Fig. 12A (SEQ ID NO: 17), vai
b) nobriedušas aminoskābju sekvenču, kā parādīts Fig. 3A (SEQ ID NO: 12), kas satur nobriedušu aminoterminālo galu pie jebkura no 19., 20., 21., 22., 24. vai 28. atlikuma, vai Fig. 12A (SEQ ID NO: 17), kas satur nobriedušu aminoterminālo galu pie jebkura no 19., 20., 21., 22., 24. vai 28. atlikuma.
10. Antiviela vai tās fragments, kas saistās ar 7. pretenzijas polipeptīdu.
17. Kompozīcija, kas satur 7., 8. vai 9. pretenzijas polipeptīdu un farmaceitiski pieņemamu nesēju, adjuvantu, solubilizatoru, stabilizatoru vai antioksidantu.
18. Polipeptīds saskaņā ar 7., 8. vai 9. pretenziju, kas ir ticis ķīmiski modificēts.
19. Polipeptīds saskaņā ar 18. pretenziju, kas ir ticis ķīmiski modificēts, pievienojot vienu vai vairākus ūdenī šķīstošus polimērus.
20. Sapludināts polipeptīds, kas satur 7., 8. vai 9. pretenzijas polipeptīdu, kas ir sapludināts ar heterologu aminoskābju sekvenci.
22. Polipeptīda saskaņā ar 7., 8. vai 9. pretenziju izmantošana medikamenta gatavošanai T šūnu pastarpināta traucējuma ārstēšanai, profilaksei vai stāvokļa uzlabošanai tā gadījumā.

23. Metode T šūnu pastarpināta traucējuma vai uzņēmības pret T šūnu pastarpinātu traucējumu diagnosticēšanai dzīvniekam, kas ietver:

- a) 7., 8. vai 9. pretenzijas polipeptīda ekspresijas esamības vai tās daudzuma noteikšanu un
b) T šūnu pastarpinātā traucējuma vai uzņēmības pret T šūnu pastarpināto traucējumu diagnosticēšanu, balstoties uz polipeptīda ekspresijas esamību vai tās daudzumu.

24. Metode testa molekulas, kas saistās ar 7., 8. vai 9. pretenzijas polipeptīdu, identificēšanai, kas ietver:

- a) 7., 8. vai 9. pretenzijas polipeptīda pakļaušanu kontaktam ar testa molekulu un
b) polipeptīda un testa molekulas saistīšanās pakāpes noteikšanu.

26. Nukleīnskābes molekulas saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošana medikamenta gatavošanai T šūnu aktivācijas vai proliferācijas regulēšanai dzīvniekam.

27. Transgēns zīdītājs, kurš nav cilvēks, kas satur 2. pretenzijas nukleīnskābes molekulu.

28. Antagonista izmantošana medikamenta gatavošanai imūnās atbildes reakcijas nomākšanai dzīvniekam, turklāt antagonists ir anti viela vai tās fragments, kas saistās ar 7., 8. vai 9. pretenzijas polipeptīdu.

29. Polipeptīds saskaņā ar 7., 8. vai 9. pretenziju T šūnu pastarpināta traucējuma ārstēšanai, profilaksei vai stāvokļa uzlabošanai tā gadījumā.

30. Nukleīnskābes molekula saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju lietošanai T šūnu aktivācijas vai proliferācijas regulēšanā dzīvniekam.

31. Antagonists imūnās atbildes reakcijas nomākšanai dzīvniekam, turklāt antagonists ir anti viela vai tās fragments, kas saistās ar 7., 8. vai 9. pretenzijas polipeptīdu.

32. Izmantošana saskaņā ar 28. pretenziju autoimūnu traucējumu ārstēšanai.

33. Antagonists saskaņā ar 31. pretenziju lietošanai autoimūnu traucējumu ārstēšanā.

34. Izmantošana saskaņā ar 32. pretenziju vai antagonists saskaņā ar 33. pretenziju, turklāt autoimūnais traucējums ir kāds no reimatoīdā artrīta, psoriāzes, multiplās sklerozes, diabēta un sistēmiskās sarkanās vilkēdes.

35. Antagonista izmantošana medikamenta gatavošanai hroniskas iekaisuma slimības ārstēšanai, turklāt antagonists ir anti viela vai tās fragments, kas saistās ar 7., 8. vai 9. pretenzijas polipeptīdu.

- (51) **A01F 15/07^(2006.01)** (11) **1370128**
A01F 15/08^(2006.01)
- (21) 02713164.8 (22) 22.03.2002
(43) 17.12.2003
(45) 26.02.2014
(31) 20010286 (32) 22.03.2001 (33) IE
20010678 19.07.2001 IE
(86) PCT/IE2002/000037 22.03.2002
(87) WO 2002/076183 03.10.2002
(73) Welmount Limited, Kilmaine, County Mayo, IE
(72) MCHALE, Padraic Christopher, IE
MCHALE, Martin, William, IE
HEANEY, James John, IE
SHERIDAN, Gerard Patrick, IE
O'CONNOR, Patrick Thomas, IE
BIGGINS, John Patrick, IE
- (74) Gorman, Francis Fergus, F. F. Gorman & Co., 15 Clanwilliam Square, Dublin 2, IE
Valentīna SEGEJEVA, a/k 16, Rīga, LV-1083, LV
- (54) **ĶĪPAS FORMĒTĀJS KOMBINĀCIJĀ AR ĶĪPAS IESAIŅOTĀJU**
A COMBINED BALER/BALE WRAPPER
- (57) 1. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, lai formētu un aptītu sienu, salma u.tml. materiāla ķīpu ar iesaiņojamo materiālu, pie kam ķīpas formētājs/iesaiņotājs (1, 70) satur: ķīpas formētāju (10), kurā ir ķīpas formēšanas kamera (15), pie tam ķīpas formēšanas kamera (15) būtībā ir cilindriska un definē iekšējo riņķveida perifēriju, un tās galvenā centrālā ģeometriskā ass ir vērsta būtībā horizontāli; ķīpas iesaiņošanas (resp., aptīšanas)

līdzekli (11), kas saņem ķīpu no formētāja, lai to iesaiņotu; pārvietošanas līdzekli (19) ķīpas pārvietošanai no formētāja (10) uz ķīpas iesaiņošanas līdzekli (11),

kas raksturīgs ar to, ka ķīpas pārvietošanas līdzeklis (19) satur formētāja (10) apakšējo daļu (19), un ar to, ka apakšējā ķīpas formētāja (10) daļa (19) ir pārvietojama ķīpas formēšanas kamerā (15) no ķīpas formēšanas pozīcijas, kas mijiedarbojas ar formētāju (10), lai norobežotu (konturētu) ķīpas formēšanas kameru (15), uz ķīpas izvades pozīciju, lai pārvietotu ķīpu galvenokārt virzienā uz augšu ārā no ķīpas formēšanas kameras (15) un to novietotu uz ķīpas iesaiņošanas līdzekļa (11).

2. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 1. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka ķīpas formētājs (10) ir nostiprināts pie formētāja kameras.

3. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 1. vai 2. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka ķīpas formētāja (10) pārvietojamā apakšējā daļa (19), kas veido pārvietošanas līdzekli (19), ir uzmontēta šarnīrveidā rotācijai ap pirmo šarnīra asi (35), kas ir paralēla galvenajai centrālajai asij (16), ko veido ķīpas formēšanas kamera (15), pie tam ķīpas formētāja (10) pārvietojamā apakšējā daļa (19) ir pagriežama starp ķīpas formēšanas pozīciju un ķīpas izvades pozīciju ap pirmo šarnīra asi (35), lai izgāztu ķīpu no ķīpas formēšanas kameras (15) uz ķīpas iesaiņošanas līdzekļa (11).

4. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 3. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka ķīpas formētāja (10) pārvietojamā apakšējā daļa (19), kas veido pārvietošanas līdzekli (19), plešas apkārt ķīpas formēšanas kameras (15) riņķveida perifērijai leņķiskā attālumā robežās no 50 līdz 160 °C.

5. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 3. vai 4. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka ķīpas formētāja (10) augšējā daļa (20) ir pārvietojama no ķīpas formēšanas mijiedarbības pozīcijas ar ķīpas formēšanas kameru (15) uz ķīpas izvades pozīciju, kas veido ar ķīpas formētāju (10) vaļēju atveri uz ķīpas formēšanas kameru (15), lai atvieglotu ķīpas pārvietošanu no ķīpas formēšanas kameras (15) un to novietotu uz ķīpas iesaiņošanas līdzekļa (11).

6. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 5. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka ķīpas formētāja (10) pārvietojamā augšējā daļa (20), kura ir pārvietojama no ķīpas formēšanas pozīcijas uz ķīpas izvades pozīciju, viscaur plešas apkārt ķīpas formēšanas kameras (15) riņķveida perifērijai leņķiskā attālumā līdz 180°.

7. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 6. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka ķīpas formētāja (10) pārvietojamā augšējā daļa (20) satur lokveida segmentu (20), kas definē ķīpas formēšanas kameras (15) riņķveida perifērijas augšējo daļu.

8. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts jebkurā no 5. līdz 7. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka ķīpas formētāja (10) pārvietojamā augšējā daļa (20) ir uzmontēta šarnīrveidā rotācijai ap otro šarnīra asi (40), kas ir paralēla galvenajai centrālajai asij (16), ko veido ķīpas formētāja kamera (15), un ir pagriežama galvenokārt augšupejošā virzienā ap otro šarnīra asi no ķīpas formēšanas pozīcijas uz ķīpas izvades pozīciju.

9. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 8. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka pirmā un otrā šarnīru atbilstošās assis (35, 40) ir novietotas tuvu ķīpas formēšanas kameras (15) riņķveida perifērijai.

10. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 8. vai 9. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka pirmā un otrā šarnīru atbilstošās assis (35, 40) ir telpiski distancētas viena no otras vismaz par 180° apkārt ķīpas formēšanas kameras (15) galvenajai centrālajai asij (16).

11. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts jebkurā no 8. līdz 10. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka pirmā šarnīra ass (35) ir novietota lokā, kas plešas ne vairāk kā 30° virs un ne mazāk kā 60° zem horizontālās plaknes (46), kura satur ķīpas formēšanas kameras (15) galveno centrālo asi (16).

12. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts jebkurā no 5. līdz 11. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka ķīpas formētāja (10) pārvietojamās augšējās daļas (19, 20) ir secīgi darbināmas starp augšējo ķīpas formēšanas pozīciju un ķīpas izvades pozīciju, un līdz ar to pārvietojamās augšējās daļas (20) kustība no ķīpas formēšanas pozīcijas uz izvades po-

zīciju iesākas pirms pārvietojamās apakšējās daļas (19) kustības no ķīpu formēšanas pozīcijas.

13. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts jebkurā no 5. līdz 12. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka ķīpas formētājs (10) satur stacionāru lokveida segmentu (18), kas norobežo daļu no ķīpas formēšanas kameras (15) un kas plešas gar ķīpas formēšanas kameras (15) iekšējo riņķveida perifēriju starp ķīpas formētāja (10) pārvietojamo augšējo daļu un apakšējo daļu, kuras minētas attiecīgi kā daļas (19, 20).

14. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts jebkurā no iepriekšējām pretenzijām, raksturīgs ar to, ka ķīpas formētāja (10) pārvietojamā apakšējā daļa (19), kas formē pārvietošanas līdzekli (19), satur apakšējo lokveida segmentu (19), kas ierobežo daļu no ķīpas formēšanas kameras (15) riņķveida perifērijas.

15. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts jebkurā no iepriekšējām pretenzijām, raksturīgs ar to, ka ķīpas formētājs (10) un ķīpas iesaiņotājs (11) ir uzmontēti uz šasijas (5), kura definē galveno longitudinālo asi (8), kas stiepjas gar šasiju (5) tās vispārējās kustības virzienā uz priekšu.

16. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 15. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka galvenā centrālā ass (16), ko definē ķīpas formēšanas kamera (15), stiepjas transversāli attiecībā pret galveno centrālo longitudinālo asi (8), ko definē šasija (5).

17. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 15. vai 16. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka ķīpas iesaiņošanas līdzeklis (11) ir divasu ķīpas ietīšanas materiāla padeves līdzeklis (54), lai uzklātu ietīšanas materiālu uz ķīpas un to iesaiņotu, pie kam ķīpa tiek rotēta ap pirmo iesaiņošanas asi (53), un ietīšanas materiāla padeves līdzeklis (54) tiek rotēts ap otro iesaiņošanas asi (56) zem leņķa, attiecībā pret pirmo iesaiņošanas asi (53), lai iesaiņošanas materiālu uzklātu uz ķīpas un to iesaiņotu.

18. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 17. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka ķīpas iesaiņošanas līdzeklis (11) satur ķīpas atbalsīšanas līdzekļus (50a, 50b), lai saņemtu izveidoto ķīpu no ķīpas formētāja (10) un lai rotētu ķīpu ap pirmo iesaiņošanas asi (53), kura ir paralēla galvenajai centrālajai asij (16), kuru definē ķīpas formēšanas kamera (15) un kura būtībā sakrīt ar ķīpas centrālo ģeometrisku asi, pie tam: iesaiņošanas materiāla padeves līdzeklis (54) satur vismaz vienu iesaiņošanas materiāla sadalītāju (54); tā nesējīdzeklis definē pārvietošanās līkni apkārt otrajai aptīšanas asij (56), lai uzklātu iesaiņošanas materiālu uz ķīpas un to ietītu vienlaicīgi ar ķīpas rotēšanu ap pirmo ietīšanas asi (53), kā arī lai izraisītu iesaiņošanas materiāla vilkšanu no vismaz viena iesaiņošanas materiāla sadalītāja (54) un tā uztīšanu uz ķīpas.

19. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 18. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka pārvietošanās līkne, ko definē nesējīdzeklis (55), atrodas vertikālā plaknē.

20. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 18. vai 19. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka pārvietošanās līkne, ko definē nesējīdzeklis (55), atrodas plaknē, kura plešas transversāli attiecībā pret galveno centrālo longitudinālo asi (8).

21. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts jebkurā no 18. līdz 20. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka nesējīdzeklis (55) ir rotējams ap otro ietīšanas asi (56), lai vismaz vienu iesaiņošanas materiāla padeves līdzekli (54) rotētu ap otro iesaiņošanas asi (56) tā kustības laikā pa minēto pārvietošanās līkni.

22. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts jebkurā no 18. līdz 21. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka iesaiņošanas materiāla padeves līdzekli (54) pāris ir novietots uz nesējīdzekļa (55) telpiski distancētās pozīcijās apkārt tā pārvietošanās līknei, ko definē nesējīdzeklis (56).

23. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts jebkurā no 18. līdz 22. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka nesējīdzeklis (55) satur nesējgredzenu (55), kas ir rotējams ap otro iesaiņošanas asi (56).

24. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 23. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka nesējgredzens (55) plešas būtībā vertikālā plaknē.

25. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts jebkurā no 18. līdz 24. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka

ķīpas balstlīdzekļi (50a, 50b) satur pirmo ķīpas balstrulli (50a) un otro ķīpas balstrulli (50b), kas ir paralēls pirmajam ķīpas balstlīdzeklim (50a) un ir telpiski no tā distancēts, lai uz tā novietotu un balsītu ķīpu un to rotētu ap iesaiņošanas asi (53), pie tam: pirmais un otrais ķīpas balstrulli (50a, 50b) ir rotējami ap to atbilstošajām ģeometriskajām asīm (52), lai ķīpu rotētu ap pirmo ietīšanas asi (53); ķīpas balstrulli (50a, 50b) atbilstošās ģeometriskās asis (52) stiepjas paralēli galvenajai centrālajai asij (16), ko definē ķīpas formēšanas kamera (15).

26. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 25. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka pirmais ķīpas balstrullis (50a) atrodas blakus ķīpas formētājam (10).

27. Ķīpas formētājs kombinācijā ar ķīpas iesaiņotāju, kā tas ir definēts 25. vai 26. pretenzijā, raksturīgs ar to, ka otrais ķīpas balstrullis (50b) ir pārvietojams uz leju no ķīpas ietīšanas pozīcijas, lai atvieglotu iesaiņotas ķīpas izvadi no ķīpas balstlīdzekļiem (50a, 50b).

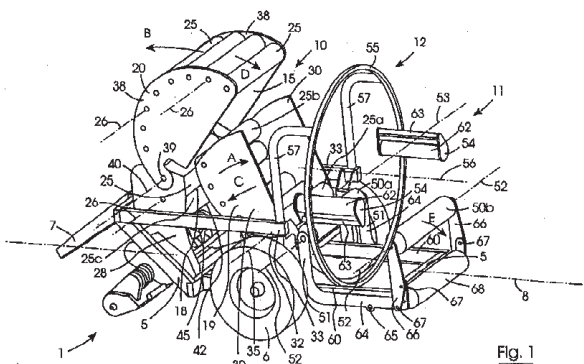


Fig. 1

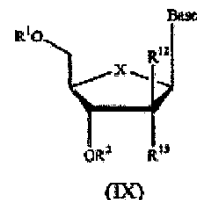
- (51) **C07H 19/06**^(2006.01) (11) **1523489**
C07H 19/10^(2006.01)
C07H 19/16^(2006.01)
C07H 19/20^(2006.01)
C07H 19/04^(2006.01)
C07H 19/044^(2006.01)
C07H 19/048^(2006.01)
C07H 19/052^(2006.01)
C07H 19/056^(2006.01)
C07H 19/12^(2006.01)
C07H 19/14^(2006.01)
C07H 19/22^(2006.01)
C07H 19/23^(2006.01)
A61K 31/7056^(2006.01)
A61K 31/706^(2006.01)
A61K 31/7064^(2006.01)
A61P 31/14^(2006.01)
- (21) 03761744.6 (22) 27.06.2003
(43) 20.04.2005
(45) 12.03.2014
(31) 392350 P (32) 28.06.2002 (33) US
392351 P 28.06.2002 US
466194 P 28.04.2003 US
470949 P 14.05.2003 US
(86) PCT/IB2003/003246 27.06.2003
(87) WO 2004/002999 08.01.2004
(73) IDENIX Pharmaceuticals, Inc., 320 Bent Street, Floor 4, Cambridge, MA 02141, US
CENTRE NATIONAL DE LA RECHERCHE SCIENTIFIQUE (CNRS), 3, rue Michel-Ange, 75794 Paris Cedex 16, FR
UNIVERSITA DEGLI STUDI DI CAGLIARI, Dip. Biologia Sperimentale, Sezione di Microbiologia, Citt. 09042 Monserrato, IT
L'Université Montpellier II, 2, Place Eugène Bataillon, 34095 Montpellier Cedex 5, FR
(72) SOMMADOSSI, Jean-Pierre, US
LA COLLA, Poalo, IT
STORER, Richard, GB
GOSSELIN, Gilles, FR

(74) Savic, Bojan, et al, Jones Day Rechtsanwältte Attorneys-at-Law Patentanwälte, Prinzregentenstraße 11, 80538 München, DE

Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA, Tomsona iela 24-15, Rīga, LV-1013

(54) **MODIFICĒTAS 2' UN 3'-NUKLEOZĪDA PRIEKŠTEČZĀLES FLAVIVĪRUSU INFEKCIJU ĀRSTĒŠANAI MODIFIED 2' AND 3'-NUCLEOSIDE PRODRUGS FOR TREATING FLAVIVIRIDAE INFECTIONS**

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



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kurā:

R¹ un R² neatkarīgi ir H; fosfāts; saistīta taisna, sazarota vai cikliska alkilgrupa; acilgrupa; CO-alkilgrupa; CO-arilgrupa; CO-alkoksialkilgrupa; CO-ariloksialkilgrupa; CO-aizvietota arilgrupa; sulfonātestera grupa; benzilgrupa, kurā fenilgrupa neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem; alkilsulfonilgrupa; arilsulfonilgrupa; aralkilsulfonilgrupa; lipīds; aminoskābe; ogļhidrāta grupa; peptīds; vai holesterīns;

X ir O;

"Bāze*" ir purīna vai pirimidīna bāze;

R¹² ir C(Y³)₃;

Y³ ir H; un

R¹³ ir fluora atoms.

6. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izmantošanai paņēmienu saimnieka, kas inficēts ar *Flaviviridae* vīrusu, ārstēšanai.

7. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 6. pretenziju, kurā vīruss ir C hepatīts.

8. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 6. pretenziju, kurā paņēmiens ietver savienojuma vai tā farmaceutiski pieņemama sāls ievadīšanu kombinācijā vai pārmaiņus ar otru antivirālo līdzekli; vai kurā paņēmiens ietver savienojuma vai tā farmaceutiski pieņemama sāls ievadīšanu kombinācijā vai pārmaiņus ar otru vai vairākiem antivirāliem līdzekļiem.

9. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 8. pretenziju, kurā otrs antivirālais līdzeklis ir izvēlēts no grupas, kura sastāv no interferona, ribavirīna, interleikīna, NS3 proteāzes inhibitora, cisteīna proteāzes inhibitora, fenantirēhinona, tiazolidīna atvasinājuma, tiazolidīna, benzaniīda, helikāzes inhibitora, polimerāzes inhibitora, nukleotīda analoga, gliotoksīna, cerulenīna, antisensa oligodezoksīnukleotīda fosfortioāta, IRES-atkarīgas translācijas inhibitora un ribozīma.

12. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 6. pretenziju, kurā savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls ir devas vienības formā.

14. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 12. pretenziju, kurā devas vienība ir tablete vai kapsula.

15. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 6. pretenziju, kurā saimnieks ir cilvēks.

16. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 6. pretenziju, kurā savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls būtībā ir tīrā formā.

21. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 6. pretenziju, kurā nesējā satur iedarbīgu daudzumu, lai ārstētu *Flaviviridae* infekciju, savienojuma vai tā farmaceutiski pieņemama sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai.

22. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 21. pretenziju, kurā nesējs ir piemērots perorālai ievadīšanai.

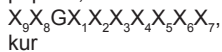
23. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 21. pretenziju, kas satur iedarbīgu savienojuma vai tā farmaceutiski pieņemama sāls daudzumu, lai ārstētu saimnieku, kas inficēties ar Rietumnilas vīrusu, dzelteno drudzi, tropu drudža vīrusu vai BVDV.

28. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 21. pretenziju, kas papildus satur otru antivirālu līdzekli; vai kas papildus satur otru vai vairākus antivirālus līdzekļus.

- (51) **A61K 38/18**^(2006.01) (11) **1542714**
 (21) 03759345.6 (22) 18.09.2003
 (43) 22.06.2005
 (45) 02.04.2014
 (31) 411779 P (32) 18.09.2002 (33) US
 411700 P 18.09.2002 US
 (86) PCT/US2003/029701 18.09.2003
 (87) WO 2004/026332 01.04.2004
 (73) Janssen Pharmaceuticals, Inc., 1125 Trenton-Harbourton Road, Titusville, NJ 08560, US
 (72) KAUSHANSKY, Kenneth, US
 MACDONALD, Brian, R., US
 (74) Wise, Daniel Joseph, et al, Carpmaels & Ransford LLP, One Southampton Row, London WC1B 5HA, GB
 Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV

(54) **METODES TROMBOCĪTU UN HEMATOPOĒTISKO CILMES ŠŪNU VEIDOŠANĀS PASTIPRINĀŠANAI**
METHODS OF INCREASING PLATELET AND HEMATOPOIETIC STEM CELL PRODUCTION

(57) 1. Trombopoētīnu (TPO) atdarināt spējīgs savienojums izmantošanai hematopoētisko cilmes šūnu veidošanās pastiprināšanā individuālam, turklāt TPO atdarināt spējīgais savienojums ir peptīds, kas satur aminoskābju sekvenci



kur
 X_1 ir C, L, M, P, Q vai V,
 X_2 ir F, K, L, N, Q, R, S, T vai V,
 X_3 ir C, F, I, L, M, R, S, V vai W,
 X_4 ir jebkura no 20 ģenētiski kodētām L-aminoskābēm,
 X_5 ir A, D, E, G, K, M, Q, R, S, T, V vai Y,
 X_6 ir β -(2-naftil)alanīna atlikums,
 X_7 ir C, G, I, K, L, M, N, R vai V,
 X_8 ir A, C, D, E, K, L, Q, R, S, T vai V un
 X_9 ir A, C, E, G, I, L, M, P, R, Q, S, T vai V.

2. TPO atdarināt spējīga savienojuma izmantošana medikamenta ražošanā hematopoētisko cilmes šūnu veidošanās pastiprināšanai individuālam, turklāt TPO atdarināt spējīgais savienojums ir, kā noteikts 1. pretenzijā.

3. TPO atdarināt spējīgs savienojums izmantošanai metodē hematopoētisko cilmes šūnu sagādāšanai individuālam, kas ietver šādus soļus:

TPO atdarināt spējīgā savienojuma ievadīšanu individuālam, lai stimulētu cilmes šūnu populācijas augšanu kaulu smadzenēs un/vai mobilizētu cilmes šūnas perifērajā asinsritē, vienas vai vairāku kaulu smadzeņu cilmes šūnu vai cilmes šūnu no perifērās asinsrites paņemšanu un paņemto cilmes šūnu transplantēšanu individuālam, turklāt TPO atdarināt spējīgais savienojums ir, kā noteikts 1. pretenzijā.

4. TPO atdarināt spējīga savienojuma izmantošana medikamenta ražošanā cilmes šūnu populācijas augšanas stimulēšanai individuāla kaulu smadzenēs un/vai cilmes šūnu mobilizēšanai tā perifērajā asinsritē, turklāt savienojums ir jāievada individuālam un ir jāpaņem viena vai vairākas kaulu smadzeņu cilmes šūnas vai cilmes šūnas no perifērās asinsrites transplantēšanai individuālam, turklāt TPO atdarināt spējīgais savienojums ir, kā noteikts 1. pretenzijā.

5. TPO atdarināt spējīgs savienojums izmantošanai metodē:

- (i) cilmes šūnu iedzīvošanās laika saīsināšanai individuāla organismā pēc reinfūzijas,
 (ii) aizkavētas primārās iedzīvošanās biežuma mazināšanai,
 (iii) sekundārās trombocītu neveidošanās biežuma mazināšanai vai
 (iv) trombocītu un/vai neitrofilu iedzīvošanās laika saīsināšanai pēc cilmes šūnu reinfūzijas individuālam, turklāt metode ietver šādus soļus:

TPO atdarināt spējīgā savienojuma ievadīšanu individuālam, cilmes šūnu populācijas augšanas kaulu smadzenēs stimulēšanu un/vai cilmes šūnu mobilizēšanu perifērajā asinsritē, vienas vai vairāku kaulu smadzeņu cilmes šūnu vai vienas vai vairāku cilmes šūnu no perifērās asinsrites paņemšanu un vienas vai vairāku paņemto cilmes šūnu transplantēšanu individuālam, turklāt TPO atdarināt spējīgais savienojums ir, kā noteikts 1. pretenzijā.

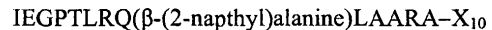
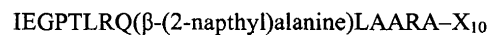
6. TPO atdarināt spējīga savienojuma izmantošana medikamenta ražošanā cilmes šūnu populācijas augšanas individuāla kaulu smadzenēs stimulēšanai un/vai cilmes šūnu mobilizēšanai tā perifērajā asinsritē, turklāt savienojums ir jāievada individuālam un ir jāpaņem viena vai vairākas kaulu smadzeņu cilmes šūnas vai viena vai vairākas cilmes šūnas no perifērās asinsrites transplantēšanai individuālam tā, lai

- (i) tiktu saīsināts cilmes šūnu iedzīvošanās laiks individuāla organismā pēc reinfūzijas,
 (ii) tiktu samazināts aizkavētas primārās iedzīvošanās biežums,
 (iii) tiktu samazināts sekundārās trombocītu neveidošanās biežums vai
 (iv) tiktu saīsināts trombocītu un/vai neitrofilu iedzīvošanās laiks pēc cilmes šūnu reinfūzijas individuālam, turklāt TPO atdarināt spējīgais savienojums ir, kā noteikts 1. pretenzijā.

7. Savienojums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1., 3. un 5. pretenzijas vai izmantošana saskaņā ar jebkuru no 2., 4. un 6. pretenzijas, turklāt X_9 ir A vai I un X_8 ir D, E vai K.

8. Savienojums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1., 3. un 5. pretenzijas vai izmantošana saskaņā ar jebkuru no 2., 4. un 6. pretenzijas, turklāt savienojums ir IEGPTLRQ(β -(2-naftil)alanīns)LAARA.

9. Savienojums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1., 3. un 5. pretenzijas vai izmantošana saskaņā ar jebkuru no 2., 4. un 6. pretenzijas, turklāt savienojums ir



kur X_{10} ir sarkozīna vai β -alanīna atlikums, vai tā pegilēta forma.

10. Savienojums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1., 3., 5. vai 7.-9. pretenzijas vai izmantošana saskaņā ar jebkuru no 2., 4., 6. vai 7.-9. pretenzijas, turklāt individuāls ir cilvēks.

11. Savienojums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 3., 5. vai 7.-10. pretenzijas vai izmantošana saskaņā ar jebkuru no 4., 6. vai 7.-10. pretenzijas, turklāt viena vai vairākas cilmes šūnas pēc paņemšanas tiek kriokonservētas.

12. Savienojums izmantošanai vai izmantošana saskaņā ar 11. pretenziju, turklāt viena vai vairākas kriokonservētās cilmes šūnas pirms to transplantēšanas individuālam tiek atsaldētas un tiek noteikta to dzīvotspēja.

13. Savienojums izmantošanai vai izmantošana saskaņā ar 11. pretenziju, turklāt viena vai vairākas cilmes šūnas tiek transplantētas individuālam tad, kad individuālam šāda transplantācija ir nepieciešama.

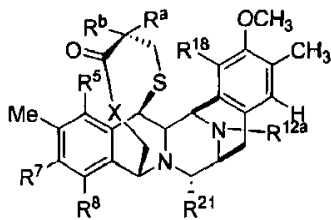
14. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 1. vai 3. pretenziju vai izmantošana saskaņā ar 2. vai 4. pretenziju, turklāt TPO atdarināt spējīgais savienojums ir ar zemāku imunogenitāti, salīdzinot ar vienu vai vairākiem no rhTPO un rhIL-11.

15. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 1. vai 3. pretenziju vai izmantošana saskaņā ar 2. vai 4. pretenziju, turklāt TPO atdarināt spējīgais savienojums ir ar uzlabotu farmakokinētisko (PK) profilu, salīdzinot ar vienu vai vairākiem no rhTPO un rhIL-11.

- (51) **C07D 515/22**^(2006.01) (11) **2305689**
A61K 31/50^(2006.01)
A61P 35/00^(2006.01)

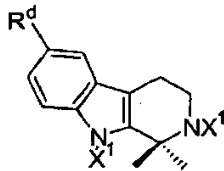
- (21) 10181699.9 (22) 04.02.2003
 (43) 06.04.2011
 (45) 09.04.2014
 (31) 0202544 (32) 04.02.2002 (33) GB
 (62) EP03737360.2 / EP1472261
 (73) Pharma Mar S.A.U., Avenida de los Reyes no. 1, Poligono Industrial La Mina, 28770 Colmenar Viejo (Madrid), ES

- (72) MENCHACA, Roberto, ES
MARTINEZ, Valentin, ES
RODRIGUEZ, Alberto, ES
RODRIGUEZ, Natividad, ES
GALLEGO, Pilar, ES
CUEVAS, Carmen, ES
MUNT, Simon, ES
MANZANARES, Ignacio, ES
- (74) Gordon, Kirsteen Helen, Marks & Clerk LLP, 62-68 Hills Road, Cambridge CB2 1LA, GB
Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA, Tomsona iela 24-15, Rīga, LV-1013
- (54) **DABĀ SASTOPAMO EKTEINASCIDĪNU UN LĪDZĪGU SAVIENOJUMU SINTĒZE**
THE SYNTHESIS OF NATURALLY OCCURRING ECTEINASCIDINS AND RELATED COMPOUNDS
- (57) 1. Savienojums ar formulu:



kurā

R^a un R^b kopā ar oglekļa atomu, pie kura tie ir pievienoti, veido grupu ar formulu:



kurā katrs X¹ neatkarīgi ir izvēlēts no ūdeņraža atoma vai aizvietota, vai neaizvietota R', OR', -(C=O)R', aizvietotas vai neaizvietotas alkilgrupas, aizvietotas vai neaizvietotas alkoksigrupas, aizvietotas vai neaizvietotas alkenilgrupas, aizvietotas vai neaizvietotas alkinilgrupas, aizvietotas vai neaizvietotas arilgrupas un aizvietotas vai neaizvietotas aralkilgrupas; kurā R' ir izvēlēts no grupas, kura sastāv no H, OH, NO₂, NH₂, SH, CN, halogēna atoma, C(=O)H, C(=O)CH₃, CO₂H, CO₂CH₃, C₁₋₆alkilgrupas, C₂₋₆alkenilgrupas, C₂₋₆alkinilgrupas, arilgrupas, aralkilgrupas un heterocikliskas grupas; kurā R^a ir aizvietots vai neaizvietots R', OR', -(C=O)R', aizvietota vai neaizvietota alkilgrupa, aizvietota vai neaizvietota alkoksigrupa, aizvietota vai neaizvietota alkenilgrupa, aizvietota vai neaizvietota alkinilgrupa, aizvietota vai neaizvietota arilgrupa vai aizvietota vai neaizvietota aralkilgrupa; kurā R' ir izvēlēts no grupas, kura sastāv no OH, NO₂, NH₂, SH, CN, halogēna atoma, C(=O)H, C(=O)CH₃, CO₂H, CO₂CH₃, C₁₋₆alkilgrupas, C₂₋₆alkenilgrupas, C₂₋₆alkinilgrupas, arilgrupas, aralkilgrupas un heterocikliskas grupas; R⁷ ir -OCH₃ un R⁸ ir -OH vai R⁷ un R⁸ kopā veido grupu -O-CH₂-O-; R^{12a} ir ūdeņraža atoms, acilgrupa, alkenilgrupa vai alkil-O-CO-; R²¹ ir -H, -OH vai -CN; X ir -O- vai -NH-; R⁵ un R¹⁸ ir -OX₁, kurā katrs X₁ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kura sastāv no ūdeņraža atoma un acilgrupas;

kurā

neobligāti aizvietotāji ir izvēlēti no grupas, kura sastāv no halogēna atoma, ciāngrupas, hidroksilgrupas, nitrogrupas, azīdgrupas, C₁₋₆alkanoilgrupām, karboksamīdgrupas, alkilgrupām, alkenilgrupām, alkinilgrupām, alkoksilgrupām, ariloksilgrupām, alkilgrupām, alkilsulfonilgrupām, alkilsulfonilgrupām, aminoalkilgrupām, aizvietotām vai neaizvietotām arilgrupām un aizvietotām vai neaizvietotām aralkilgrupām; un aizvietota vai neaizvietota alkilgrupa ir aizvietota vai neaizvietota C₁₋₁₂alkilgrupa; aizvietota vai neaizvietota alkenilgrupa ir aizvietota vai neaizvietota C₂₋₁₂alkenilgrupa; aizvietota vai neaizvietota alkinilgrupa ir aizvietota vai neaizvietota C₂₋₁₂alkinilgrupa;

aizvietota vai neaizvietota alkoksigrupa ir aizvietota vai neaizvietota C₁₋₁₂alkoksigrupa; aizvietota vai neaizvietota arilgrupa ir aizvietota vai neaizvietota C₆₋₁₈arilgrupa; heterocikliska grupa ir heterocikliska grupa ar 5 līdz 10 gredzena atomiem, no kuriem 1 līdz 4 ir heteroatomi; acilgrupa ir izvēlēta no alkil-CO, alkenil-CO, alkinil-CO, aril-CO un heterociklil-CO, kurā alkil-, alkenil-, alkinil-, aril- un heterociklilgrupa ir, kā definēts iepriekš; aralkilgrupa ir C₁₋₁₂alkilgrupa, aizvietota ar C₆₋₁₈arilgrupu; un cikloalkilgrupa ir aizvietota vai neaizvietota C₃₋₁₂cikloalkilgrupa.

14. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu, kā definēts jebkurā no iepriekšējām pretenzijām, un farmaceitiski pieņemamu nesēju.

15. Savienojums, kā definēts jebkurā no 1. līdz 13. pretenzijai, vai farmaceitiska kompozīcija, kā definēts 14. pretenzijā, izmantošanai vēža ārstēšanā.

- (51) **C07K 16/10**^(2006.01) (11) **2314621**
A61K 39/395^(2006.01)
A61P 31/14^(2006.01)
C12N 15/13^(2006.01)
C12N 15/63^(2006.01)
C12N 5/10^(2006.01)
- (21) 10180398.9 (22) 26.05.2005
(43) 27.04.2011
(45) 05.03.2014
- (31) 575023 P (32) 27.05.2004 (33) US
PCT/EP2005/050310 25.01.2005 WO
PCT/EP2004/052772 03.11.2004 WO
PCT/EP2004/052286 23.09.2004 WO
PCT/EP2004/051661 29.07.2004 WO
PCT/EP2004/050943 27.05.2004 WO
PCT/EP2005/050953 03.03.2005 WO
- (62) EP05747901.6 / EP1749029
(73) Crucell Holland B.V., Archimedesweg 4, 2333 CN Leiden, NL
(72) BAKKER, Alexander, Berthold, Hendrik, NL
MARISSEN, Willem Egbert, NL
De KRUIF, Cornelis Adriaan, NL
KRAMER, Robert Arjen, NL
(74) Manten, Annemieke, et al, Crucell Holland B.V., Archimedesweg 4-6, 2333 CN Leiden, NL
Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV
- (54) **SAISTOŠĀS MOLEKULAS, KAS IR SPĒJĪGAS NEITRALIZĒT TRAKUMSĒRGAS VĪRUSU, UN TO IZMANTOŠANA BINDING MOLECULES CAPABLE OF NEUTRALIZING RABIES VIRUS AND USES THEREOF**

(57) 1. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur vismaz divas trakumsērgas vīrusu neitralizējošas saistošas molekulas, kuras ir spējīgas reaģēt ar dažādiem nekonkurējošiem trakumsērgas vīrusa epitopiem, kur pirmā trakumsērgas vīrusu neitralizējoša saistoša molekula ir spējīga reaģēt ar epitopu, kas satur trakumsērgas vīrusa G proteīna aminoskābes 226-231, un otra trakumsērgas vīrusu neitralizējoša saistoša molekula ir spējīga reaģēt ar epitopu, kas ir lokalizēts antigēnu saitā III, kas satur trakumsērgas vīrusa G-proteīna aminoskābes 330-338.

2. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur divas trakumsērgas vīrusu neitralizējošas saistošas molekulas, kuras ir spējīgas saistīties pie dažādiem, nekonkurējošiem trakumsērgas vīrusa epitopiem, šī kompozīcija satur:

pirmo trakumsērgas vīrusu neitralizējošu saistošu molekulu, kura ir spējīga saistīties pie epitopa, kas satur trakumsērgas vīrusa G proteīna aminoskābes 226-231, minētā pirmā trakumsērgas vīrusu neitralizējošā antiēviela satur:

smagās ķēdes mainīgo reģionu, kas satur aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 273; un

vieglās ķēdes mainīgo reģionu, kas satur aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 275; un

otru trakumsērgas vīrusu neitralizējošu saistošu molekulu, kura ir spējīga saistīties pie epitopa, kas ir lokalizēts antigēnu saitā III,

kas satur trakumsērgas vīrusa G proteīna aminoskābes 330-338.

4. Farmaceitiska kompozīcija saskaņā ar 2. pretenziju, kurā pirmā trakumsērgas vīrusu neitralizējošā saistošā molekula ir IgG un otrā trakumsērgas vīrusu neitralizējošā saistošā molekula ir IgG.

(51) **C07K 14/705**^(2006.01) (11) **2332976**
C12N 15/00^(2006.01)
C07K 16/28^(2006.01)

(21) 10010891.9 (22) 27.01.2000
(43) 15.06.2011
(45) 02.04.2014
(31) 244448 (32) 03.02.1999 (33) US
264527 08.03.1999 US
(62) EP00907027.7 / EP1149114
(73) Amgen, Inc, One Amgen Center Drive, Thousand Oaks, CA 91320-1799, US
(72) YOSHINAGA, Steven Kiyoshi, US
(74) Grünecker, Kinkeldey, Stockmair & Schwanhäusser, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV

(54) **JAUNI IMŪNAJĀ ATBILDES REAKCIJĀ IESAISTĪTI POLIPEPTĪDI**
NOVEL POLYPEPTIDES INVOLVED IN IMMUNE RESPONSE

(57) 1. Izolēta nukleīnskābes molekula, kas satur nukleotīdu sekvenču, kas kodē Fig. 12A (SEQ ID NO: 17) parādītā polipeptīda ārpusšūnas domēnu, turklāt ārpusšūnas domēns aptver Fig. 12A (SEQ ID NO: 17) parādītās aminoskābju sekvenču atlikumus, sākot ar jebkuru no 19., 20., 21., 22., 24. vai 28. atlikuma līdz 259. atlikumam, ar nosacījumu, ka nukleotīdu sekvenču nav nukleotīdu sekvenču ar GenBank piekļuves numuru AB014553.1 (iesniegta 1998. g. 15. jūlijā).

2. Nukleīnskābes molekula saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt nukleotīdu sekvenču ir funkcionētspējīgi saistīta ar ekspresiju regulējošu sekvenču.

3. Saimniekšūna, kas satur 2. pretenzijas nukleīnskābes molekulu.

5. Paņēmiens 1. vai 2. pretenzijas nukleīnskābes kodēta polipeptīda ražošanai, kas ietver 3. pretenzijas saimniekšūnu kultūras kultivēšanu piemērotā barotnē un polipeptīda izdalīšanu no kultūras.

6. Polipeptīds, kas ir kodēts ar 1. pretenzijas nukleīnskābes molekulu.

7. Izolēts polipeptīds, kas satur Fig. 12A (SEQ ID NO: 17) parādītās nobriedušās aminoskābju sekvenču ārpusšūnas domēnu, turklāt ārpusšūnas domēns aptver Fig. 12A (SEQ ID NO: 17) parādītās aminoskābju sekvenču atlikumus, sākot ar jebkuru no 19., 20., 21., 22., 24. vai 28. atlikuma līdz 259. atlikumam.

8. Polipeptīds saskaņā ar 6. vai 7. pretenziju, kas ir ticiski modificēts.

10. Sapludināts polipeptīds, kas satur 6. vai 7. pretenzijas polipeptīdu, kas ir sapludināts ar heterologu aminoskābju sekvenču.

12. Kompozīcija, kas satur 6. vai 7. pretenzijas polipeptīdu un farmaceitiski pieņemamu nesēju, adjuvantu, solubilizatoru, stabilizatoru vai antioksidantu.

13. Polipeptīda saskaņā ar 6. vai 7. pretenziju izmantošana medikamenta gatavošanai T šūnu pastarpināta traucējuma ārstēšanai, profilaksei vai stāvokļa uzlabošanai tā gadījumā.

14. Metode T šūnu pastarpināta traucējuma vai uzņēmības pret T šūnu pastarpinātu traucējumu diagnosticēšanai dzīvniekam, kas ietver:

a) 6. vai 7. pretenzijas polipeptīda ekspresijas esamības vai tās daudzuma noteikšanu un

b) T šūnu pastarpinātā traucējuma vai uzņēmības pret T šūnu pastarpinātu traucējumu diagnosticēšanu, balstoties uz polipeptīda ekspresijas esamību vai tās daudzumu.

15. Metode testa molekulas, kas saistās ar 6. vai 7. pretenzijas polipeptīdu, identificēšanai, kas ietver:

a) 6. vai 7. pretenzijas polipeptīda pakļaušanu kontaktam ar testa molekulu un

b) polipeptīda un testa molekulas saistīšanās pakāpes noteikšanu.

17. Nukleīnskābes molekulas saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošana medikamenta gatavošanai T šūnu aktivācijas vai proliferācijas regulēšanai dzīvniekam.

18. Polipeptīds saskaņā ar 6. vai 7. pretenziju lietošanai T šūnu pastarpināta traucējuma ārstēšanā, profilaksē vai stāvokļa uzlabošanā tā gadījumā.

19. Nukleīnskābes molekula saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju lietošanai T šūnu aktivācijas vai proliferācijas regulēšanā dzīvniekam.

(51) **C07K 14/705**^(2006.01) (11) **2332978**
C12N 15/00^(2006.01)
C07K 16/28^(2006.01)

(21) 10010892.7 (22) 27.01.2000
(43) 15.06.2011
(45) 02.04.2014
(31) 244448 (32) 03.02.1999 (33) US
264527 08.03.1999 US
(62) EP00907027.7 / EP1149114
(73) Amgen, Inc, One Amgen Center Drive, Thousand Oaks, CA 91320-1799, US
(72) YOSHINAGA, Steven Kiyoshi, US
(74) Grünecker, Kinkeldey, Stockmair & Schwanhäusser, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV

(54) **JAUNI IMŪNAJĀ ATBILDES REAKCIJĀ IESAISTĪTI POLIPEPTĪDI**
NOVEL POLYPEPTIDES INVOLVED IN IMMUNE RESPONSE

(57) 1. Antivieta vai tās fragments, kas saistās ar B7RP1 polipeptīda ārpusšūnas domēnu, turklāt polipeptīds:

(a) ir kodēts ar nukleīnskābes molekulu, kas satur nukleotīdu sekvenču, kas kodē Fig. 12A (SEQ ID NO: 17) parādītā polipeptīda ārpusšūnas domēnu, vai

(b) satur Fig. 12A (SEQ ID NO: 17) parādītās nobriedušās aminoskābju sekvenču ārpusšūnas domēnu, turklāt ārpusšūnas domēns aptver Fig. 12A (SEQ ID NO: 17) parādītās aminoskābju sekvenču atlikumus, sākot ar jebkuru no 19., 20., 21., 22., 24. vai 28. atlikuma līdz 259. atlikumam.

2. Antivieta vai tās fragments saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir monoklonāla antiivieta, cilvēka antiivieta, humanizēta antiivieta, CDR-potēta antiivieta (antiivieta ar ievietotiem piemērotiem komplementaritāti nosakošiem apgabaliem) vai to fragments, kas saistās ar B7RP1 polipeptīda ārpusšūnas domēnu.

3. Antivieta vai tās fragments saskaņā ar 1. pretenziju, kas inhibē 1. (a) vai 1. (b) pretenzijas polipeptīda saistīšanos ar Fig. 13A parādīto nobriedušo polipeptīdu.

4. Antivieta vai tās fragments saskaņā ar 1. pretenziju, kas pazemina B7RP1 pastarpināto T šūnu līdzstimulējošo aktivitāti.

5. Antagonista izmantošana medikamenta gatavošanai imūnās atbildes reakcijas nomākšanai, turklāt antagonists ir antiivieta vai tās fragments saskaņā ar 1. pretenziju.

6. Antagonists lietošanai imūnās atbildes reakcijas nomākšanā, turklāt antagonists ir antiivieta vai tās fragments saskaņā ar 1. pretenziju.

7. Izmantošana saskaņā ar 5. pretenziju autoimūnu traucējumu ārstēšanai.

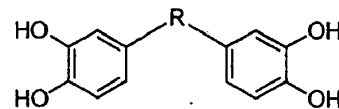
8. Antagonists saskaņā ar 6. pretenziju lietošanai autoimūnu traucējumu ārstēšanā.

9. Izmantošana saskaņā ar 7. pretenziju vai antagonists saskaņā ar 8. pretenziju, turklāt autoimūnais traucējums ir jebkurš no reimatoīdā artrīta, psoriāzes, multiplās sklerozes, diabēta un sistēmiskās sarkanās vilkēdes.

10. Antagonista izmantošana medikamenta gatavošanai hroniskas iekaisuma slimības ārstēšanai, turklāt antagonists ir antiivieta vai tās fragments saskaņā ar 1. pretenziju.

(51) **C12N 15/113**^(2006.01) (11) **2348134**
(21) 10180025.8 (22) 29.11.2001
(43) 27.07.2011
(45) 16.04.2014

- (31) 279661 P (32) 30.03.2001 (33) US
00126325 01.12.2000 EP
- (62) EP01985833.1 / EP1407044
EP07014533.9 / EP1873259
- (73) Max-Planck-Gesellschaft zur Förderung der Wissenschaften e.V., Hofgartenstrasse 8, 80539 München, DE
Europäisches Laboratorium für Molekularbiologie (EMBL), Meyerhofstrasse 1, 69117 Heidelberg, DE
- (72) TUSCHL, Thomas, US
ELBASHIR, Sayda, US
LENDECKEL, Winfried, DE
WILM, Matthias, IE
LÜHRMANN, Reinhard, DE
- (74) Weiss, Wolfgang, et al, Weickmann & Weickmann Patentanwälte, Postfach 86 08 20, 81635 München, DE
Lūcija KUZZUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **RNS INTERFERENCI PASTARPINOŠAS MAZAS RNS MOLEKULAS**
RNA INTERFERENCE MEDIATING SMALL RNA MOLECULES
- (57) 1. *In vitro* metodes mērķa specifiskas RNS interferences pastarpināšanai eikariotiskā šūnā, kas ietver soļus:
(a) minētās eikariotiskās šūnas pakļaušanu kontaktam apstākļos, kuros var notikt mērķa specifiska RNS interference, ar izolētu divpavedienu RNS molekulu, kurā katra pavediena garums ir no 19 līdz 23 nukleotīdiem, turklāt minētā RNS molekula ir mērķa specifiskās RNS interferences spējīga, turklāt vismaz vienam pavedienam ir 1-3 nukleotīdu 3'-pārkare un turklāt RNS molekula satur vismaz vienu modificētu nukleotīda analogu, un
(b) mērķa specifiskās RNS interferences pastarpināšanu, ko realizē divpavedienu RNS attiecībā pret mērķa nukleīnskābi, kurai ir sekvenču daļa, kas būtībā atbilst divpavedienu RNS, izmantošana gēna funkcijas modulēšanai eikariotiskā šūnā, turklāt gēns ir saistīts ar patoloģisku stāvokli un turklāt gēns bez tam ir ar patogēnu saistīts gēns, ar audzēju saistīts gēns vai ar autoimūnu slimību saistīts gēns.
2. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt katra divpavedienu RNS molekulas pavediena garums ir no 20 līdz 22 nukleotīdiem.
3. Izmantošana saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt 3'-pārkare ir stabilizēta pret noārdīšanos.
4. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, turklāt modificētais nukleotīda analogs ir izvēlēts no cukura daļā vai galvenajā ķēdē modificētiem ribonukleotīdiem.
5. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, turklāt nukleotīda analogs ir cukura daļā modificēts ribonukleotīds, kurā 2'-OH grupa ir aizstāta ar grupu, kas izvēlēta no H, OR, R, halogēna atoma, SH, SR', NH₂, NHR, NR₂ vai CN, kur R ir C₁₋₆ alkilgrupa, alkenilgrupa vai alkinilgrupa un halogēna atoms ir F, Cl, Br vai I.
6. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, turklāt nukleotīda analogs ir galvenajā ķēdē modificēts ribonukleotīds, kas satur fosfotioātgrupu.
7. Izmantošana saskaņā ar 6. pretenziju, turklāt ar patogēnu saistītais gēns ir vīrusa gēns.
- (51) **C07C 49/83**^(2006.01) (11) **2527315**
C07C 39/15^(2006.01)
C07C 49/835^(2006.01)
C07C 215/50^(2006.01)
C07C 235/34^(2006.01)
C07C 39/17^(2006.01)
C07C 43/23^(2006.01)
A61P 25/28^(2006.01)
A61K 31/05^(2006.01)
C07D 231/06^(2006.01)
C07D 213/84^(2006.01)
C07D 295/08^(2006.01)
C07D 487/04^(2006.01)
C07D 207/16^(2006.01)
C07D 217/26^(2006.01)
- C07D 263/18**^(2006.01)
C07D 333/16^(2006.01)
C07D 213/30^(2006.01)
C07D 498/08^(2006.01)
C07D 471/04^(2006.01)
- (21) 12166370.2 (22) 30.05.2003
(43) 28.11.2012
(45) 19.03.2014
(31) 385144 P (32) 31.05.2002 (33) US
409100 P 09.09.2002 US
412272 P 20.09.2002 US
435880 P 20.12.2002 US
463104 P 14.04.2003 US
- (62) EP03756343.4 / EP1511710
(73) Proteotech Inc., 12026, 115th Avenue N.E., Kirkland, WA 98034, US
(72) SNOW, Alan, D., US
NGUYEN, Beth, P., US
CASTILLO, Gerardo, M., US
SANDERS, Virginia, J., US
LAKE, Thomas, P., US
LARSEN, Lesley, NZ
LARSEN, David S., NZ
WEAVERS, Rex T., NZ
LORIMER, Stephen D., NZ
COFFEN, David, L. (deceased), US
- (74) Crooks, Elizabeth Caroline, et al, Kilburn & Strode LLP, 20 Red Lion Street, London WC1R 4PJ, GB
Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., Alīses iela 10-69, Rīga, LV-1046, LV
- (54) **SAVIEŅOJUMI, KOMPOZĪCIJAS UN METODES AMILOĪDO SLIMĪBU UN SINUKLEINOPĀTIJU, TĀDU, KĀ ALCHHEIMERA SLIMĪBA, 2. TIPA DIABĒTS UN PĀRKINSONA SLIMĪBA, ĀRSTĒŠANAI**
COMPOUNDS, COMPOSITIONS AND METHODS FOR THE TREATMENT OF AMYLOID DISEASES AND SYNNUCLEINOPATHIES SUCH AS ALZHEIMER'S DISEASE, TYPE 2 DIABETES AND PARKINSON'S DISEASE
- (57) 1. Savienojums ar formulu:



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur:

R ir C₆₋₁₀ alkilēngrupa, kurā:

- neobligāti ir 1 vai 2 blakus neesošas dubultsaites;
- no 1 līdz 3 blakus neesošām metilēngrupām ir aizstātas ar NR', O vai S, kur R' ir H, C₂₋₄ acilgrupa vai C₁₋₃ alkilgrupa; un
- 2 metilēngrupas ir aizstātas ar karbonilgrupu vai hidroksimetilēngrupu.

3. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

4. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai amiloīdo fibrilu vai sinukleīnu fibrilu veidošanās, nogulsnešanās, akumulēšanās vai persistences ārstēšanā.

5. *In-vitro* paņēmieni amiloīdo fibrilu vai sinukleīnu fibrilu veidošanās, nogulsnešanās, akumulēšanās vai persistences ārstēšanai, kas ietver fibrilu ārstēšanu ar savienojuma saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju efektīvu daudzumu.

8. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai amiloīdās slimības vai sinukleīnopātijas ārstēšanā zīdītājam, kurš slimo ar šo slimību.

10. Savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, kur amiloīdā slimība ir izvēlēta no slimību grupas, kas sastāv no Alcheimera slimības, Dauna sindroma, bokseru demences, multiplās sistēmas atrofijas, citomegalovīrusu miozīta, iedzimtas cerebrālās hemorāģijas ar Holandes tipa amiloīdozi, C tipa Nīmana-Pika slimības, cerebrālās β-amiloīda angiopātijas, demences, kas asociēta ar kortikobazālo deģenerāciju, 2. tipa diabēta amiloīdozes, hroniska iekaisuma amiloīdozes, amiloīdozes, kas asociēta ar ļaundabīgu audzēju un pārmanoto Vidusjūras drudzi, multiplās mielomas amiloīdozes un B-šūnu diskrazijas, prionu slimību amiloīdozes, Kreicfelda-Jakoba slimības, Gerstmaņa-Štreislera sindroma, kuru infekcijas, aitu

kašķa, amiloidozes, kas asociēta ar karpālā kanāla sindromu, sirds senilās amiloidozes, pārmantotās amiloidozes polineuropātijas un amiloidozes, kas asociēta ar endokrīno orgānu audzējiem.

11. Savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, kur sinukleinopātija ir slimība, kas asociēta ar sinukleīnu fibrilu, labāk ar *alfa*-sinukleīna fibrilu, veidošanos, nogulsņēšanos, akumulēšanu vai persistenci.

12. Savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, kur sinukleinopātija ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no Pārkinsona slimības, pārmantotas Pārkinsona slimības, Levī ķermenīšu slimības, Alcheimera slimības Levī ķermenīšu varianta, Levī ķermenīšu demences, multiplās sistēmas atrofijas un Guama parkinsonisma-demences kompleksa.

13. Savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, kur zīdītājs ir cilvēks.

14. Savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, kas ir paredzēts ievadīšanai daudzumā starp 0,1 mg/kg/dienā un 1000 mg/kg/dienā, labāk starp 1 mg/kg/dienā un 100 mg/kg/dienā, vislabāk starp 10 mg/kg/dienā un 100 mg/kg/dienā.

15. Savienojuma saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošana medikamenta ražošanā, kas paredzēts:

a) amiloīdo fibrilu vai sinukleīnu fibrilu veidošanās, nogulsņēšanās, akumulēšanās vai persistences ārstēšanai; vai

b) amiloīdās slimības vai sinukleinopātijas ārstēšanai zīdītājam, kurš slimo ar šo slimību,

labāk, kur a) ir modificēts saskaņā ar 6. vai 7. pretenzijas pazīmēm; vai, kur b) ir modificēts saskaņā ar jebkuras no 9. līdz 14. pretenzijai pazīmēm.

Uz Latviju attiecināto Eiropas patentu publikācijas

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

Publikācijas sakārtotas Eiropas patentu numuru kārtībā.

- (51) **A61K31/4184**^(2006.01) (11) **1212081**
A61P9/04^(2006.01)
A61P9/10^(2006.01)
A61P3/10^(2006.01)
- (21) 00965898.0 (22) 25.08.2000
(43) 12.06.2002
(45) 26.10.2005
(45) 02.04.2014 (publikācija pēc iebilduma)
- (31) 9903028 (32) 27.08.1999 (33) SE
(86) PCT/EP2000/008341 25.08.2000
(87) WO 2001/015673 08.03.2001
(73) Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, Brüningstrasse 50, 65929 Frankfurt am Main, DE
- (72) SCHOELKENS, Bernward, DE
BENDER, Norbert, DE
RANGOONWALA, Badrudin, DE
DAGENAIS, Gilles, CA
GERSTEIN, Hertzal, CA
LJUNGGREN, Anders, SE
YUSUF, Salim, CA
- (74) Bösl, Raphael Konrad, et al, Isenbruck Bösl Hörschler LLP, Patentanwälte, Prinzregentenstrasse 68, 81675 München, DE
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
- (54) **RAMIPRILA IZMANTOŠANA SASTRĒGUMU IZRAISĪTAS SIRDIS MAZSPĒJAS PROFILAKSEI**
USE OF RAMIPRIL IN THE PREVENTION OF CONGESTIVE HEART FAILURE
- (57) 1. Ramiprila izmantošana medikamenta ražošanā, kas paredzēts sastrēgumu izraisītas sirds mazspējas (CHF) profilaksei pacientiem ar iepriekšēju CHF, kur pacients ir ar augstu kardiovaskulāra traucējuma risku iepriekšējas išēmiskās slimības, triekas vai perifērās arteriālās slimības dēļ un tam ir normāls vai zems asinsspiediens.

Eiropas patentu pieteikumu publikācijas Latvijā

(Publikācijas saskaņā ar 2007. gada 15. februāra Patentu likuma 70. panta otro daļu)

Publikācijas sakārtotas Eiropas patentu pieteikumu publikācijas numuru kārtībā.

- (51) **A61K 38/20**^(2006.01) (11) **2722053** A1
A61K 47/32^(2006.01)
A61K 33/14^(2006.01)
A61K 33/18^(2006.01)
A61P 31/04^(2006.01)
A61P 31/06^(2006.01)
- (21) 11853027.8 (22) 09.12.2011
(43) 23.04.2014
(31) 20101816 (32) 30.12.2010 (33) KZ
(86) PCT/KZ2011/00019, 09.12.2011
(87) WO 2012/091534, 05.07.2012
(71) Respublikanskoe Gosudarstvennoe Predpriyatie "Nauchnyj Centr Protivoinfekcionnyh Preparatov" Komiteta Promyshlennosti Ministerstva Industrii I Novyh Tehnologij Respubliki Kazakhstan, Auezova 84, Almaty 050008, KZ
(72) ILIN, Alexandr Ivanovich, KZ
KULMANOV, Murat Esengalievich, KZ
(74) Plicka, Josef, Cermák a spol., Elisky Peskove 15/735, 150 00 Praha 5, CZ
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV
(54) **ANTIBAKTERIĀLS LĪDZEKLIS BAKTERIĀLU INFEKCIJAS SLIMĪBU ĀRSTĒŠANAI**
ANTIBACTERIAL AGENT FOR TREATING INFECTIOUS DISEASES OF BACTERIAL ORIGIN
- (57) 1. Antibakteriāls līdzeklis bakteriālo infekcijas slimību, ieskaitot slimnīcas infekcijas un zāļu rezistentas TB, ārstēšanai, kurš pārstāv nanostrukturētu jonu kompleksu, kas veidots no proteīniem un/vai polipeptīdiem, ogļhidrātiem, sārmu un sārmzemju metālu sāļiem un joda, kas iestarpināts tajos; kas raksturīgs ar to, ka nanostrukturētu jonu kompleksa proteīni un/vai polipeptīdi satur vismaz vienu gala aminoskābes virkni ar elektronu donora funkcionālām grupām.
2. Antibakteriāls līdzeklis saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka interleikīni tiek izmantoti kā proteīni un gala aminoskābju virkne ir Phe, Ala, Val, Ala, Leu, Ile utt.
3. Antibakteriāls līdzeklis saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka antimikrobu līdzeklis palielina baktēriju jutīgumu pret antibiotikām, ieskaitot pret antibiotikām rezistentas baktērijas.
4. Antibakteriāls līdzeklis saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tas palielina bakteriālu infekcijas slimību ārstēšanas iedarbīgumu ar antibiotikām, ieskaitot slimnīcas infekcijas un zāļu rezistentu TB.
5. Antibakteriāls līdzeklis saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tam ir pretvīrusu iedarbība.
6. Antibakteriāls līdzeklis saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tam ir imunogēna aktivitāte, kas palielina monocītu-makrofāgu un citotoksisku T-limfocītu aktivitāti.
7. Antibakteriāls līdzeklis saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tas stimulē kaulu smadzeņu hemopoētisko funkciju.
8. Antibakteriāls līdzeklis saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tas pārņem antineoplastisko darbību.
9. Antibakteriāls līdzeklis saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tam ir pret apstarošanu aizsargājošas īpašības.
10. Antibakteriāls līdzeklis saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka INSC ir šāda formula: $\{[(Ln(Me)3)^+ y [Me(Lm)] + x] (Cl^-) y + x + k\}$, kur M = 30 līdz 300 kDa.

11. Antibakteriāls līdzeklis saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tas ir farmaceutiskā formā, kas ir piemērota parenterālai, perorālai, ārējai vai citai ievadīšanai.

12. Antibakteriāls līdzeklis saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka ar sastāvdaļu noteiktu pieņemamu koncentrāciju tas ir nemedicīniskis līdzeklis.

13. Paņēmiens antibakteriāla līdzekļa saskaņā ar 1. pretenziju ražošanai, kas ietver ogļhidrātu un proteīnu kompleksa veidošanas reakciju ar metāla sāļiem, un joda iestarpināšanu kompleksā ar jonu spēku no $5 \cdot 10^{-4}$ līdz 15, kas raksturīgs ar to, ka imunitrofisko proteīnu ievadīšana tiek veikta kā atsevišķa stadija pēc 5 līdz 95 % joda iestarpināšanas.

Latvijā apstiprināto Eiropas patentu publikācijas

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

Publikācijas sakārtotas Eiropas patentu numuru kārtībā.

- (51) **B28D 1/14**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1738885**
B28B 11/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
B23B 39/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 06397009.9 (22) 09.06.2006
(43) 03.01.2007
(45) 14.05.2014
(31) 20050701 (32) 01.07.2005 (33) FI
(73) Elematic Oy Ab, P.O. Box 33, 37801 Toijala, FI
(72) SANDQVIST, Leo, FI
JÄRVINEN, Lassi, FI
SEPPÄNEN, Aimo, FI
(74) Berggren Oy Ab, P.O. Box 16, Antinkatu 3 C, 00101 Helsinki, FI
Artis KROMANIS, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **METODE UN APARĀTS DRENĀŽAS CAURUMU URBŠANAI**
METHOD AND APPARATUS FOR DRILLING DRAINAGE HOLES

(57) 1. Metode ūdens drenāžas caurumu urbšanai dobumainā dzelzsbetona plātnē, kā rezultātā izlieta vai paredzētajā garumā ar zāģēšanu nogriezta dobumaina dzelzsbetona plātne tiek pacelta un pārvietota ar pacelšanas strēles pacelšanas elementu palīdzību no liešanas veidnes uz atsevišķu staciju, kā rezultātā dobumainās plātnes apakšējā virsmā, būtībā plātnes galu zonās pie dobajām serdēm, tiek izurbti drenāžas caurumi, raksturīga ar to, ka minētajā metodē:

- minētā atsevišķā stacija ir urbšanas stacija (1, 2, 3), kurā tiek urbti minētie drenāžas caurumi,
- dobumainā plātnes plātnes galos, būtībā punktos, kur plātnes galos tiks urbti drenāžas caurumi, tiek satverta ar pacelšanas elementu palīdzību,
- tiek noteikts plātni satverošo pacelšanas elementu savstarpējais attālums un dati par attālu tiek pārsūtīti uz urbšanas staciju,
- urbšanas stacijas gala daļu (1, 2) savstarpējais attālums tiek noteikts, pamatojoties uz pacelšanas elementu savstarpējo attālu, turklāt minētās gala daļas satur urbšanas mezglus (6) drenāžas caurumu urbšanai plātnes pretējos galos, un
- gala daļas (1, 2), kas satur urbšanas mezglus (6) drenāžas caurumu urbšanai plātnes pretējos galos, tiek pārvietotas noteiktajā attālumā viena no otras.

2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka metodē drenāžas urbumi, kas nepieciešami plātnes virsmā, tiek izurbti ar atsevišķa pārvietojama urbšanas mezgla (7) palīdzību.

3. Metode saskaņā ar 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka pārvietojamais urbšanas mezgls (7) tiek vadīts, pamatojoties uz plātnes konstrukcijas datiem.

4. Aparāts ūdens drenāžas caurumu urbšanai dobumainā dzelzsbetona plātnē, turklāt minētais aparāts satur:

- vienu vai vairākus urbšanas mezglus (6), lai izurbtu drenāžas caurumus plātnes apakšējā virsmā, būtībā plātnes gala daļu zonā pie dobajām serdēm,
- divas attiecībā viena pret otru pārvietojamas gala daļas (1, 2), uz kurām urbšanas brīdī tiek novietoti urbjamie plātnes gali,
- gala daļas, kas satur vienu vai vairākus urbšanas mezglus (6) drenāžas caurumu urbšanai dobumainās plātnes apakšējā virsmā, kā arī
- līdzekli (4) gala daļu pārvietošanai vienai no otras attālumā, kuru nosaka, pamatojoties uz urbjamās plātnes garumu, raksturīgs ar to, ka pirmā gala daļa (1) ir stacionāra un otrā gala daļa (2) ir pārvietojama, un aparāts satur starpdaļu (3), kas pārvietojami novietota starp gala daļām, turklāt minētā starpdaļa (3)

satur vismaz vienu urbšanas mezglu (7) drenāžas caurumu urbšanai dobumainās plātnes apakšējā virsmā.

5. Aparāts saskaņā ar 4. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka vismaz viens urbšanas mezgls (7) ir novietots starpdaļā (3) tā, ka tas ir pārvietojams šķērsvirzienā pret urbamo plātni.

6. Aparāts saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka urbšanas mezgli (6, 7) ir novietoti aparātā tā, ka tie ir pārvietojami vertikālā virzienā.

7. Aparāts saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka aparāts satur līdzekli urbšanas mezglu (7) vadībai, kas ievietots starpdaļā (3), pamatojoties uz plātnes konstrukcijas datiem.

8. Aparāts saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka aparāts satur līdzekli gala daļu (1, 2) pārvietošanai attiecībā vienai pret otru un līdzekli gala daļu (1, 2) savstarpējā attāluma noteikšanai.

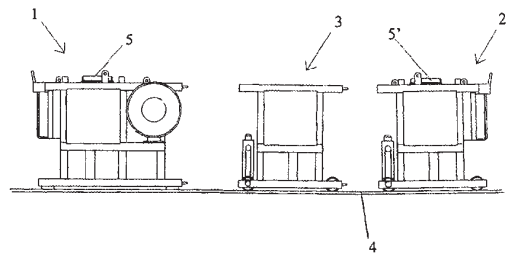


Fig. 1

- (51) **A61L 24/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1877096**
A61L 24/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 9/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 47/36⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 47/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 06758729.5 (22) 27.04.2006
(43) 16.01.2008
(45) 15.01.2014
(31) 676757 P (32) 02.05.2005 (33) US
(86) PCT/US2006/016208 27.04.2006
(87) WO2006/119009 09.11.2006
(73) Genzyme Corporation, 500 Kendall Street, Cambridge, MA 02142, US
The General Hospital Corporation, 55 Fruit Street, Boston, MA 02114, US
(72) MCDOUGAL, W., Scott, US
SAACO, Dianne, E., US
SCHWARZ, Alexander, US
VOGEL, Jean-Marie, US
(74) Atkinson, Jonathan David Mark, et al, Harrison Goddard Foote LLP, Belgrave Hall, Belgrave Street, Leeds LS2 8DD, GB
Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga, LV-1050, LV
- (54) **NIERAKMEŅU TERAPIJA, NEIZMANTOJOT LITOTRIPSIJU**
NON-LITHOTRIPSIC KIDNEY-STONE THERAPY

(57) 1. Medikaments, kas satur pirmo kompozīciju, kas ir spējīga veidot polimēru aizsprostojumu, un, neobligāti, otru kompozīciju, izmantošanai litiāzes ārstēšanā zīdītāja lūmenā, turklāt izmantošana ietver šādas stadijas: pirmās kompozīcijas, kas satur inversu termojuktīgu polimēru, injicēšanu zīdītāja lūmenā pirmajā attālumā no akmens augšpusstraumes, kur minētā pirmā kompozīcija nekontaktē ar minēto akmeni; tādējādi tiek veidots polimēru aizsprostojums; neobligāti otras kompozīcijas injicēšanu minētajā lūmenā otrā attālumā no minētā akmens augšpusstraumes, kur minētā otrā kompozīcija nekontaktē ar minēto akmeni; un nodrošināšanu, ka peristaltika piespiež minēto polimēru aizsprostojumu šķērsot minēto lūmenu, tādējādi minētais akmens tiek izgrūsts no minētā lūmena.

2. Medikaments saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētais inversais termojuktīgais polimērs ir blokkopolimērs, statistisks kopolimērs, piepūstais kopolimērs vai sazarots kopolimērs.

3. Medikaments saskaņā ar 2. pretenziju, kur minētais inversais termojuktīgais polimērs ir blokkopolimērs vai sazarots kopolimērs.

4. Medikaments saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētais inver-
sais termojutīgais polimērs ir neobligāti attīrīts poloksamērs vai
poloksamīns.
5. Medikaments saskaņā ar 4. pretenziju, kur minētais inver-
sais termojutīgais polimērs ir neobligāti attīrīts un izvēlēts no grupas, kas
sastāv no poloksamīna 1107, poloksamīna 1307, poloksamēra 338
un poloksamēra 407.
6. Medikaments saskaņā ar 5. pretenziju, kur minētais inver-
sais termojutīgais polimērs ir neobligāti attīrīts poloksamērs 407.
7. Medikaments saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām preten-
zijām, kur minētās pirmās kompozīcijas pārejas temperatūra ir
diapazonā no 10 °C līdz 40 °C, vislabāk no 15 °C līdz 30 °C.
8. Medikaments saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pre-
tenzijām, kur minētā pirmā kompozīcija satur no 5 % līdz 30 %, vislabāk no 10 % līdz 25 % minētā inversā termojutīgā polimēra.
9. Medikaments saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām preten-
zijām, kur minētā inversā termojutīgā polimēra polidispersijas indekss
ir diapazonā no 1,5 līdz 1,0.
10. Medikaments saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur otro
kompozīciju.
11. Medikaments saskaņā ar 10. pretenziju, kur minētā otrā
kompozīcija satur kontrastvielu.
12. Medikaments saskaņā ar 11. pretenziju, kur minētā kontrast-
viela ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no radioaktīvi necauraidīgām
vielām, paramagnētiskām vielām, smagajiem atomiem, pārejas
metāliem, lantanīdiem, aktinīdiem, krāsvielām un radionukleotīdus
saturošām vielām.
13. Medikaments saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzi-
jām, kur minētais lūmens ir šāds orgāns vai tā daļa: niere, žultspūslis,
urīnvads, urīnpūslis, aizkuņģa dziedzeris, siekalu dziedzeris, tievā
zarna vai resnā zarna.
14. Medikaments saskaņā ar 13. pretenziju, kur minētais lūmens
ir urīnvads vai niere, vai to daļa.
15. Medikaments saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzi-
jām, kur minētā lietiāze ir izraisīta ar nierakmeni, aizkuņģa dziedzera
akmeni, siekalu akmeni vai žultsakmeni, visbiežāk ar nierakmeni.
16. Medikaments saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām preten-
zijām, kur minētais zīdītājs ir cilvēks.

3. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus ietver soli,
kurā individuālam izmērītais ar izotopu iezīmētās CO₂ daudzums vai
no tā iegūts farmakokinētisks parametrs tiek salīdzināts ar atbilstošu
izmērītu ar izotopu iezīmētās CO₂ daudzumu vai parametru veselam
individuālam ar normālu levodopas metabolisko kapacitāti.
4. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt ar izotopu iezīmētā
levodopa ir ar ¹³C iezīmēta levodopa.
5. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt ar izotopu iezīmētā
levodopa tiek ievadīta neinvazīvā ceļā.
6. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt ar izotopu iezīmētā
levodopa tiek ievadīta intravenozi vai perorāli.
7. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt izelotās ar izotopu
iezīmētās CO₂ daudzums tiek mērīts spektroskopiski vai ar masspek-
trometru.
8. Metode saskaņā ar 7. pretenziju, turklāt izelotās ar izotopu
iezīmētās CO₂ daudzums tiek mērīts ar infrasarkanās spektroskopijas
metodi.
9. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt izelotās ar izotopu
iezīmētās CO₂ daudzums katrai karbidopas devai tiek mērīts vismaz
trijos laika posmos, lai radītu līkni, kas parāda katrā reizē metabo-
lizētās ar izotopu iezīmētās levodopas daudzumu, un levodopas
metaboliskā kapacitāte tiek noteikta pēc laukuma zem vismaz vienas
no līknēm.
10. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt izelotās ar izotopu
iezīmētās CO₂ daudzums katrai karbidopas devai tiek mērīts vismaz
šādos laika momentos: t₀, brīdī pirms ar izotopu iezīmētās levodopas
ieņemšanas, t₁, brīdī, kad tiek sagaidīts, ka ar izotopu iezīmētā levo-
dopa ir vismaz daļēji absorbēta indivīda asinsritē, un t₂, brīdī, kad tiek
sagaidīts, ka levodopa ir sākusi elimināciju no indivīda organisma.
11. Metode saskaņā ar 3. pretenziju, turklāt farmakokinētiskais
parametrs ir izvēlēts no devas procentuālās izdalīšanās, laukuma
zem līknes un *delta* pret sākotnējo līmeni, kas iegūti no vismaz vienas
ieelpas un izelpas līknes, kas grafiski parāda ar izotopu iezīmēto CO₂,
ko indivīds ģenerējis, reaģējot uz karbidopas devu.
12. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt vismaz viena karbido-
pas deva individuālam tiek ievadīta pirms ar izotopu iezīmētās levodopas
ievadīšanas.
13. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt efektīvās dozēšanas
shēmas noteikšana ietver optimālās individuālam ievadāmās karbidopas
devas, ideālā laika karbidopas ievadīšanai individuālam vai optimāla
individuālam ievadāmo karbidopas devu skaita noteikšanu.
14. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt izotops ir vismaz
viens izotops, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no ¹³C, ¹⁴C un ¹⁸O.

(51) **A61K 51/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1898961**
A61K 31/198⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(21) 06780854.3 (22) 30.06.2006
(43) 19.03.2008
(45) 26.02.2014
(31) 695503 P (32) 30.06.2005 (33) US
(86) PCT/JP2006/313529 30.06.2006
(87) WO2007/004715 11.01.2007
(73) Otsuka America Pharmaceutical, Inc., 2440 Research
Boulevard, Rockville, MD 20850, US
(72) MODAK, Anil, S., US
KUROGI, Yasuhisa, US
(74) Murphy, Colm Damien, et al, Ipulse, 26 Mallinson Road,
London SW11 1BP, GB
Lūcija KUJZUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS,
a/k 61, Rīga, LV-1010, LV

(54) **METODE LEVODOPAS/KARBIDOPAS TERAPIJAS INDI-
VIDUALIZĒŠANAI AR ELPTESTA PALĪDZĪBU
METHOD TO INDIVIDUALIZE LEVODOPA/CARBIDOPA
THERAPY USING A BREATH TEST**

(57) 1. Metode levodopas/karbidopas terapijas individualizēšanai
zīdītāju klases individuālam, kas ietver šādus soļus:
i) ar izotopu iezīmētās CO₂ daudzuma mērīšanu, ko izelpojīs
indivīds, kam tikusi ievadīta ar izotopu iezīmēta levodopa un pirmā
karbidopas deva, turklāt ar izotopu iezīmētā CO₂ producējas ar izotopu
iezīmētās levodopas metabolisma procesā, un levodopas metabo-
liskās kapacitātes noteikšanu pēc izmērītā ar izotopu iezīmētās CO₂
daudzuma,
ii) iepriekšējā soļa atkārtotāni vismaz ar otru, atšķirīgu karbi-
dopas devu un
iii) efektīvas individuālam ievadāmās karbidopas dozēšanas shē-
mas noteikšanu.

2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt zīdītāju klases indi-
viduālam ir Pārkinsona slimība.

(51) **C07D 215/54**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1902029**
A61K 31/4709⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(21) 06774184.3 (22) 28.06.2006
(43) 26.03.2008
(45) 08.01.2014
(31) 696381 P (32) 01.07.2005 (33) US
(86) PCT/US2006/025160 28.06.2006
(87) WO2007/005462 11.01.2007
(73) Wyeth LLC, Five Giralda Farms, Madison, NJ 07940, US
(72) TESCONI, Marc, Sadler, US
FEIGELSON, Gregg, US
STRONG, Henry, US
WEN, Hong, 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) **4-[(2,4-DIHLOR-5-METOKSIFENIL)AMINO]-6-METOKSI-
7-[3-(4-METIL-1-PIPERAZINIL)PROPOKSI]-3-HINOLĪN-
KARBONITRILA KRISTĀLISKAS FORMAS UN METODES
TO IEGŪŠANAI
CRYSTALLINE FORMS OF 4-[(2,4-DICHLORO-5-METH-
OXYPHENYL)AMINO]-6-METHOXY-7-[3-(4-METHYL-
1-PIPERAZINYL)PROPOXY]-3-QUINOLINECARBO-
NITRILE AND METHODS OF PREPARING THE SAME**

(57) 1. 4-[(2,4-dihlor-5-metoksifenil)amino]-6-metoksi-7-[3-(4-
metil-1-piperazinil)propoksi]-3-hinolīnkarbonitrila monohidrāta izo-
lēta kristāliska forma I ar rentgenstaru difraktogrammu, kurā visi

raksturīgie maksimumu 2θ leņķi (°) ir pie aptuveni: 9,19, 11,48, 14,32, 22,33 un 25,84.

2. Kristāliskā forma saskaņā ar 1. pretenziju, kurā visi raksturīgie maksimumu 2θ leņķi (°) ir pie aptuveni: 9,19, 11,48, 14,32, 19,16, 19,45, 20,46, 21,29, 22,33, 23,96, 24,95, 25,29, 25,84, 26,55, 27,61 un 29,51.

3. 4-[(2,4-dihlor-5-metoksifenil)amino]-6-metoksi-7-[3-(4-metil-1-piperazinil)propoksi]-3-hinolīnkarbonitrila monohidrāta kristāliskā forma I saskaņā ar 1. pretenziju ar rentgenstaru difraktogrammu, kurā visi raksturīgie maksimumu 2θ leņķi (°) ir pie aptuveni: 9,19, 9,98, 11,48, 14,32, 14,85, 15,64, 19,16, 19,45, 19,71, 20,46, 21,29, 22,33, 22,58, 23,96, 24,95, 25,29, 25,84, 26,55, 27,61, 28,42, 29,51, 30,32, 31,40 un 32,39.

4. 4-[(2,4-dihlor-5-metoksifenil)amino]-6-metoksi-7-[3-(4-metil-1-piperazinil)propoksi]-3-hinolīnkarbonitrila monohidrāta kristāliskā forma I saskaņā ar 3. pretenziju, kuras rentgenstaru difraktogramma atbilst 1. zīmējumā attēlotajam A paraugam.

5. 4-[(2,4-dihlor-5-metoksifenil)amino]-6-metoksi-7-[3-(4-metil-1-piperazinil)propoksi]-3-hinolīnkarbonitrila monohidrāta izolēta kristāliska forma saskaņā ar 1. pretenziju ar temperatūru, kurā tā pārvēršas šķidrumā, no 109 °C līdz 115 °C.

6. 4-[(2,4-dihlor-5-metoksifenil)amino]-6-metoksi-7-[3-(4-metil-1-piperazinil)propoksi]-3-hinolīnkarbonitrila monohidrāta kristāliskā forma saskaņā ar 5. pretenziju ar temperatūru, kurā tā pārvēršas šķidrumā, aptuveni 112 °C.

7. Metode 4-[(2,4-dihlor-5-metoksifenil)amino]-6-metoksi-7-[3-(4-metil-1-piperazinil)propoksi]-3-hinolīnkarbonitrila monohidrāta (forma I) saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas satur posmu, kurā ar uzkaršētu ūdeni apstrādā bezūdens 4-[(2,4-dihlor-5-metoksifenil)amino]-6-metoksi-7-[3-(4-metil-1-piperazinil)propoksi]-3-hinolīnkarbonitrilu.

8. Metode 4-[(2,4-dihlor-5-metoksifenil)amino]-6-metoksi-7-[3-(4-metil-1-piperazinil)propoksi]-3-hinolīnkarbonitrila monohidrāta (forma I) saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas satur posmu, kurā, ar ūdeni apstrādājot, pārvērš 4-[(2,4-dihlor-5-metoksifenil)amino]-6-metoksi-7-[3-(4-metil-1-piperazinil)propoksi]-3-hinolīnkarbonitrila polimorfus, kuru rentgenstaru difraktogramma būtībā atbilst 1. un 11. zīmējumā attēlotajam B, C, D un F paraugam.

9. Metode saskaņā ar 7. pretenziju, kurā ūdeni uzkaršē līdz vismaz aptuveni 90 °C.

10. Metode saskaņā ar 9. pretenziju, kurā ūdeni uzkaršē līdz vismaz aptuveni 95 °C.

11. Metode saskaņā ar 8. pretenziju, kurā ūdens ir temperatūrā, kur netiek izmantots siltuma avots vai aukstuma avots.

12. Metode saskaņā ar 11. pretenziju, kurā ūdens ir istabas temperatūrā.

13. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur terapeitiski efektīvu kristāliskās formas I saskaņā ar 1. pretenziju, kuras rentgenstaru difraktogramma atbilst 1. zīmējumā attēlotajam A paraugam, daudzumu, kurā vairāk par 50 masas % ir kristāliskās formas, un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

14. Kompozīcija saskaņā ar 13. pretenziju, kas papildus satur etiķskābi.

15. Kompozīcija saskaņā ar 13. pretenziju, kas papildus satur detergentu.

16. Kompozīcija saskaņā ar 13. pretenziju, kas papildus satur 0,5 līdz 5,0 masas % detergenta un 0,01 līdz 0,1 masas % etiķskābes.

17. Kompozīcija saskaņā ar 13. pretenziju, kas papildus satur aptuveni 2 masas % detergenta un aptuveni 0,06 masas % etiķskābes.

18. Kompozīcija saskaņā ar 13. pretenziju, kurā farmaceutiski pieņemamais nesējs ir izvēlēts no cukura, poliola un celulozes vai to kombinācijām.

19. Kompozīcija saskaņā ar 18. pretenziju, kurā farmaceutiski pieņemamais nesējs ir poliols un celuloze.

20. Kompozīcija saskaņā ar 19. pretenziju, kurā poliols ir izvēlēts no mannitola, sorbitola un ksilitola.

21. Kompozīcija saskaņā ar 20. pretenziju, kurā poliols ir mannitols.

22. Kompozīcija saskaņā ar 21. pretenziju, kurā kristāliskā forma I saskaņā ar 1. pretenziju, mannitols un celuloze katrs ir klāt daudzumā no 20 līdz 50 masas %.

(51) **G06K 19/07**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1907993**

G06K 19/073⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

G06K 19/077⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(21) 06778905.7

(22) 24.07.2006

(43) 09.04.2008

(45) 04.12.2013

(31) 0507887

(32) 25.07.2005 (33) FR

(86) PCT/FR2006/001797

24.07.2006

(87) WO2007/012738

01.02.2007

(73) Oberthur Technologies, 420, rue d'Estiennes d'Orves, 92700 Colombes, FR

(72) GOYET, Christophe, FR

(74) Bonnans, Arnaud, Santarelli, 14 avenue de la Grande Armée BP 237, 75822 Paris Cedex 17, FR

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

(54) **ELEKTRONISKAIS OBJEKTS AR KONTAKTSAKARU UN TĀLSAKARU LĪDZEKĻIEM**
ELECTRONIC ENTITY WITH CONTACT AND REMOTE COMMUNICATION MEANS

(57) 1. Elektroniskais objekts, kas satur:

- kontaktsakaru līdzekļus (4, 14);

- bezkontakta sakaru līdzekļus (6, 16);

- atkārtoti ierakstāmu energoneatkarīgu atmiņas ierīci, kas nodrošina aktivēšanas informācijas glabāšanu;

kas raksturīgs ar:

- līdzekļiem aktivēšanas informācijas iestatīšanai par iepriekš noteiktu vērtību, saņemot caur kontaktsakaru līdzekļiem raidīto komandu;

- līdzekļiem (12) datu apmaiņas autorizēšanai vismaz caur bezkontakta sakaru līdzekļiem vienīgi minētās aktivēšanas informācijas iepriekš noteiktās vērtības klātbūtnē.

2. Elektroniskais objekts saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar līdzekļiem, kuri novērš minēto datu apmaiņu caur bezkontakta sakaru līdzekļiem, ja trūkst minētās aktivēšanas informācijas iepriekš noteiktā vērtība.

3. Elektroniskais objekts saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tas ir mikroshēmas plate.

4. Paņēmiens elektroniskā objekta, kas satur kontaktsakaru līdzekļus un bezkontakta sakaru līdzekļus, vadībai, kas raksturīgs ar atkārtoti ierakstāmu energoneatkarīgu atmiņas ierīci, kas nodrošina aktivēšanas informācijas glabāšanu, un ietver šādas stadijas:

- palaišanas komandas (E20) saņemšanu caur kontaktsakaru līdzekļiem;

- noteikto datu apmaiņas (E24) autorizēšanu vismaz caur bezkontakta sakaru līdzekļiem, iestatot minētās aktivēšanas informācijas iepriekš noteikto vērtību (E24) minētās aktivēšanas komandas saņemšanas brīdī;

- pārbaudi (E34), vai aktivēšanas informācijas nozīme ir vienāda ar iepriekš noteikto vērtību;

- minēto datu (E38, E42) apmaiņu caur bezkontakta sakaru līdzekļiem, kas notiek tikai pārbaudes gaitā konstatētās atbilstības gadījumā.

5. Paņēmiens saskaņā ar 4. pretenziju, kas raksturīgs ar stadiju, kurā aktivēšanas informācija tiek iestatīta ar vērtību, kas ir iepriekš noteiktās vērtības papildinājums (E40) konkrētajā laika brīdī.

6. Paņēmiens saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka konkrētais laika brīdis atbilst tam brīdim, kad tiek saņemta komanda sakaru (E14) beigšanai caur bezkontakta sakaru līdzekļiem.

7. Paņēmiens saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka konkrētais laika brīdis tiek noteikts ar laika aizkavi.

8. Paņēmiens saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka konkrētais laika brīdis tiek noteikts, saņemot caur bezkontakta sakaru līdzekļiem iepriekš noteiktu komandu skaitu.

9. Paņēmiens saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka konkrētais laika brīdis atbilst sakaru iniciēšanas (E38) stadijas beigām.

10. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 9. pretenzijai, turklāt kods tiek pārraidīts caur kontaktsakaru līdzekļiem, un minētā datu apmaiņas autorizēšana notiek, ja pārraidāmais kods atbilst elektroniskajā objektā glabājamam kodam.

11. Paņēmiens saskaņā ar 10. pretenziju, turklāt palaišanas komanda tiek saņemta kopā ar pārraidāmo kodu.

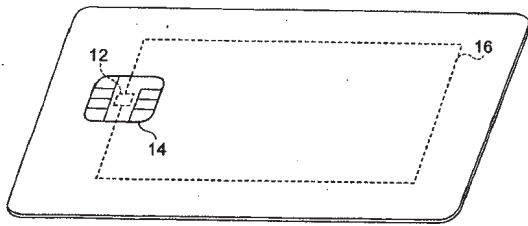
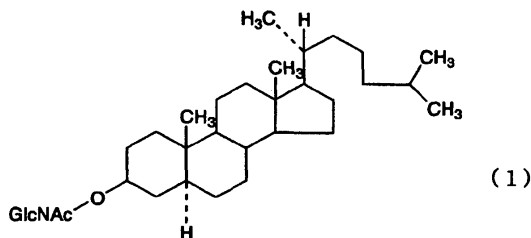
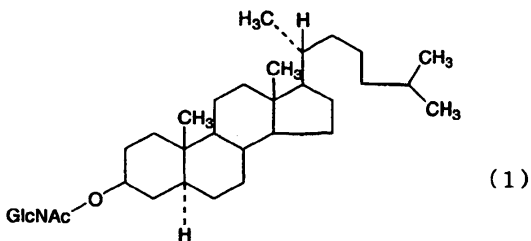


Fig. 4

- (51) **C07J 9/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1921086**
A61K 9/127⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/704⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 47/40⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 35/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 9/19⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 47/48⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 06797258.8 (22) 01.09.2006
(43) 14.05.2008
(45) 16.04.2014
(31) 2005255517 (32) 02.09.2005 (33) JP
(86) PCT/JP2006/317316 01.09.2006
(87) WO2007/026869 08.03.2007
(73) Otsuka Pharmaceutical Co., Ltd., 2-9, Kanda-Tsukasamachi, Chiyoda-ku, Tokyo 101-8535, JP
(72) YAZAWA, Shin, JP
NISHIMURA, Touyou, JP
NAKAGAWA, Takashi, JP
(74) Hartz, Nikolai, Wächtershäuser & Hartz Patentanwalts-partnerschaft, Ottostrasse 4, 80333 München, DE
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV
(54) **PRETAUDZĒJU LĪDZEKLIS ANTITUMOR AGENT**
(57) 1. Holesterolā savienojums, kas attēlots ar šādu formulu (1):



- vai ciklodekstrīna inklūzijas komplekss, kas satur savienojumu, izmantošanai par pretvēža līdzekli.
2. Liposomu kompozīcija, kas satur holesterolā savienojumu saskaņā ar 1. pretenziju.
3. Ciklodekstrīna inklūzijas komplekss, kas satur holesterolā savienojumu, kā aprakstīts 1. pretenzijā.
4. Inklūzijas komplekss saskaņā ar 3. pretenziju, kur ciklodekstrīns ir 2-hidroksipropil-β-ciklodekstrīns.
5. Holesterolā savienojuma, kas attēlots ar šādu formulu (1):



- vai ciklodekstrīna inklūzijas kompleksa, kas satur savienojumu, izmantošana pretvēža līdzekļa ražošanai.

- (51) **C07K 14/505**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2001903**
C07K 14/59⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 38/19⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 38/24⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C12N 15/62⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C12N 15/16⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C12N 15/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 07749922.6 (22) 05.02.2007
(43) 17.12.2008
(45) 29.01.2014
(31) 764761 P (32) 03.02.2006 (33) US
(86) PCT/US2007/003014 05.02.2007
(87) WO2007/094985 23.08.2007
(73) OPKO Biologics Ltd, 7 Golda Meir Street, 2nd floor, 74140 Nes Ziona, IL
(72) FARES, Fuad, IL
FIMA, Udi, Eyal, IL
(74) Korn, Richard Mervyn, et al, Pearl Cohen Zedek Latzer Baratz UK LLP, 15 Old Bailey, London EC4M 7EF, GB
Svetlana MAKEJEVA, Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV
(54) **ILGSTOŠAS DARBĪBAS POLIPEPTĪDI UN TO IEGŪŠANAS UN LIETOŠANAS PAŅĒMIENI LONG-ACTING POLYPEPTIDES AND METHODS OF PRODUCING AND ADMINISTERING SAME**
(57) 1. Polipeptīds, kas ietver interesējošo peptīdu, kur pirmais horiongonadotropīna C-gala peptīds (*carboxy terminal peptide*, CTP) ir pievienots minētā interesējošā peptīda N-galam, un otrs un trešais horiongonadotropīna C-gala peptīds ir pievienots minētā interesējošā peptīda C-galam, kur minētais interesējošais peptīds ir eritropoētīna (EPO) peptīds, kur CTP ir no cilvēka horiongonadotropīna beta apakšvienības,
kur CTP ietver aminoskābju secību SSSSKAPPPS, un kur EPO peptīds stimulē eritropoēzi.
2. Polipeptīds saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētais interesējošais peptīds ir glikozilēts.
3. Polipeptīds saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētais interesējošais peptīds ir neglikozilēts.
4. Polipeptīds saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētā EPO peptīda secība ietver aminoskābju secību, kas atlasīta no secībām, kas norādītas SEQ ID NO: 3 un SEQ ID NO: 6.
5. Polipeptīds saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kur vismaz viena horiongonadotropīna C-gala peptīda secība ietver aminoskābju secību, kas atlasīta no secībām, kas norādītas SEQ ID NO: 17 un SEQ ID NO: 18.
6. Polipeptīds saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kur vismaz viena horiongonadotropīna C-gala peptīda secība ir safsināta, un kur minētais safsinātais C-gala peptīds ietver vismaz vienu glikozilēšanas vietu.
7. Polipeptīds saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kur vismaz viens horiongonadotropīna C-gala peptīds ir glikozilēts.
8. Polipeptīds saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas papildus ietver signālpeptīdu.
9. Polipeptīds saskaņā ar 8. pretenziju, kur minētais signālpeptīds ietver aminoskābju secību, kas norādīta SEQ ID NO: 19.
10. Farmaceutiska kompozīcija, kas ietver polipeptīdu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai.
11. Polinukleotīds, kas kodē polipeptīdu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai.
12. Polinukleotīds saskaņā ar 11. pretenziju, kur minētā polinukleotīda nukleīnskābju secība ietver secību, kas norādīta SEQ ID NO: 21.
13. Polinukleotīds saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 12. pretenzijai, kur minētais polipeptīds papildus ietver signālpeptīdu.
14. Ekspresijas vektors, kas ietver polinukleotīdu saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 13. pretenzijai.
15. Šūna, kas ietver ekspresijas vektoru saskaņā ar 14. pretenziju.
16. Farmaceutiska kompozīcija, kas ietver polinukleotīdu saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 13. pretenzijai, ekspresijas vektoru saskaņā ar 14. pretenziju, šūnu saskaņā ar 15. pretenziju, vai to kombināciju.
17. Paņēmiens bioloģiskā pusperioda uzlabošanai un interesējošā peptīda bioloģiskās aktivitātes saglabāšanai, kas ietver

darbību, kurā minētā interesējošā peptīda N-galam pievieno pirmā horiogonadotropīna C-gala peptīdu (CTP), un otrā un trešā horiogonadotropīna C-gala peptīdu pievieno minētā interesējošā peptīda C-galam, tādā veidā uzlabojot minētā interesējošā peptīda bioloģisko pusperiodu, kur minētais interesējošais peptīds ir eritropoētīns (EPO),

kur CTP ir no cilvēka horiogonadotropīna beta apakšvienības, kur CTP ietver aminoskābju secību SSSSKAPPPS, un kur EPO peptīds stimulē eritropoēzi.

18. Paņēmiens saskaņā ar 17. pretenziju, kur vismaz viena horiogonadotropīna C-gala peptīda secība ietver aminoskābju secību, kas atlasīta no secībām, kas norādītas SEQ ID NO: 17 līdz SEQ ID NO: 18.

19. Polipeptīds saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, vai polinukleotīds saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 13. pretenzijai, lietošanai anēmijas ārstēšanā vai anēmijas biežuma samazināšanā.

20. Polipeptīds vai polinukleotīds lietošanai saskaņā ar 19. pretenziju, kur vismaz viena horiogonadotropīna C-gala peptīda secība ietver aminoskābju secību, kas atlasīta no secībām, kas norādītas SEQ ID NO: 17 līdz SEQ ID NO: 18.

(51) **A61K 31/522⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2015754**

A61K 31/4985⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 3/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 9/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(21) 07728723.3 (22) 03.05.2007

(43) 21.01.2009

(45) 09.04.2014

(31) 06009203 (32) 04.05.2006 (33) EP

(86) PCT/EP2007/054270 03.05.2007

(87) WO2007/128761 15.11.2007

(73) Boehringer Ingelheim International GmbH, Binger StraÙe 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE

(72) DUGI, Klaus, DE
HIMMELSBACH, Frank, DE
MARK, Michael, DE

(74) Simon, Elke Anna Maria, et al, Boehringer Ingelheim GmbH, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE
Aleksandra FORTUNA, FORAL Intelektuālā Tpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV

(54) **DPP-IV INHIBITORA IZMANTOŠANA
USES OF DPP-IV INHIBITORS**

(57) 1. DPP IV inhibitora izmantošana medikamenta makrovaskulāra komplikāciju riska samazināšanai pacientam, kuram ir diagnosticēts priekšdiabēta stāvoklis vai manifests (jau esošs) 2. tipa cukura diabēts, iegūšanai,

kur DPP IV inhibitors ir 1-[(4-metilhinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-(3-(R)-aminopiperidin-1-il)ksantīns vai tā terapeitiski aktīvs sāls.

2. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka makrovaskulāra komplikācija ir izvēlēta no miokarda infarkta, akūta koronārā sindroma, nestabilās stenokardijas, stabilās stenokardijas, hemorāģiskā vai išēmiskā insulta, perifēro artēriju oklūzijas, kardiomiopātijas, sirds kreisās puses mazspējas, sirds labās puses mazspējas, globālās sirds mazspējas, sirds ritma traucējumiem un asinsvadu restenozes.

3. DPP IV inhibitors vai šī DPP IV inhibitora aktīvās vielas kombinācija ar citu aktīvu vielu 2. tipa cukura diabēta vai priekšdiabēta stāvokļa pacientu makrovaskulāru komplikāciju profilaksei vai mazināšanai, kur DPP IV inhibitors ir 1-[(4-metilhinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-(3-(R)-aminopiperidin-1-il)ksantīns vai tā terapeitiski aktīvs sāls.

4. DPP IV inhibitors 1-[(4-metilhinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-(3-(R)-aminopiperidin-1-il)ksantīns vai tā terapeitiski aktīvs sāls, vai aktīvas vielas kombinācija ar citu aktīvu vielu izmantošanai saskaņā ar 3. pretenziju, kur makrovaskulārā komplikācija ir izvēlēta no miokarda infarkta, akūta koronārā sindroma, nestabilās stenokardijas, stabilās stenokardijas, insulta, perifēro artēriju oklūzijas, kardiomiopātijas, sirds mazspējas, sirds ritma traucējumiem un asinsvadu restenozes.

5. 1-[(4-metilhinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-(3-(R)-aminopiperidin-1-il)ksantīna DPP IV inhibitors vai tā terapeitiski

aktīvs sāls, vai aktīvas vielas kombinācija ar citu aktīvu vielu izmantošanai saskaņā ar 3. vai 4. pretenziju, kur pacienti tiek ārstēti ilgāku laika periodu no 1 līdz 6 gadiem.

(51) **C07K 16/28⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2032606**

A61K 47/48⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(21) 07797844.3 (22) 29.05.2007

(43) 11.03.2009

(45) 27.11.2013

(31) 809328 P (32) 30.05.2006 (33) US

908941 P 29.03.2007 US

911829 P 13.04.2007 US

(86) PCT/US2007/069889 29.05.2007

(87) WO2007/140371 06.12.2007

(73) Genentech, Inc., 1 DNA Way, South San Francisco CA 94080-4990, US

(72) EBENS, Allen J., Jr., US

GRAY, Alane M., US

LIANG, Wei-Ching, US

WU, Yan, US

YU, Shang-Fan, US

(74) Woolley, Lindsey Claire, et al, Mewburn Ellis LLP, 33 Gutter Lane, London EC2V 8AS, GB

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

(54) **ANTIVIELAS UN IMUNOKONJUGĀTI UN TO PIELIETOJUMI**

ANTIBODIES AND IMMUNOCONJUGATES AND USES THEREFOR

(57) 1. Imunokonjugāts, kas ietver monoklonālo antivielu vai tās fragmentu, kura saista CD22, kovalenti savienotu ar citotoksisku aģentu, raksturīgs ar to, ka anti viela ietver smagās ķēdes variablu domēnu ar aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 16, un vieglās ķēdes variablu domēnu ar aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 18.

2. Imunokonjugāts saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīgs ar to, ka anti viela ietver:

(i) smago ķēdi, kuras sekvenca ir vismaz 90 % identiska aminoskābju sekvencei SEQ ID NO: 88, un/vai

(ii) vieglo ķēdi, kuras sekvenca ir vismaz 90 % identiska aminoskābju sekvencei SEQ ID NO: 87.

3. Imunokonjugāts saskaņā ar jebkuru 1. vai 2. pretenziju, raksturīgs ar to, ka CD22 ir zīdītāja CD22.

4. Imunokonjugāts saskaņā ar 3. pretenziju, raksturīgs ar to, ka CD22 ir cilvēka CD22.

5. Imunokonjugāts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 2. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka anti viela saistās ar epitopu CD22 rajonā, kas atbilst aminoskābēm 22 līdz 240 sekvencē SEQ ID NO: 27.

6. Imunokonjugāts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka anti viela ir anti vielas fragments, izvēlēts no fragmentiem Fab, Fab'-SH, Fv, scFv vai F(ab')₂.

7. Imunokonjugāts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka citotoksiskais aģents ir izvēlēts no toksīna, ķīmijterapijas aģenta, medikamenta, antibiotikas, radioaktīva izotopa un nukleolītiska enzīma.

8. Imunokonjugāts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, aprakstāms ar formulu Ab-(L-D)_p, raksturīgs ar to, ka

(a) Ab ir anti viela, kā definēts jebkurā no 1. līdz 6. pretenzijai,

(b) L ir linkers,

(c) D ir medikamenta daļa.

9. Imunokonjugāts saskaņā ar 8. pretenziju, raksturīgs ar to, ka:

(i) L ir izvēlēts no 6-maleīnimidokaproilgrupas (MC), maleīnimidopropanoilgrupas (MP), valīncitrulīngrupas (val-cit vai vc), alanīnfenilalanīngrupas (ala-phe), para-aminobenziloksikarbonilgrupas (PAB), N-sukcinimidil-4-(2-piridilīto)pentanoātgrupas (SPP), N-sukcinimidil-4-(N-maleīnimidometil)cikloheksān-1-karboksilātgrupas (SMCC), un N-sukcinimidil-(4-jodacetil)aminobenzoātgrupas (SIAB);

(ii) linkers savienots ar anti vielu caur anti vielas tiolgrupu,

(iii) linkers ir sašķelams ar proteāzi,

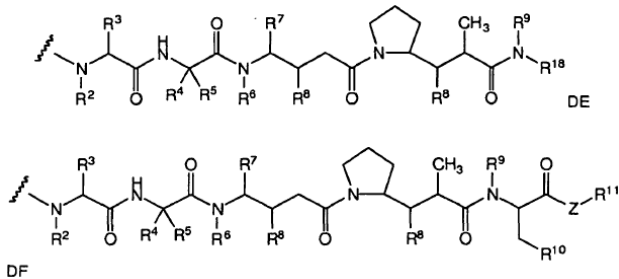
(iv) linkers ietver dipeptīdu valīncitrulīnu (val-cit vai vc),

(v) linkers ietver p-aminobenzilgrupu, kura neobligāti ir p-aminobenziloksikarbonilgrupa (PAB),

(vi) linkers ietver 6-maleīnimidokaproilgrupu (MC), vai
 (vii) linkers ietver 6-maleīnimidokaproilgrupu (MC), dipeptīdu vai
 lincitruilīnu (val-cit vai vc) un p-aminobenziloksikarbonilgrupu (PAB).

10. Imunokonjugāts saskaņā ar 8. pretenziju, raksturīgs ar to, ka D ir izvēlēts no auristatīna un dolostatīna.

11. Imunokonjugāts saskaņā ar 10. pretenziju, raksturīgs ar to, ka D ir medikamenta daļa ar formulu DE vai DF:



un raksturīgs ar to, ka R² un R⁶ katrs ir metilgrupa, R³ un R⁴ katrs ir izopropilgrupa, R⁷ ir sec-butilgrupa, katrs R⁸ ir neatkarīgi izvēlēts no CH₃, O-CH₃, OH un H; R⁹ ir H, R¹⁰ ir arilgrupa, Z ir -O- vai -NH-, R¹¹ ir H, (C₁-C₈)alkilgrupa vai -(CH₂)₂-O-(CH₂)₂-O-(CH₂)₂-O-CH₃, un R₁₈ ir -C(R₈)₂-C(R₈)₂-arilgrupa, un
 (d) p sniedzas apmēram no 1 līdz 8.

12. Imunokonjugāts saskaņā ar 11. pretenziju, raksturīgs ar to, ka medikaments ir izvēlēts no MMAE un MMAF.

13. Imunokonjugāts saskaņā ar 8. pretenziju, raksturīgs ar to, ka imunokonjugāts atbilst formulai



kur L ir linkers un p ir robežās no 2 līdz 5, vai arī atbilst formulai



kur L ir linkers un p ir robežās no 2 līdz 5.

14. Imunokonjugāts saskaņā ar 13. pretenziju, raksturīgs ar to, ka L ietver val-cit (vc), MC, PAB, MC-PAB vai MC-vc-PAB.

15. Imunokonjugāts saskaņā ar 8. vai 14. pretenziju, raksturīgs ar to, ka L ir MC-vc-PB un D ir MMAE vai MMAF.

16. Imunokonjugāts saskaņā ar 8. pretenziju, raksturīgs ar to, ka D ir maitansinoīds.

17. Imunokonjugāts saskaņā ar 16. pretenziju, raksturīgs ar to, ka D ir izvēlēts no DM1, DM3 un DM4.

18. Imunokonjugāts saskaņā ar 17. pretenziju, raksturīgs ar to, ka:

(i) L ir izvēlēts no N-sukcinimidil-4-(2-piridilīto)pentanoātgrupas (SPP), N-sukcinimidil 4-(N-maleīnimidometil)cikloheksān-1-karboksilātgrupas (SMCC), un N-sukcinimidil (4-jodoacetil)amino- benzonoātgrupas (SIAB),

- (ii) linkers ir savienots ar antivielu caur antivielas tiolgrupu,
- (iii) linkers ietver SPP,
- (iv) linkers ietver SMCC,
- (v) p ir robežās 2-4 vai 3-4.

19. Farmaceutiska kompozīcija, kas ietver imunokonjugātu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 18. pretenzijai, un farmaceitiski pieņemamu nesēju.

20. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 19. pretenziju, pielietošanai metodē B šūnu proliferatīvās slimības ārstēšanai.

21. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 19. pretenziju, pielietošanai saskaņā ar 20. pretenziju, raksturīga ar to, ka B šūnu proliferatīvā slimība ir izvēlēta no limfomas, ne-Hodžkina limfomas (NHL), agresīvās NHL, recidivējošās agresīvās NHL, recidivējošās kūtrās NHL, refraktārās NHL, refraktārās kūtrās NHL, hroniskās limfocītiskās leukēmijas (CLL), sīkšūnu limfocītu limfomas, leukēmijas, mataino šūnu leukēmijas (HCL), akūtās limfocītiskās leukēmijas (ALL), un mantijas šūnu limfomas.

22. *In vitro* metode B šūnu proliferācijas inhibīcijai, kas ietver šūnu eksponēšanu ar minēto imunokonjugātu apstākļos, kas ļauj imunokonjugātam saistīties ar CD22.

23. Imunokonjugāts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 18. pretenzijai, pielietošanai saskaņā ar 22. pretenziju, raksturīgs ar to, ka B šūnu proliferācija ir saistīta ar traucējumu, izvēlētu no limfomas, ne-Hodžkina limfomas (NHL), agresīvās NHL, recidivējošās agresīvās NHL,

recidivējošās kūtrās NHL, refraktārās NHL, refraktārās kūtrās NHL, hroniskās limfocītiskās leukēmijas (CLL), mazo limfocītu limfomas, leukēmijas, mataino šūnu leukēmijas (HCL), akūtās limfocītiskās leukēmijas (ALL), un mantijas šūnu limfomas.

- (51) **C12N 9/24**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2041277**
C12P 7/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C12P 19/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 07784889.3 (22) 02.07.2007
 (43) 01.04.2009
 (45) 12.03.2014
 (31) 0612976 (32) 30.06.2006 (33) GB
 (86) PCT/BE2007/000072 02.07.2007
 (87) WO2008/000050 03.01.2008
 (73) Cargill, Incorporated, 15407 McGinty Road West, Wayzata, MN 55391, US
 (72) BROEKAERT, Willem, BE
 COURTIN, Christophe, BE
 DELCOUR, Jan, BE
 (74) Gowshall, Jonathan Vallance, et al, Forresters Skygarden, Erika-Mann-Strasse 11, 80636 München, DE
 Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV
 (54) **METODE ŠĶĪSTOŠU ARABINOKSILĀNU IEGŪŠANAI PILNGRAUDŪ PUTRAIMU FERMENTĀCIJAS BLAKUS-PRODUKTA VEIDĀ**
METHOD FOR MAKING SOLUBLE ARABINOXYLANS AS CO-PRODUCT OF FERMENTATION OF WHOLE-GRAIN CEREALS
 (57) 1. Metode etanola un šķīstošus arabinoksilānus saturoša preparāta kopējai iegūšanai, kas satur šādus posmus, kuros:
 (a) maltu arabinoksilānu saturošu graudu materiālu samaisa ar ūdeni, iegūstot misu;
 (b) misu sašķidrina amilāzes klātbūtnē;
 (c) veic sašķidrinātās misas pārcukurošanu amiloglikozidāzes klātbūtnē;
 (d) veic pārcukurotās misas fermentāciju ar mikroorganismu, kas kā fermentācijas produktu producē galvenokārt etanolu;
 (e) veic fermentētās misas destilāciju, iegūstot etanola frakciju un pilnu kuba palieku frakciju;
 (f) pilnu kuba palieku frakciju atdala, iegūstot cietu vielu frakciju (destilācijas mitrās paliekas) un šķidru frakciju (šķidru destilātu);
 un raksturojama ar to, ka minētajā metodē, izmantojot enzīmu preparātu, kurš satur endoksilanāzi, kas pieder pie glikozīdu hidrolāzes saimes 11 endoksilanāzēm, izšķīdina vismaz 15 % ar ūdeni neekstrahējamu arabinoksilānu, kurus satur minētais graudu materiāls, pēc tam seko šķīstošo arabinoksilānu saturošo preparātu izolēšana, kurā enzīmu preparātu misai pievieno vienā vai vairākos (b), (c) un (d) posmos un kurā (f) posmā iegūto šķidro frakciju, kas satur ūdenī šķīstošos arabinoksilānus, izolē, un kurā minētais izolētais preparāts, kas satur šķīstošos arabinoksilānus, satur vismaz 20 % ūdenī šķīstošo arabinoksilānu no kopējās sausās masas.
 2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kurā solubilizē vismaz 25 % ar ūdeni neekstrahējamu arabinoksilānu, kurus satur minētais graudu materiāls.
 3. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kurā solubilizē vismaz 40 % ar ūdeni neekstrahējamu arabinoksilānu, kurus satur minētais graudu materiāls.
 4. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kurā solubilizē vismaz 50 % ar ūdeni neekstrahējamu arabinoksilānu, kurus satur minētais graudu materiāls.
 5. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kurā (c) un (d) posmus, vai (b), (c) un (d) posmus veic vienlaicīgi.
 6. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kur minētā endoksilanāze ir glikozīdu hidrolāzes saimes 11 endoksilanāze no *Bacillus subtilis*.
 7. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kur minētā endoksilanāze ir glikozīdu hidrolāzes saimes 11 endoksilanāze no *Hypocrea jecorina*.
 8. Metode saskaņā ar 7. pretenziju, kur minētā endoksilanāze satur aminoskābes secību SEQ ID NO: 1.

9. Metode saskaņā ar 7. pretenziju, kur minētā endoksilanāze satur aminoskābes secību, kas ir vismaz 80 % SEQ ID NO: 1 homologs.

10. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kur minētais enzīmu preparāts satur papildu enzīmus, izvēloties no rindas, kas sastāv no alfa L-arabinofuranozidāzēm, metilglikuronidāzēm, feruloilesterāzēm, beta glikanāzēm un celulāzēm.

11. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kur minēto šķīdno frakciju, kas satur šķīstošos arabinoksilānus, kondensē.

12. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, kur minētais izolētais preparāts, kas satur šķīstošos arabinoksilānus, satur vismaz 40 % ūdenī šķīstošo arabinoksilānu no kopējās sausās masas.

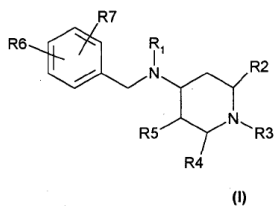
13. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai, kur minētais izolētais preparāts, kas satur šķīstošos arabinoksilānus, satur abarbinoksilānus ar vidējo polimerizācijas pakāpi no 3 līdz 200.

14. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai, kur minētais izolētais preparāts, kas satur šķīstošos arabinoksilānus, satur arabinoksilānus ar vidējo polimerizācijas pakāpi no 5 līdz 20.

15. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur arabinoksilānu saturošais graudu materiāls satur vismaz 4 % (pēc masas) arabinoksilānu.

16. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kur arabinoksilānu saturošais graudu materiāls satur vismaz 8 % (pēc masas) arabinoksilānu.

- (51) **C07D 401/12**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2049517**
C07D 311/30⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/455⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 9/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 211/58⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 401/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 413/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 417/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 07786158.1 (22) 18.07.2007
(43) 22.04.2009
(45) 27.11.2013
(31) 06117541 (32) 20.07.2006 (33) EP
887058 P 29.01.2007 US
(86) PCT/EP2007/006384 18.07.2007
(87) WO2008/009435 24.01.2008
(73) Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH
(72) IMASE, Hidetomo, JP
IWAKI, Yuki, JP
KAWANAMI, Toshio, JP
MIYAKE, Takahiro, JP
MOGI, Muneto, JP
OHMORI, Osamu, JP
QIN, Hongbo, JP
UMEMURA, Ichiro, JP
YAMADA, Ken, JP
YASOSHIMA, Kayo, JP
- (74) Vögeli-Lange, Regina, Novartis Pharma AG, Patent Department, 4002 Basel, CH
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV
- (54) **AMINOPIPERIDĪNA ATVASINĀJUMI KĀ CETP INHIBITORI**
AMINO-PIPERIDINE DERIVATIVES AS CETP INHIBITORS
- (57) 1. Savienojums ar formulu (I):



kur R1 ir cikloalkilgrupa, heterociklilgrupa, arilgrupa, alkil-O-C(O)-, alkanoilgrupa vai alkilgrupa, kur katru cikloalkilgrupu, heterociklilgrupu vai arilgrupu neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim aizvieto-

tājiem, izvēloties no alkilgrupas, arilgrupas, halogēnalkilgrupas, hidroksilgrupas, halogēna, nitrogrupas, karboksilgrupas, tiolgrupas, ciāngrupas, HSO₃-, cikloalkilgrupas, alkenilgrupas, alkoksigrupas, cikloalkoksigrupas, alkeniloksigrupas, alkil-O-C(O)-, alkanoilgrupas, karbamoilgrupas, alkil-S-, alkil-SO-, alkil-SO₂-, aminogrupas, vien- vai divaizvietotas (alkil, cikloalkil, aril un/vai arilalkil)aminogrupas, H₂N-SO₂-, vai heterociklilgrupas, un/vai katru alkanoilgrupu, alkil-O-C(O)-, alkilgrupu, alkoksigrupu vai heterociklilgrupu papildus neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēloties no hidroksilgrupas, alkilgrupas, halogēna atoma, nitrogrupas, karboksilgrupas, tiolgrupas, ciāngrupas, HSO₃-, cikloalkilgrupas, alkenilgrupas, alkoksigrupas, cikloalkoksigrupas, alkeniloksigrupas, alkil-O-C(O)-, alkanoilgrupas, karbamoilgrupas, alkil-S-, alkil-SO-, alkil-SO₂-, aminogrupas, vien- vai divaizvietotas (alkil, cikloalkil, aril un/vai arilalkil)aminogrupas, H₂N-SO₂-, vai heterociklilgrupas; R2 ir alkilgrupa, cikloalkilgrupa, cikloalkilalkilgrupa vai alkoksigrupa, kur katru alkilgrupu, cikloalkilgrupu vai alkoksigrupu neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēloties no alkilgrupas, alkoksigrupas vai halogēna atoma; R3 ir R8-O-C(O)-, (R8)(R9)N-C(O)-, R8-C(O)-, R8-S(O)₂-, alkilgrupa, cikloalkilgrupa vai arilalkilgrupa, kur katru alkilgrupu, cikloalkilgrupu vai aril-alkilgrupu neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēloties no alkilgrupas, hidroksilgrupas, halogēna atoma, nitrogrupas, karboksilgrupas, tiolgrupas, ciāngrupas, HSO₃-, cikloalkilgrupas, alkenilgrupas, alkoksigrupas, cikloalkoksigrupas, alkeniloksigrupas, alkil-O-C(O)-, alkanoilgrupas, karbamimidoilgrupas, alkil-S-, alkil-SO-, alkil-SO₂-, aminogrupas, H₂N-SO₂-, heterociklilgrupas, kur R8 un R9 neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa, cikloalkilgrupa, arilgrupa, aril-alkilgrupa vai cikloalkil-alkilgrupa, katru alkilgrupu, cikloalkilgrupu, arilgrupu, aril-alkilgrupu vai cikloalkil-alkilgrupu neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēloties no alkilgrupas, hidroksilgrupas, halogēna atoma, nitrogrupas, karboksilgrupas, tiolgrupas, ciāngrupas, HSO₃-, cikloalkilgrupas, alkenilgrupas, alkoksigrupas, cikloalkoksigrupas, alkeniloksigrupas, alkil-O-C(O)-, alkanoilgrupas, karbamimidoilgrupas, alkil-S-, alkil-SO-, alkil-SO₂-, aminogrupas, H₂N-SO₂-, heterociklilgrupas; R4 un R5 neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa, alkoksigrupa, cikloalkilgrupa, arilgrupa, heteroarilgrupa, aril-alkilgrupa, cikloalkil-alkilgrupa vai heteroaril-alkilgrupa, kur katru alkilgrupu, cikloalkilgrupu, arilgrupu, heteroarilgrupu, aril-alkilgrupu, cikloalkil-alkilgrupu vai heteroaril-alkilgrupu neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēloties no alkilgrupas, hidroksilgrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, nitrogrupas, karboksilgrupas, tiolgrupas, ciāngrupas, HSO₃-, cikloalkilgrupas, alkenilgrupas, alkoksigrupas, cikloalkoksigrupas, alkeniloksigrupas, alkil-O-C(O)-, alkanoilgrupas, karbamimidoilgrupas, alkil-S-, alkil-SO-, alkil-SO₂-, aminogrupas, vien- vai divaizvietotas (alkil, cikloalkil, aril un/vai aril-alkil-)aminogrupas, H₂N-SO₂-, heterociklilgrupas, ar nosacījumu, ka R4 un R5 nevar būt ūdeņraža atoms vienlaikus; R6 un R7 neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, halogēna atoms, ciāngrupa, nitrogrupa, hidroksilgrupa, aminogrupa, dialkilaminogrupa vai alkoksigrupa, halogēnalkoksigrupa; vai R6 ir arilgrupa, heteroarilgrupa vai alkil-S(O)₂-, kur katru arilgrupu vai heteroarilgrupu neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēloties no alkilgrupas, hidroksilgrupas, halogēna atoma, nitrogrupas, karboksilgrupas, tiolgrupas, ciāngrupas, HSO₃-, cikloalkilgrupas, alkenilgrupas, alkoksigrupas, cikloalkoksigrupas, alkeniloksigrupas, alkil-O-C(O)-, alkanoilgrupas, karbamimidoilgrupas, alkil-S-, alkil-SO-, alkil-SO₂-, aminogrupas, H₂N-SO₂-, heterociklilgrupas; vai tā farmaceutiski pieņemams sāls; vai tā optisks izomērs; vai optisku izomēru maisījums, ar nosacījumu, ka, ja R2 un R5 neatkarīgi ir alkilgrupa un R4 ir ūdeņraža atoms, tad R6 vai R7 nevar būt ūdeņraža atoms vai alkoksigrupa.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur R1 ir alkil-O-C(O)- vai heteroarilgrupa, ko neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēloties no halogēna atoma, heteroarilgrupas, hidroksilgrupas, alkoksigrupas, nearomātiskas heterociklilgrupas, alkilgrupas vai dialkilaminogrupas, kur katru heteroarilgrupu, alkoksigrupu, alkilgrupu un nearomātisku heterociklilgrupu arī neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēloties no alkilgrupas, hidroksilgrupas, alkil-O-C(O)-, karboksilgrupas, alkil-SO₂-, alkoksigrupas, dialkilaminogrupas vai nearomātiskas heterociklilgrupas vai alkanoilgrupas; R2 ir alkilgrupa;

R3 ir R8-C(O)- vai R8-O-C(O)-, kur R8 ir alkilgrupa, nearomātiska heterociklilgrupa vai cikloalkilgrupa, un katru alkilgrupu, nearomātisku heterociklilgrupu vai cikloalkilgrupu neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēloties no alkanoilgrupas, alkil-C(O)-O- vai hidroksilgrupas;

R4 ir aril-alkilgrupa, alkilgrupa vai heteroarilgrupa, katru no kurām neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēloties no alkilgrupas, halogēna atoma vai hidroksilgrupas;

R5 ir ūdeņraža atoms vai alkilgrupa;

R6 un R7 neatkarīgi ir halogēnalkilgrupa, ūdeņraža atoms vai alkoksigrupa; vai

tā farmaceitiski pieņemams sāls; vai tā optisks izomērs; vai optisku izomēru maisījums.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur R1 ir (C₁-C₄)alkil-O-C(O)- vai 5- līdz 7-locekļu heteroarilgrupa, ko neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēloties no halogēna atoma, 5- līdz 7-locekļu heteroarilgrupas, (C₁-C₄)alkoksigrupas, 5- līdz 7-locekļu nearomātiskas heterociklilgrupas, (C₁-C₄)alkilgrupa vai (C₁-C₄)dialkilaminogrupas, kur (C₁-C₄)alkilgrupu neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim hidroksilgrupām, 5- līdz 7-locekļu nearomātisku heterociklilgrupu neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim alkanoilgrupām, un kur katru 5- līdz 7-locekļu heteroarilgrupu un (C₁-C₄)alkoksigrupu papildus neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēloties no (C₁-C₄)alkilgrupas, hidroksilgrupas, (C₁-C₄)alkil-OC(O)-, (C₁-C₄)alkil-SO₂-(C₁-C₄)alkoksigrupas, (C₁-C₄)dialkilaminogrupas vai 5- līdz 7-locekļu nearomātiskas heterociklilgrupas;

R2 ir (C₁-C₄)alkilgrupa;

R3 ir R8-C(O)- vai R8-O-C(O)-, kur R8 ir (C₁-C₄)alkilgrupa, 5- līdz 7-locekļu nearomātiska heterociklilgrupa vai (C₅-C₇)cikloalkilgrupa, katru (C₁-C₄)alkilgrupu, 5- līdz 7-locekļu nearomātisku heterociklilgrupu un (C₅-C₇)cikloalkilgrupu neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēloties no (C₁-C₄)alkanoilgrupas, (C₁-C₄)alkil-C(O)-O- vai hidroksilgrupas;

R4 ir (C₅-C₇)aril-(C₁-C₄)alkilgrupa, (C₁-C₄)alkilgrupa vai 5- līdz 7-locekļu heteroarilgrupa, katru no kurām neobligāti aizvieto ar vienu līdz trim aizvietotājiem, izvēloties no (C₁-C₄)alkilgrupas, halogēna atoma vai hidroksilgrupas;

R5 ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₄)alkilgrupa;

R6 un R7 neatkarīgi ir (C₁-C₄)halogēnalkilgrupa, halogēna atoms vai (C₁-C₄)alkoksigrupa; vai tā farmaceitiski pieņemams sāls; vai tā optisks izomērs; vai optisku izomēru maisījums.

4. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, izmantošanai CETP aktivitātes inhibēšanai pacientā.

5. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, izmantošanai, ārstējot pacientam traucējumu vai slimību, ko pastarpina CETP vai, kas ir reaģētspējīga pret CETP inhibēšanu.

6. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 5. pretenziju, kur traucējumu vai slimību izvēlas no hiperlipidēmijas, arteriosklerozes, aterosklerozes, perifērās vaskulārās slimības, dislipidēmijas, hiperbetalipoproteinēmijas, hipoalfalipoproteinēmijas, hiperholesterolēmijas, hipertrigliceridēmijas, pārmantotas hiperholesterolēmijas, kardiovaskulāra traucējuma, koronārās sirds slimības, koronārās artēriju slimības, koronārās vaskulārās slimības, stenokardijas, išēmijas, sirds išēmijas, trombozes, sirds infarkta, tāda kā miokarda infarkts, sirds trieka, perifērās vaskulārās slimības, reperfūzijas bojājuma, angioplastikas restenozes, hipertensijas, sirds nepietiekamības, diabēta, tāda kā II tipa cukura diabēts, diabētiskām vaskulārām komplikācijām, aptaukošanās vai endotoksēmijas.

7. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur terapeitiski efektīvu savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai daudzumu un vienu vai vairākus farmaceitiski pieņemamus nesējus.

8. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur terapeitiski efektīvu savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai daudzumu un vienu vai vairākus terapeitiski aktīvus līdzekļus, izvēloties no rindas, kas sastāv no:

(i) HMG-Co-A reduktāzes inhibitora vai tā farmaceitiski pieņemama sāls,

(ii) angiotenzīna II receptora antagonista vai tā farmaceitiski pieņemama sāls,

(iii) angiotenzīnu pārveidojoša enzīma (ACE) inhibitora vai tā farmaceitiski pieņemama sāls,

(iv) kalcija kanāla bloķētāja vai tā farmaceitiski pieņemama sāls,

(v) aldosterona sintāzes inhibitora vai tā farmaceitiski pieņemama sāls,

(vi) aldosterona antagonista vai tā farmaceitiski pieņemama sāls,

(vii) duālā angiotenzīna pārveidojoša enzīma/neitrālās endopeptidāzes (ACE/NEP) inhibitora vai tā farmaceitiski pieņemama sāls,

(viii) endotelīna antagonista vai tā farmaceitiski pieņemama sāls,

(ix) renīna inhibitora vai tā farmaceitiski pieņemama sāls,

(x) diurētiska līdzekļa vai tā farmaceitiski pieņemama sāls,

(xi) ApoA-I mimētiķa; un

(xii) DGAT inhibitora.

9. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, izmantošanai par medikamentu.

10. Savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai izmantošana medikamenta iegūšanai, ar ko pacientam ārstē traucējumu vai slimību, ko pastarpina CETP vai, kas ir jutīga pret CETP inhibēšanu.

11. Izmantošana saskaņā ar 10. pretenziju, kur traucējumu vai slimību izvēlas no hiperlipidēmijas, arteriosklerozes, aterosklerozes, perifērās vaskulārās slimības, dislipidēmijas, hiperbetalipoproteinēmijas, hipoalfalipoproteinēmijas, hiperholesterolēmijas, hipertrigliceridēmijas, pārmantotas hiperholesterolēmijas, kardiovaskulārā traucējuma, koronārās sirds slimības, koronārās artēriju slimības, koronārās vaskulārās slimības, stenokardijas, išēmijas, sirds išēmijas, trombozes, sirds infarkta, tāda kā miokarda infarkts, sirds trieka, perifērās vaskulārās slimības, reperfūzijas bojājuma, angioplastikas restenozes, hipertensijas, sirds nepietiekamības, diabēta, tāda kā II tipa cukura diabēts, diabētiskām vaskulārām komplikācijām, aptaukošanās vai endotoksēmijas.

- | | | | |
|------|---|------|----------------|
| (51) | A61K 9/16 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | (11) | 2073795 |
| | A61K 9/20 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| | A61K 31/485 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| (21) | 07838274.4 | (22) | 14.09.2007 |
| (43) | 01.07.2009 | | |
| (45) | 18.12.2013 | | |
| (31) | 845151 P | (32) | 15.09.2006 |
| | 845128 P | | 15.09.2006 |
| | 845126 P | | 15.09.2006 |
| | 845127 P | | 15.09.2006 |
| | 850456 P | | 10.10.2006 |
| | 900851 | | 13.09.2007 |
| (86) | PCT/US2007/020041 | | 14.09.2007 |
| (87) | WO2008/033523 | | 20.03.2008 |
| (73) | Cima Labs, Inc., 7325 Aspen Lane, Brooklyn Park, MN 55428, US | | |
| (72) | HABIB, Walid, US | | |
| | HAMED, Ehab, US | | |
| | HILLMAN, Lisa, US | | |
| | KRALING, Carrie, US | | |
| | MOE, Derek, US | | |
| (74) | Hallybone, Huw George, et al, Carpmals & Ransford LLP, One Southampton Row, London WC1B 5HA, GB | | |
| | Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV | | |
| (54) | PRET NEPAREIZU LIETOŠANU AIZSARGĀTA ZĀĻU FORMA | | |
| | ABUSE RESISTANT DRUG FORMULATION | | |
| (57) | 1. Apvalkots granulāts, kas satur: | | |
| | granulātu, kas satur vismaz vienu opioīdu daudzumā starp apmēram 0,1 un apmēram 90 masas % no granulāta masas, kas samaisīts ar vismaz divām vielām, turklāt minētās vismaz divas vielas satur pirmo vielu, kas ir faktiski nešķīstoša ūdenī un vismaz daļēji šķīstoša spirtā, un ir daudzumā starp apmēram 1 un apmēram 90 masas % no granulāta masas, un otru vielu, kas ir faktiski nešķīstoša spirtā un vismaz daļēji šķīstoša ūdenī, un ir daudzumā starp apmēram 1 un apmēram 90 masas % no granulāta masas, turklāt farmaceitiski aktīvā viela un minētās divas vielas ir granulētas, turklāt pirmā viela ir etilceluloze un otrā viela ir izvēlēta no grupas, kas | | |

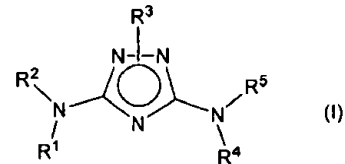
sastāv no hidroksipropilmetilcelulozes, metilcelulozes, hidroksietilmetilcelulozes, nātrija karboksimetilcelulozes, hidroksietilcelulozes un polietilēnoksidā, un pārklājumu uz minētā granulāta, nodrošinātu daudzumā starp apmēram 20 un apmēram 75 masas % no apvalkotā granulāta masas, kas ir izturīgs pret sadrupšanu, tuklāt pārklājums satur etilcelulozi.

2. Apvalkotais granulāts saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt otrā viela ir hidroksipropilmetilceluloze.

3. Apvalkotais granulāts saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt vismaz viens opioīds ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no oksikodona, kodeīna, hidrokodona, morfīna, hidromorfona, oksimorfona, metadona, propoksifēna, meperidīna, fentanila, buprenorfīna, butorfanola, dezocīna, levometadilacetāta, levorfanola, nalbufīna, pentazocīna, remifentanila, sufentanila un tramadola.

4. Farmaceitiska kompozīcija, kas satur granulātu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai un taukus/vasku, kas ir daudzumā starp apmēram 1 un apmēram 50 masas % no farmaceitiskās kompozīcijas masas, turklāt tauki/vaski ir izvēlēti(-s) no grupas, kas sastāv no glicerilbehenāta, glicerilpalmitostearāta, stearoilmakroglicerīdiem, karnaubas vaska, bišu vaska, mikrokristāliskā vaska un cetilspirta.

5. Farmaceitiskā kompozīcija saskaņā ar 4. pretenziju, turklāt tauki/vaski ir glicerilbehenāts.



kurā:

R¹, R⁴ un R⁵ katrs neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, arilgrupas, aralkilgrupas, -C(O)R⁸, -C(O)N(R⁶)R⁷ un -C(=NR⁶)N(R⁶)R⁷;

R² un R³ katrs neatkarīgi ir policikliska heteroarilgrupa, kas satur vairāk nekā 14 gredzena atomu, kas neobligāti aizvietoti ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no oksogrupas, tioksogrupas, ciāngrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, -R⁹-OR⁸, -R⁹-O-R¹⁰-OR⁸, -R⁹-O-R¹⁰-O-R¹⁰-OR⁸, -R⁹-O-R¹⁰-CN, -R⁹-O-R¹⁰-C(O)OR⁸, -R⁹-O-R¹⁰-C(O)N(R⁶)R⁷, -R⁹-O-R¹⁰-S(O)_pR⁸ (kur p ir 0, 1 vai 2), -R⁹-O-R¹⁰-N(R⁶)R⁷, -R⁹-O-R¹⁰-C(NR¹¹)N(R¹¹)H, -R⁹-OC(O)-R⁸, -R⁹-N(R⁶)R⁷, -R⁹-C(O)R⁸, -R⁹-C(O)OR⁸, -R⁹-C(O)N(R⁶)R⁷, -R⁹-N(R⁶)C(O)OR⁸, -R⁹-N(R⁶)C(O)R⁸, -R⁹-N(R⁶)S(O)_pR⁸ (kur t ir 1 vai 2), -R⁹-S(O)_pOR⁸ (kur t ir 1 vai 2), -R⁹-S(O)_pR⁸ (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R⁹-S(O)_pN(R⁶)R⁷ (kur t ir 1 vai 2); vai

R² ir policikliska heteroarilgrupa, kas satur vairāk nekā 14 gredzena atomu, kā minēts iepriekš, un R³ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no arilgrupas un heteroarilgrupas, kur arilgrupa un heteroarilgrupa katra neatkarīgi 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 aralkenilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkinilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkinilgrupas, -R¹³-OR¹², -R¹³-OC(O)-R¹², -R¹³-O-R¹⁴-N(R¹²)₂, -R¹³-N(R¹²)-R¹⁴-N(R¹²)₂, -R¹³-N(R¹²)-R¹⁴-N(R¹²)₂, -R¹³-N(R¹²)-R¹⁴-N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)OR¹², -R¹³-C(O)N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-N(R¹²)R¹³, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)R¹², -R¹³-N(R¹²)S(O)_pR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pOR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pR¹² (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R¹³-S(O)_pN(R¹²)₂ (kur t ir 1 vai 2);

vai R³ ir policikliska heteroarilgrupa, kas satur vairāk nekā 14 gredzena atomu, kā minēts iepriekš, un R² ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no arilgrupas un heteroarilgrupas, kur arilgrupa un heteroarilgrupa katra neatkarīgi 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, cianogrupas, nitrogrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkenilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkinilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkinilgrupas, -R¹³-OR¹², -R¹³-OC(O)-R¹², -R¹³-O-R¹⁴-N(R¹²)₂, -R¹³-N(R¹²)-R¹⁴-N(R¹²)₂, -R¹³-N(R¹²)-R¹⁴-N(R¹²)₂, -R¹³-N(R¹²)-R¹⁴-N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)OR¹², -R¹³-C(O)N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-N(R¹²)R¹³, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)R¹², -R¹³-N(R¹²)S(O)_pR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pOR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pR¹² (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R¹³-S(O)_pN(R¹²)₂ (kur t ir 1 vai 2);

- (51) **C07D 403/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2078010**
- C07D 403/14**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 471/18**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 491/14**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- A61K 31/4196**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- A61P 19/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- A61P 35/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 401/14**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 405/14**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 417/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 417/14**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 451/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 471/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 487/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 487/10**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 491/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 491/20**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 495/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 519/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 07870107.5 (22) 29.12.2007
- (43) 15.07.2009
- (45) 29.01.2014
- (31) 882850 P (32) 29.12.2006 (33) US
- 895400 P 16.03.2007 US
- 970931 P 07.09.2007 US
- (86) PCT/US2007/089177 29.12.2007
- (87) WO2008/083367 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
- YU, Jiaxin, US
- HECKRODT, Thilo, US
- DING, Pingyu, US
- LITVAK, Joane, US
- (74) Swan, Elizabeth Mary, Withers & Rogers LLP, 4 More London Riverside, London SE1 2AU, GB
- Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga, LV-1050, LV
- (54) **POLICIKLISKI HETEROARILAIZVIETOTI TRIAZOLI, KAS IR IZMANTOJAMI KĀ AXL INHIBITORI**
- POLYCYCLIC HETEROARYL SUBSTITUTED TRIAZOLES USEFUL AS AXL INHIBITORS**
- (57) 1. Savienojums ar formulu (I):

katrs R^6 un R^7 neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, halogēnalkilgrupas, halogēnalkenilgrupas, halogēnalkinilgrupas, hidroksi-alkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkinilgrupas, $-R^{10}-OR^8$, $-R^{10}-CN$, $-R^{10}-NO_2$, $-R^{10}-N(R^9)_2$, $-R^{10}-C(O)OR^8$ un $-R^{10}-C(O)N(R^9)_2$, 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, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, halogēnalkilgrupas, halogēnalkenilgrupas, halogēnalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkinilgrupas;

katrs R^9 neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites, neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes, neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkenilēnķēdes un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkinilēnķēdes;

katrs R^{10} neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes, neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkenilēnķēdes un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkinilēnķēdes;

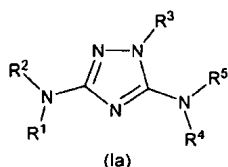
katrs R^{11} neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, cianogrupas, nitrogrupas un $-OR^9$;

katrs R^{12} neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, halogēnalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, vai divi R^{12} kopā ar kopējo slāpekļa atomu, kuram tie abi ir pievienoti, veido neobligāti aizvietotu N-heterociklilgrupu vai neobligāti aizvietotu N-heteroarilgrupu;

katrs R^{13} neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites, neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkenilēnķēdes; un katrs R^{14} neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkenilēnķēdes,

kā izolēts stereoizomērs vai tā maisījums vai kā tautomērs vai tā maisījums, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, vai N-oksīds.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu (Ia):



kurā:

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 un R^5 ir, kā definēts savienojumiem ar formulu (I).

3. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, kurā:

R^2 un R^3 katrs neatkarīgi ir policikliska heteroarilgrupa, kas satur vairāk nekā 14 gredzena atomu, kas neobligāti ir aizvietoti ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no oksogrupas, tioksogrupas, cianogrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti

aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, $-R^9-OR^8$, $-R^9-O-R^{10}-OR^8$, $-R^9-O-R^{10}-O-R^{10}-OR^8$, $-R^9-O-R^{10}-CN$, $-R^9-O-R^{10}-C(O)OR^8$, $-R^9-O-R^{10}-C(O)N(R^6)R^7$, $-R^9-O-R^{10}-S(O)_pR^8$ (kur p ir 0, 1 vai 2), $-R^9-O-R^{10}-N(R^6)R^7$, $-R^9-O-R^{10}-C(NR^{11})N(R^{11})H$, $-R^9-OC(O)-R^8$, $-R^9-N(R^6)R^7$, $-R^9-C(O)R^8$, $-R^9-C(O)OR^8$, $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$, $-R^9-N(R^6)C(O)OR^{12}$, $-R^9-N(R^6)C(O)R^8$, $-R^9-N(R^6)S(O)_pR^8$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^9-S(O)_pOR^8$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^9-S(O)_pR^8$ (kur p ir 0, 1 vai 2) un $-R^9-S(O)_pN(R^6)R^7$ (kur t ir 1 vai 2).

4. Savienojums saskaņā ar 3. pretenziju, kurā:

R^1 , R^4 un R^5 katrs ir ūdeņraža atoms;

R^2 un R^3 katrs neatkarīgi ir policikliska heteroarilgrupa, kas satur vairāk nekā 14 gredzena atomu, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-c]piridazin-3-ilgrupas, 6,7,8,9-tetrahidro-5H-ciklohepta[4,5]tieno[2,3-d]pirimidin-4-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-d]pirimidin-4-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]azepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, (Z)-dibenzo[b,f][1,4]tiazepin-11-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[4,5-c]piridazin-2-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]oksepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, spiro[hromeno[4,3-c]piridazin-5,1'-ciklopentan]-3-ilgrupas, 6,8,9,10-tetrahidro-5H-spiro[ciklookta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 5,6,8,9-tetrahidrospiro[benzo[7]anulēn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 5,7,8,9-tetrahidrospiro[ciklohepta[b]piridīn-6,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]tiepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-d]pirimidin-2-ilgrupas, 5,6,8,9-tetrahidrospiro[ciklohepta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 6,8,9,10-tetrahidro-5H-spiro[ciklookta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas un 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-b]piridīn-2-ilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no oksogrupas, tioksogrupas, cianogrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, $-R^9-OR^8$, $-R^9-OC(O)-R^8$, $-R^9-N(R^6)R^7$, $-R^9-C(O)R^8$, $-R^9-C(O)OR^8$, $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$, $-R^9-N(R^6)C(O)OR^{12}$, $-R^9-N(R^6)C(O)R^8$, $-R^9-N(R^6)S(O)_pR^8$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^9-S(O)_pOR^8$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^9-S(O)_pR^8$ (kur p ir 0, 1 vai 2) un $-R^9-S(O)_pN(R^6)R^7$ (kur t ir 1 vai 2);

katrs R^6 un R^7 neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, halogēnalkilgrupas, hidroksi-alkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, $-R^{10}-OR^8$, $-R^{10}-CN$, $-R^{10}-NO_2$, $-R^{10}-N(R^9)_2$, $-R^{10}-C(O)OR^8$ un $-R^{10}-C(O)N(R^9)_2$, 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^9 neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, halogēnalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas un neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas;

katrs R^9 neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes; un katrs R^{10} ir neobligāti aizvietota taisna vai sazarota alkilēnķēde.

5. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, kurā:

R^2 ir policikliska heteroarilgrupa, kas satur vairāk nekā 14 gredzena atomus, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no oksogrupas, tioksogrupas, cianogrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, $-R^9-OR^8$, $-R^9-O-R^{10}-OR^8$, $-R^9-O-R^{10}-O-R^{10}-OR^8$, $-R^9-O-R^{10}-CN$, $-R^9-O-R^{10}-C(O)OR^8$, $-R^9-O-R^{10}-C(O)N(R^6)R^7$, $-R^9-O-R^{10}-S(O)_pR^8$ (kur p ir 0, 1 vai 2), $-R^9-O-R^{10}-N(R^6)R^7$, $-R^9-O-R^{10}-C(NR^{11})N(R^{11})H$, $-R^9-OC(O)-R^8$, $-R^9-N(R^6)R^7$, $-R^9-C(O)R^8$, $-R^9-C(O)OR^8$, $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$, $-R^9-$

R^1 , R^4 un R^5 katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms;
 R^2 ir arilgrupa, kas 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, cianogrupas, nitrogrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkinilgrupas, $-R^{13}\text{-OR}^{12}$, $-R^{13}\text{-OC(O)-R}^{12}$, $-R^{13}\text{-O-R}^{14}\text{-N(R}^{12})_2$, $-R^{13}\text{-N(R}^{12})\text{-R}^{14}\text{-N(R}^{12})_2$, $-R^{13}\text{-N(R}^{12})_2$, $-R^{13}\text{-C(O)R}^{12}$, $-R^{13}\text{-C(O)OR}^{12}$, $-R^{13}\text{-C(O)N(R}^{12})_2$, $-R^{13}\text{-C(O)N(R}^{12})\text{-R}^{14}\text{-N(R}^{12})\text{R}^{13}$, $-R^{13}\text{-C(O)N(R}^{12})\text{-R}^{14}\text{-OR}^{12}$, $-R^{13}\text{-N(R}^{12})\text{C(O)OR}^{12}$, $-R^{13}\text{-N(R}^{12})\text{C(O)R}^{12}$, $-R^{13}\text{-N(R}^{12})\text{S(O)R}^{12}$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^{13}\text{-S(O)OR}^{12}$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^{13}\text{-S(O)}_p\text{R}^{12}$ (kur p ir 0, 1 vai 2) un $-R^{13}\text{-S(O)}_i\text{N(R}^{12})_2$ (kur t ir 1 vai 2);
katrs R^6 un R^7 neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, halogēnalkilgrupas, hidroksilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, $-R^{10}\text{-OR}^8$, $-R^{10}\text{-CN}$, $-R^{10}\text{-NO}_2$, $-R^{10}\text{-N(R}^8)_2$, $-R^{10}\text{-C(O)OR}^8$ un $-R^{10}\text{-C(O)N(R}^8)_2$, 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, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, 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^9 neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes; katrs R^{10} ir neobligāti aizvietota taisna vai sazarota alkilēnķēde; katrs R^{13} neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes; un katrs R^{14} ir neobligāti aizvietota taisna vai sazarota alkilēnķēde.
10. Savienojums saskaņā ar 9. pretenziju, kur:
 R^2 ir arilgrupa, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no fenilgrupas un 6,7,8,9-tetrahidro-5H-benzo[7]anulen-2-ilgrupas, 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, cianogrupas, nitrogrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, $-R^{13}\text{-OR}^{12}$, $-R^{13}\text{-OC(O)-R}^{12}$, $-R^{13}\text{-O-R}^{14}\text{-N(R}^{12})_2$, $-R^{13}\text{-N(R}^{12})\text{-R}^{14}\text{-N(R}^{12})_2$, $-R^{13}\text{-N(R}^{12})_2$, $-R^{13}\text{-C(O)R}^{12}$, $-R^{13}\text{-C(O)OR}^{12}$, $-R^{13}\text{-C(O)N(R}^{12})_2$, $-R^{13}\text{-C(O)N(R}^{12})\text{-R}^{14}\text{-N(R}^{12})\text{R}^{13}$, $-R^{13}\text{-C(O)N(R}^{12})\text{-R}^{14}\text{-OR}^{12}$, $-R^{13}\text{-N(R}^{12})\text{C(O)OR}^{12}$, $-R^{13}\text{-N(R}^{12})\text{C(O)R}^{12}$, $-R^{13}\text{-N(R}^{12})\text{S(O)R}^{12}$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^{13}\text{-S(O)OR}^{12}$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^{13}\text{-S(O)}_p\text{R}^{12}$ (kur p ir 0, 1 vai 2) un $-R^{13}\text{-S(O)}_i\text{N(R}^{12})_2$ (kur t ir 1 vai 2);
 R^3 ir policikliska heteroarilgrupa, kas satur vairāk nekā 14 gredzena atomu, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-c]piridazin-3-ilgrupas, 6,7,8,9-tetrahidro-5H-ciklohepta[4,5]tieno[2,3-d]pirimidin-4-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-d]pirimidin-4-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]azepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas,

(Z)-dibenzo[b,f][1,4]tiazepin-11-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[4,5-c]piridazin-2-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]oksepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, spiro[hromeno[4,3-c]piridazin-5,1'-ciklopentan]-3-ilgrupas, 6,8,9,10-tetrahidro-5H-spiro[ciklohepta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 5,6,8,9-tetrahidrospiro[benzo[7]anulēn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 5,7,8,9-tetrahidrospiro[ciklohepta[b]piridīn-6,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]tiepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-d]pirimidin-2-ilgrupas, 5,6,8,9-tetrahidrospiro[ciklohepta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 6,8,9,10-tetrahidro-5H-spiro[ciklohepta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas un 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-b]piridīn-2-ilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no oksogrupas, tioksogrupas, cianogrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkinilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, $-R^9\text{-OR}^8$, $-R^9\text{-OC(O)-R}^8$, $-R^9\text{-N(R}^6)\text{R}^7$, $-R^9\text{-C(O)R}^8$, $-R^9\text{-C(O)OR}^8$, $-R^9\text{-C(O)N(R}^6)\text{R}^7$, $-R^9\text{-N(R}^6)\text{C(O)OR}^{12}$, $-R^9\text{-N(R}^6)\text{C(O)R}^8$, $-R^9\text{-N(R}^6)\text{S(O)R}^8$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^9\text{-S(O)OR}^8$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^9\text{-S(O)}_p\text{R}^8$ (kur p ir 0, 1 vai 2) un $-R^9\text{-S(O)}_i\text{N(R}^6)\text{R}^7$ (kur t ir 1 vai 2);

11. Savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, kurā:

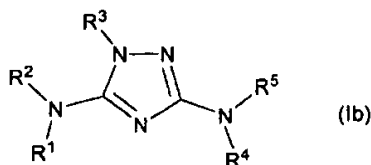
R^1 , R^4 un R^5 katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms;
 R^2 ir heteroarilgrupa, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, halogēnalkenilgrupas, halogēnalkinilgrupas, oksogrupas, tioksogrupas, cianogrupas, nitrogrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkinilgrupas, $-R^{13}\text{-OR}^{12}$, $-R^{13}\text{-OC(O)-R}^{12}$, $-R^{13}\text{-O-R}^{14}\text{-N(R}^{12})_2$, $-R^{13}\text{-N(R}^{12})\text{-R}^{14}\text{-N(R}^{12})_2$, $-R^{13}\text{-N(R}^{12})_2$, $-R^{13}\text{-C(O)R}^{12}$, $-R^{13}\text{-C(O)OR}^{12}$, $-R^{13}\text{-C(O)N(R}^{12})_2$, $-R^{13}\text{-C(O)N(R}^{12})\text{-R}^{14}\text{-N(R}^{12})\text{R}^{13}$, $-R^{13}\text{-C(O)N(R}^{12})\text{-R}^{14}\text{-OR}^{12}$, $-R^{13}\text{-N(R}^{12})\text{C(O)OR}^{12}$, $-R^{13}\text{-N(R}^{12})\text{C(O)R}^{12}$, $-R^{13}\text{-N(R}^{12})\text{S(O)R}^{12}$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^{13}\text{-S(O)OR}^{12}$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^{13}\text{-S(O)}_p\text{R}^{12}$ (kur p ir 0, 1 vai 2) un $-R^{13}\text{-S(O)}_i\text{N(R}^{12})_2$ (kur t ir 1 vai 2);
katrs R^6 un R^7 neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, 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, neobligāti aizvietotas heteroarilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkinilgrupas, $-R^{10}\text{-OR}^8$, $-R^{10}\text{-CN}$, $-R^{10}\text{-NO}_2$, $-R^{10}\text{-N(R}^8)_2$, $-R^{10}\text{-C(O)OR}^8$ un $-R^{10}\text{-C(O)N(R}^8)_2$, 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, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, 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^9 neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes; katrs R^{10} ir neobligāti aizvietota taisna vai sazarota alkilēnķēde; katrs R^{13} neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes; un katrs R^{14} ir neobligāti aizvietota taisna vai sazarota alkilēnķēde.

12. Savienojums saskaņā ar 11. pretenziju, kurā:

R^2 ir heteroarilgrupa, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no piridinilgrupas, pirimidinilgrupas, 4,5-dihidro-1H-benzo[b]azepin-2(3H)-on-8-ilgrupas, benzo[d]imidazolilgrupas, 6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirido[3,2-d]azepin-3-ilgrupas, 6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirido[3,2-

c)azepin-3-ilgrupas, 5,6,7,8-tetrahidro-1,6-naftiridin-3-ilgrupas, 5,6,7,8-tetrahidrohlinol-3-ilgrupas, 1,2,3,4-tetrahidroizohinolin-7-ilgrupas, 2,3,4,5-tetrahidrobenzo[b]oksepin-7-ilgrupas, 3,4-dihidro-2H-benzo[b][1,4]dioksepin-7-ilgrupas, benzo[d]oksazol-5-ilgrupas, 3,4-dihidro-2H-benzo[b][1,4]oksazin-7-ilgrupas, benzo[b]tiofenilgrupas un 6,7,8,9-tetrahidro-5H-ciklohepta[b]piridin-3-ilgrupas, 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, cianogrupas, nitrogrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkenilgrupas, $-R^{13}OR^{12}$, $-R^{13}OC(O)R^{12}$, $-R^{13}O-R^{14}N(R^{12})_2$, $-R^{13}N(R^{12})_2$, $-R^{13}C(O)R^{12}$, $-R^{13}C(O)OR^{12}$, $-R^{13}C(O)N(R^{12})_2$, $-R^{13}C(O)N(R^{12})-R^{14}N(R^{12})R^{13}$, $-R^{13}C(O)N(R^{12})-R^{14}OR^{12}$, $-R^{13}N(R^{12})C(O)OR^{12}$, $-R^{13}N(R^{12})C(O)R^{12}$, $-R^{13}N(R^{12})S(O)_pR^{12}$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^{13}S(O)_pR^{12}$ (kur t ir 1 vai 2) un $-R^{13}S(O)_pN(R^{12})_2$ (kur t ir 1 vai 2); un R^3 ir policikliska heteroarilgrupa, kas satur vairāk nekā 14 gredzena atomu, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-c]piridazin-3-ilgrupas, 6,7,8,9-tetrahidro-5H-ciklohepta[4,5]tieno[2,3-d]pirimidin-4-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-d]pirimidin-4-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]azepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, (Z)-dibenzo[b,f][1,4]tiazepin-11-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[4,5-c]piridazin-2-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]oksepin[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, spiro[hromeno[4,3-c]piridazīn-5,1'-ciklopentan]-3-ilgrupas, 6,8,9,10-tetrahidro-5H-spiro[ciklookta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 5,6,8,9-tetrahidrospiro[benzo[7]anulēn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 5,7,8,9-tetrahidrospiro[ciklohepta[b]piridīn-6,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]tiepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-d]pirimidin-2-ilgrupas, 5,6,8,9-tetrahidrospiro[ciklohepta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 6,8,9,10-tetrahidro-5H-spiro[ciklookta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas un 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-b]piridin-2-ilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no oksogrupas, tioksogrupas, cianogrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, $-R^{10}OR^9$, $-R^{10}OC(O)R^9$, $-R^9N(R^6)R^7$, $-R^9C(O)R^8$, $-R^9C(O)OR^8$, $-R^9C(O)N(R^6)R^7$, $-R^9N(R^6)C(O)OR^{12}$, $-R^9N(R^6)C(O)R^8$, $-R^9N(R^6)S(O)_pR^8$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^9S(O)_pR^8$ (kur t ir 1 vai 2) un $-R^9S(O)_pN(R^6)R^7$ (kur t ir 1 vai 2).

13. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu (Ib):



kurā:

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 un R^5 ir, kā definēts savienojumiem ar formulu (I).

14. Savienojums saskaņā ar 13. pretenziju, kurā:

R^2 un R^3 katrs neatkarīgi ir policikliska heteroarilgrupa, kas satur vairāk nekā 14 gredzena atomu, kas neobligāti ir aizvietoti ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no oksogrupas, tioksogrupas, cianogrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, $-R^9OR^8$, $-R^9O-R^{10}OR^8$, $-R^9O-R^{10}O-R^{10}OR^8$, $-R^9O-R^{10}CN$, $-R^9O-R^{10}C(O)OR^8$, $-R^9O-R^{10}C(O)N(R^6)R^7$, $-R^9O-R^{10}S(O)_pR^8$ (kur

p ir 0, 1 vai 2), $-R^9O-R^{10}N(R^6)R^7$, $-R^9O-R^{10}C(NR^{11})N(R^{11})H$, $-R^9OC(O)R^8$, $-R^9N(R^6)R^7$, $-R^9C(O)R^8$, $-R^9C(O)OR^8$, $-R^9C(O)N(R^6)R^7$, $-R^9N(R^6)C(O)OR^{12}$, $-R^9N(R^6)C(O)R^8$, $-R^9N(R^6)S(O)_pR^8$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^9S(O)_pR^8$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^9S(O)_pR^8$ (kur p ir 0, 1 vai 2) un $-R^9S(O)_pN(R^6)R^7$ (kur t ir 1 vai 2).

15. Savienojums saskaņā ar 14. pretenziju, kurā:

R^1 , R^4 un R^5 katrs ir ūdeņraža atoms;

R^2 un R^3 katrs neatkarīgi ir policikliska heteroarilgrupa, kas satur vairāk nekā 14 gredzena atomu, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-c]piridazin-3-ilgrupas, 6,7,8,9-tetrahidro-5H-ciklohepta[4,5]tieno[2,3-d]pirimidin-4-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-d]pirimidin-4-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]azepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, (Z)-dibenzo[b,f][1,4]tiazepin-11-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[4,5-c]piridazin-2-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]oksepin[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, spiro[hromeno[4,3-c]piridazīn-5,1'-ciklopentan]-3-ilgrupas, 6,8,9,10-tetrahidro-5H-spiro[ciklookta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 5,6,8,9-tetrahidrospiro[benzo[7]anulēn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 5,7,8,9-tetrahidrospiro[ciklohepta[b]piridīn-6,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]tiepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-d]pirimidin-2-ilgrupas, 5,6,8,9-tetrahidrospiro[ciklohepta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 6,8,9,10-tetrahidro-5H-spiro[ciklookta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas un 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-b]piridin-2-ilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no oksogrupas, tioksogrupas, cianogrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, $-R^9OR^8$, $-R^9OC(O)R^8$, $-R^9N(R^6)R^7$, $-R^9C(O)R^8$, $-R^9C(O)OR^8$, $-R^9C(O)N(R^6)R^7$, $-R^9N(R^6)C(O)OR^{12}$, $-R^9N(R^6)C(O)R^8$, $-R^9N(R^6)S(O)_pR^8$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^9S(O)_pR^8$ (kur t ir 1 vai 2) un $-R^9S(O)_pN(R^6)R^7$ (kur t ir 1 vai 2);

katrs R^6 un R^7 neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, halogēnalkilgrupas, hidroksialkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, $-R^{10}OR^9$, $-R^{10}CN$, $-R^{10}NO_2$, $-R^{10}N(R^6)_2$, $-R^{10}C(O)OR^8$ un $-R^{10}C(O)N(R^6)_2$, 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, alkilgrupas, halogēnalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes;

katrs R^9 neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes;

16. Savienojums saskaņā ar 13. pretenziju, kurā:

R^2 ir policikliska heteroarilgrupa, kas satur vairāk nekā 14 gredzena atomu, kas neobligāti ir aizvietoti ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no oksogrupas, tioksogrupas, cianogrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, $-R^9OR^8$, $-R^9O-R^{10}OR^8$, $-R^9O-R^{10}O-R^{10}OR^8$, $-R^9O-R^{10}CN$, $-R^9O-R^{10}C(O)OR^8$, $-R^9O-R^{10}C(O)N(R^6)R^7$, $-R^9O-R^{10}S(O)_pR^8$ (kur p ir 0, 1 vai 2), $-R^9O-R^{10}N(R^6)R^7$, $-R^9O-R^{10}C(NR^{11})N(R^{11})H$, $-R^9OC(O)R^8$, $-R^9N(R^6)R^7$, $-R^9C(O)R^8$, $-R^9C(O)OR^8$, $-R^9C(O)N(R^6)R^7$, $-R^9N(R^6)C(O)OR^{12}$, $-R^9N(R^6)C(O)R^8$, $-R^9N(R^6)S(O)_pR^8$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^9S(O)_pR^8$ (kur t ir 1 vai 2), $-R^9S(O)_pR^8$ (kur p ir 0, 1 vai 2) un $-R^9S(O)_pN(R^6)R^7$ (kur t ir 1 vai 2); un

R³ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no arilgrupas un heteroarilgrupas, kur arilgrupa un heteroarilgrupa katra neatkarīgi 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, cianogrupas, nitrogrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkenilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkinilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkinilgrupas, -R¹³-OR¹², -R¹³-OC(O)-R¹², -R¹³-O-R¹⁴-N(R¹²)₂, -R¹³-N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)R¹², -R¹³-C(O)OR¹², -R¹³-C(O)N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-N(R¹²)R¹³, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)R¹², -R¹³-N(R¹²)S(O)_pR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pOR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pR¹² (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R¹³-S(O)_pN(R¹²)₂ (kur t ir 1 vai 2).

17. Savienojums saskaņā ar 16. pretenziju, kurā:

R¹, R⁴ un R⁵ katrs ir ūdeņraža atoms;

R² ir policikliska heteroarilgrupa, kas satur vairāk nekā 14 gredzēna atomu, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-c]piridazin-3-ilgrupas, 6,7,8,9-tetrahidro-5H-ciklohepta[4,5]tieno[2,3-d]pirimidin-4-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-d]pirimidin-4-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]azepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, (Z)-dibenzo[b,f][1,4]tiazeplin-11-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[4,5-c]piridazin-2-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]joksepinio[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, spiro[hromeno[4,3-c]piridazīn-5,1'-ciklopentan]-3-ilgrupas, 6,8,9,10-tetrahidro-5H-spiro[ciklookta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 5,6,8,9-tetrahidrospiro[benzo[7]anulēn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 5,7,8,9-tetrahidrospiro[ciklohepta[b]piridīn-6,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]tiepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-d]pirimidin-2-ilgrupas, 5,6,8,9-tetrahidrospiro[ciklohepta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 6,8,9,10-tetrahidro-5H-spiro[ciklookta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas un 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-b]piridīn-2-ilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no oksogrupas, tioksogrupas, cianogrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, -R⁹-OR⁸, -R⁹-OC(O)-R⁸, -R⁹-N(R⁶)R⁷, -R⁹-C(O)R⁸, -R⁹-C(O)OR⁸, -R⁹-C(O)N(R⁶)R⁷, -R⁹-N(R⁶)C(O)OR⁸, -R⁹-N(R⁶)C(O)R⁸, -R⁹-N(R⁶)S(O)_pR⁸ (kur t ir 1 vai 2), -R⁹-S(O)_pOR⁸ (kur t ir 1 vai 2), -R⁹-S(O)_pR⁸ (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R⁹-S(O)_pN(R⁶)R⁷ (kur t ir 1 vai 2);

katrs R⁶ un R⁷ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, 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, -R¹⁰-OR⁸, -R¹⁰-CN, -R¹⁰-NO₂, -R¹⁰-N(R⁸)₂, -R¹⁰-C(O)OR⁸ un -R¹⁰-C(O)N(R⁸)₂, vai jebkurš R⁶ un R⁷ kopā ar kopējo slāpekļa atomu, kuram tie abi ir pievienoti, veido neobligāti aizvietotu N-heteroarilgrupu vai neobligāti aizvietotu N-heterociklilgrupu;

katrs R⁸ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, 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 R⁹ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes;

katrs R¹⁰ ir neobligāti aizvietota taisna vai sazarota alkilēnķēde; katrs R¹³ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes; un katrs R¹⁴ ir neobligāti aizvietota taisna vai sazarota alkilēnķēde.

18. Savienojums saskaņā ar 13. pretenziju, kurā:

R² ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no arilgrupas un heteroarilgrupas, kur arilgrupa un heteroarilgrupa katra neatkarīgi 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, cianogrupas, nitrogrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkenilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkinilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkinilgrupas, -R¹³-OR¹², -R¹³-OC(O)-R¹², -R¹³-O-R¹⁴-N(R¹²)₂, -R¹³-N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)R¹², -R¹³-C(O)OR¹², -R¹³-C(O)N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-N(R¹²)R¹³, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)R¹², -R¹³-N(R¹²)S(O)_pR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pOR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pR¹² (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R¹³-S(O)_pN(R¹²)₂ (kur t ir 1 vai 2); un

R³ ir policikliska heteroarilgrupa, kas satur vairāk nekā 14 gredzēna atomu, kas neobligāti ir aizvietoti ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no oksogrupas, tioksogrupas, cianogrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, -R⁹-OR⁸, -R⁹-O-R¹⁰-OR⁸, -R⁹-O-R¹⁰-O-R¹⁰-OR⁸, -R⁹-O-R¹⁰-CN, -R⁹-O-R¹⁰-C(O)OR⁸, -R⁹-O-R¹⁰-C(O)N(R⁶)R⁷, -R⁹-O-R¹⁰-S(O)_pR⁸ (kur p ir 0, 1 vai 2), -R⁹-O-R¹⁰-N(R⁶)R⁷, -R⁹-O-R¹⁰-C(NR¹¹)N(R¹¹)H, -R⁹-OC(O)-R⁸, -R⁹-N(R⁶)R⁷, -R⁹-C(O)R⁸, -R⁹-C(O)OR⁸, -R⁹-C(O)N(R⁶)R⁷, -R⁹-N(R⁶)C(O)OR⁸, -R⁹-N(R⁶)C(O)R⁸, -R⁹-N(R⁶)S(O)_pR⁸ (kur t ir 1 vai 2), -R⁹-S(O)_pOR⁸ (kur t ir 1 vai 2), -R⁹-S(O)_pR⁸ (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R⁹-S(O)_pN(R⁶)R⁷ (kur t ir 1 vai 2);

19. Savienojums saskaņā ar 18. pretenziju, kur:

R¹, R⁴ un R⁵ katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms;

R² ir arilgrupa, kas 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, cianogrupas, nitrogrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkenilgrupas, 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 heteroarilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkinilgrupas, -R¹³-OR¹², -R¹³-OC(O)-R¹², -R¹³-O-R¹⁴-N(R¹²)₂, -R¹³-N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)R¹², -R¹³-C(O)OR¹², -R¹³-C(O)N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-N(R¹²)R¹³, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)R¹², -R¹³-N(R¹²)S(O)_pR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pOR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pR¹² (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R¹³-S(O)_pN(R¹²)₂ (kur t ir 1 vai 2);

katrs R⁶ un R⁷ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, 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, -R¹⁰-OR⁸, -R¹⁰-CN, -R¹⁰-NO₂, -R¹⁰-N(R⁸)₂, -R¹⁰-C(O)OR⁸ un -R¹⁰-C(O)N(R⁸)₂, vai jebkurš R⁶ un R⁷ kopā ar kopējo slāpekļa atomu, kuram tie abi ir pievienoti, veido

neobligāti aizvietotu N-heteroarilgrupu vai neobligāti aizvietotu N-heterociklilgrupu;

katrs R⁸ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, 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 R⁹ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes;

katrs R¹⁰ ir neobligāti aizvietota taisna vai sazarota alkilēnķēde; katrs R¹³ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes; un katrs R¹⁴ ir neobligāti aizvietota taisna vai sazarota alkilēnķēde.

20. Savienojums saskaņā ar 19. pretenziju, kur: R² ir arilgrupa, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no fenilgrupas un 6,7,8,9-tetrahidro-5H-benzo[7]anulen-2-ilgrupas, 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, cianogrupas, nitrogupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkenilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkinilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, -R¹³-OR¹², -R¹³-OC(O)-R¹², -R¹³-O-R¹⁴-N(R¹²)₂, -R¹³-N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)R¹², -R¹³-C(O)OR¹², -R¹³-C(O)N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-N(R¹²)R¹³, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)R¹², -R¹³-N(R¹²)S(O)_pR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pOR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pR¹² (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R¹³-S(O)_pN(R¹²)₂ (kur t ir 1 vai 2); un

R³ ir policikliska heteroarilgrupa, kas satur vairāk nekā 14 gredzēna atomu, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-c]piridazin-3-ilgrupas, 6,7,8,9-tetrahidro-5H-ciklohepta[4,5]tieno[2,3-d]pirimidin-4-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-d]pirimidin-4-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]azepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, (Z)-dibenzo[b,f][1,4]tiazepin-11-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[4,5-c]piridazin-2-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]joksepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, spiro[hromeno[4,3-c]piridazin-5,1'-ciklopentan]-3-ilgrupas, 6,8,9,10-tetrahidro-5H-spiro[ciklookta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 5,6,8,9-tetrahidrospiro[benzo[7]anulēn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 5,7,8,9-tetrahidrospiro[ciklohepta[b]piridīn-6,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]tiepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-d]pirimidin-2-ilgrupas, 5,6,8,9-tetrahidrospiro[ciklohepta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 6,8,9,10-tetrahidro-5H-spiro[ciklookta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas un 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-b]piridin-2-ilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no oksogrupas, tioksogrupas, cianogrupas, nitrogupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkenilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, -R⁹-OR⁸, -R⁹-OC(O)-R⁸, -R⁹-N(R⁶)R⁷, -R⁹-C(O)R⁸, -R⁹-C(O)OR⁸, -R⁹-C(O)N(R⁶)R⁷, -R⁹-N(R⁶)C(O)OR¹², -R⁹-N(R⁶)C(O)R⁸, -R⁹-N(R⁶)S(O)_pR⁸ (kur t ir 1 vai 2), -R⁹-S(O)_pOR⁸ (kur t ir 1 vai 2), -R⁹-S(O)_pR⁸ (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R⁹-S(O)_pN(R⁶)R⁷ (kur t ir 1 vai 2).

21. Savienojums saskaņā ar 18. pretenziju, kur: R¹, R⁴ un R⁵ katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms; R² ir heteroarilgrupa, kas 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, cianogrupas, nitrogupas, 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 heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkinilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilalkilgrupas, -R¹³-OR¹², -R¹³-OC(O)-R¹², -R¹³-O-R¹⁴-N(R¹²)₂, -R¹³-N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)R¹², -R¹³-C(O)OR¹², -R¹³-C(O)N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-N(R¹²)R¹³, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)R¹², -R¹³-N(R¹²)S(O)_pR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pOR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pR¹² (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R¹³-S(O)_pN(R¹²)₂ (kur t ir 1 vai 2);

katrs R⁶ un R⁷ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, halogēnalkilgrupas, hidroksialkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, -R¹⁰-OR⁸, -R¹⁰-CN, -R¹⁰-NO₂, -R¹⁰-N(R⁸)₂, -R¹⁰-C(O)OR⁸ un -R¹⁰-C(O)N(R⁸)₂, vai jebkurš R⁶ un R⁷ kopā ar kopējo slāpekļa atomu, kuram tie abi ir pievienoti, veido neobligāti aizvietotu N-heteroarilgrupu vai neobligāti aizvietotu N-heterociklilgrupu; katrs R⁸ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, 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 R⁹ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes; katrs R¹⁰ ir neobligāti aizvietota taisna vai sazarota alkilēnķēde; katrs R¹³ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no tiešas saites un neobligāti aizvietotas taisnas vai sazarotas alkilēnķēdes; un katrs R¹⁴ ir neobligāti aizvietota taisna vai sazarota alkilēnķēde.

22. Savienojums saskaņā ar 21. pretenziju, kur: R² ir heteroarilgrupa, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no piridinilgrupas, pirimidinilgrupas, 4,5-dihidro-1H-benzo[b]azepin-2(3H)-on-8-ilgrupas, benzo[d]imidazolilgrupas, 6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirido[3,2-d]azepin-3-ilgrupas, 6,7,8,9-tetrahidro-5H-pirido[3,2-c]azepin-3-ilgrupas, 5,6,7,8-tetrahidro-1,6-naftiridin-3-ilgrupas, 5,6,7,8-tetrahidrohlinolīn-3-ilgrupas, 1,2,3,4-tetrahidroizohinolīn-7-ilgrupas, 2,3,4,5-tetrahidrobenzo[b]joksepīn-7-ilgrupas, 3,4-dihidro-2H-benzo[b][1,4]dioksepīn-7-ilgrupas, benzo[d]oksazol-5-ilgrupas, 3,4-dihidro-2H-benzo[b][1,4]oksazīn-7-ilgrupas, benzo[b]tiofenilgrupas un 6,7,8,9-tetrahidro-5H-ciklohepta[b]piridīn-3-ilgrupas, 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, cianogrupas, nitrogupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkenilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilalkilgrupas, -R¹³-OR¹², -R¹³-OC(O)-R¹², -R¹³-O-R¹⁴-N(R¹²)₂, -R¹³-N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)R¹², -R¹³-C(O)OR¹², -R¹³-C(O)N(R¹²)₂, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-N(R¹²)R¹³, -R¹³-C(O)N(R¹²)-R¹⁴-OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)OR¹², -R¹³-N(R¹²)C(O)R¹², -R¹³-N(R¹²)S(O)_pR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pOR¹² (kur t ir 1 vai 2), -R¹³-S(O)_pR¹² (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R¹³-S(O)_pN(R¹²)₂ (kur t ir 1 vai 2); un R³ ir policikliska heteroarilgrupa, kas satur vairāk nekā 14 gredzēna atomu, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-c]piridazin-3-ilgrupas, 6,7,8,9-tetrahidro-5H-ciklohepta[4,5]tieno[2,3-d]pirimidin-4-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-d]pirimidin-4-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]azepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas,

(Z)-dibenzo[b,f][1,4]tiazepin-11-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[4,5-c]piridazin-2-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]joksepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, spiro[hromeno[4,3-c]piridazin-5,1'-ciklopentan]-3-ilgrupas, 6,8,9,10-tetrahidro-5H-spiro[ciklohepta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 5,6,8,9-tetrahidrospiro[benzo[7]anulēn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 5,7,8,9-tetrahidrospiro[ciklohepta[b]piridīn-6,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[2,3]tiepino[4,5-c]piridazin-3-ilgrupas, 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-d]pirimidin-2-ilgrupas, 5,6,8,9-tetrahidrospiro[ciklohepta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas, 6,8,9,10-tetrahidro-5H-spiro[ciklohepta[b]piridīn-7,2'-[1,3]dioksolan]-3-ilgrupas un 6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-b]piridīn-2-ilgrupas, katra grupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no oksogrupas, tioksogrupas, cianogrupas, nitrogrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, alkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilgrupas, neobligāti aizvietotas cikloalkilalkilgrupas, neobligāti aizvietotas arilgrupas, neobligāti aizvietotas aralkilgrupas, neobligāti aizvietotas heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas heterociklilgrupas, -R⁹-OR⁸, -R⁹-OC(O)-R⁸, -R⁹-N(R⁶)R⁷, -R⁹-C(O)R⁸, -R⁹-C(O)OR⁸, -R⁹-C(O)N(R⁶)R⁷, -R⁹-N(R⁶)C(O)OR¹², -R⁹-N(R⁶)C(O)R⁸, -R⁹-N(R⁶)S(O)_pR⁸ (kur t ir 1 vai 2), -R⁹-S(O)_pOR⁸ (kur t ir 1 vai 2), -R⁹-S(O)_pR⁸ (kur p ir 0, 1 vai 2) un -R⁹-S(O)_pN(R⁶)R⁷ (kur t ir 1 vai 2).

23. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur farmaceutiski pieņemamu palīgvielu un savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 22. pretenzijai kā izolētu stereoizomēru vai tā maisījumu vai kā tautomēru vai tā maisījumu, vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli, vai N-oksīdu.

24. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 22. pretenzijai kā izolēts stereoizomērs vai tā maisījums vai kā tautomērs vai tā maisījums, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, vai N-oksīds izmantošanai slimības vai stāvokļa ārstēšanai, kas saistīts ar Axl aktivitāti zīdītājā.

25. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 1-(6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-c]piridazin-3-il)-N³-(7-(pirolidin-1-il)-6,7,8,9-tetrahidro-5H-benzo[7]anulēn-2-il)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīns kā brīva bāze, tā farmaceutiski pieņemams sāls vai tā N-oksīds.

26. Savienojums saskaņā ar 25. pretenziju, kas ir brīvā bāze.

27. Savienojums saskaņā ar 25. pretenziju, kas ir 1-(6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-c]piridazin-3-il)-N³-(7-(pirolidin-1-il)-6,7,8,9-tetrahidro-5H-benzo[7]anulēn-2-il)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīna farmaceutiski pieņemams sāls.

28. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 1-(6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-c]piridazin-3-il)-N³-(7-(S)-(pirolidin-1-il)-6,7,8,9-tetrahidro-5H-benzo[7]anulēn-2-il)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīns kā brīva bāze, tā farmaceutiski pieņemams sāls vai tā N-oksīds.

29. Savienojums saskaņā ar 28. pretenziju, kas ir brīvā bāze.

30. Savienojums saskaņā ar 29. pretenziju, kas ir 1-(6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-c]piridazin-3-il)-N³-(7-(S)-(pirolidin-1-il)-6,7,8,9-tetrahidro-5H-benzo[7]anulēn-2-il)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīna farmaceutiski pieņemams sāls.

31. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 1-(6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-c]piridazin-3-il)-N³-(3-fluor-4-(4-pirolidin-1-il)piperidin-1-il)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīns kā brīva bāze, tā farmaceutiski pieņemams sāls vai tā N-oksīds.

32. Savienojums saskaņā ar 31. pretenziju, kas ir brīvā bāze.

33. Savienojums saskaņā ar 32. pretenziju, kas ir 1-(6,7-dihidro-5H-benzo[6,7]ciklohepta[1,2-c]piridazin-3-il)-N³-(3-fluor-4-(4-pirolidin-1-il)piperidin-1-il)-1H-1,2,4-triazol-3,5-diamīna farmaceutiski pieņemams sāls.

34. Savienojums saskaņā ar 27. vai 30., vai 33. pretenziju, kur farmaceutiski pieņemams sāls ir farmaceutiski pieņemams pievienotas skābes sāls.

35. Savienojums saskaņā ar 34. pretenziju, kur skābe ir izvēlēta no skudrskābes, trifluoretiķskābes, sālsskābes, benzolsulfonskābes vai etiķskābes.

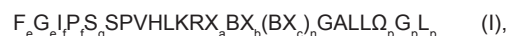
36. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 23. pretenziju, kas satur farmaceutiski pieņemamu palīgvielu un savienojumu saskaņā ar 25. pretenziju kā brīvo bāzi, tā farmaceutiski pieņemamu sāli vai tā N-oksīdu, vai satur farmaceutiski pieņemamu palīgvielu un savienojumu saskaņā ar 28. pretenziju kā brīvo bāzi, tā farmaceutiski pieņemamu sāli vai tā N-oksīdu, vai satur farmaceutiski pieņemamu

palīgvielu un savienojumu saskaņā ar 31. pretenziju kā brīvo bāzi, tā farmaceutiski pieņemamu sāli vai tā N-oksīdu.

37. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 24. pretenziju, kas satur savienojumu saskaņā ar 25. pretenziju kā brīvo bāzi, tā farmaceutiski pieņemamu sāli vai tā N-oksīdu, vai savienojumu saskaņā ar 28. pretenziju kā brīvo bāzi, tā farmaceutiski pieņemamu sāli vai tā N-oksīdu, vai savienojumu saskaņā ar 31. pretenziju kā brīvo bāzi, tā farmaceutiski pieņemamu sāli vai tā N-oksīdu.

- (51) **C07K 14/785⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2078038**
 (21) 07825212.9 (22) 28.09.2007
 (43) 15.07.2009
 (45) 20.11.2013
 (31) 06021521 (32) 13.10.2006 (33) EP
 (86) PCT/IB2007/002841 28.09.2007
 (87) WO2008/044109 17.04.2008
 (73) CHIESI FARMACEUTICI S.p.A., Via Palermo, 26/A, 43100 Parma, IT
 (72) JOHANSSON, Jan, IT
 CURSTEDT, Tore, IT
 ROBERTSON, Bengt, 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) **PĀRVEIDOTAS VIRSMAKTĪVĀS VIELAS AR UZLABOTĀM ĪPAŠĪBĀM**
RECONSTITUTED SURFACTANTS HAVING IMPROVED PROPERTIES

(57) 1. Pārveidota virsmaktīvā viela, kas satur fosfolipīdu maisījumu un dabiskā virsmaktīvā proteīna SP-C polipeptīda analoga kombināciju ar dabiskā virsmaktīvā proteīna SP-B polipeptīda analogu, kur iepriekš minētais dabiskā virsmaktīvā proteīna SP-C polipeptīda analogs ir polipeptīds ar vismaz 20 aminoskābju atlikumiem un ne vairāk kā 40 aminoskābju atlikumiem ir sekvenca ar šādu vispārējo formulu (I)



kur

X ir aminoskābes atlikums, kas neatkarīgi izvēlēts no grupas: I, L un nL;

B ir aminoskābes atlikums, kas neatkarīgi izvēlēts no grupas: K, W, F, Y un Orn;

S ir pēc izvēles aizvietots ar acilgrupām, kas satur 12-22 oglekļa atomus, ieteicams 16 oglekļa atomus, kas ar blakus ķēdi saistīti ar estersaiti;

Q ir aminoskābes atlikums, kas izvēlēts no grupas: M vai tas ir oksidēts pie sēra atoma, I, L un nL;

a ir skaitlis ar vērtību no 1 līdz 8;

b ir skaitlis ar vērtību no 1 līdz 19;

c ir skaitlis ar vērtību, kas neatkarīgi izvēlēta no 3 līdz 8;

e, f, g un p ir skaitļi ar vērtību 0 vai 1;

N ir skaitlis ar vērtību no 0 līdz 3;

ar nosacījumu, ka X_aBX_b(BX_c)_n ir sekvenca ar maksimums 22 aminoskābēm un pie kam iepriekš minētā dabiskā virsmaktīvā proteīna SP-B polipeptīda analogs ir polipeptīds ar vispārējo formulu (II):



kur:

Δ ir aminoskābes atlikums, kas izvēlēts no grupas: W un L;

Ω ir aminoskābes atlikums, kas neatkarīgi izvēlēts no grupas: M, I, L un nL;

Φ ir aminoskābes atlikums, kas izvēlēts no grupas: R un T; un

f ir skaitlis ar vērtību 0 vai 1.

2. Pārveidota virsmaktīvā viela saskaņā ar 1. pretenziju, kur Φ ir R.

3. Pārveidota virsmaktīvā viela saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā dabiskā virsmaktīvā proteīna SP-C analogs un dabiskā virsmaktīvā proteīna SP-B analogs ir klāt noteiktā kombinācijā.

4. Pārveidots virsmaktīvais sastāvs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kurā polipeptīds (II) ir disulfīda molekulas veidā ar starpmolekulāru disulfīda saiti starp diviem Cys atlikumiem

1. un 33. pozīcijā un/vai starp diviem Cys atlikumiem 4. un 27. pozīcijā.

5. Pārveidots virsmaktīvais sastāvs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur dabiskā virsmaktīvā proteīna SP-B analogs ir ar vispārējo formulu (IIa)



6. Pārveidots virsmaktīvais sastāvs saskaņā ar 5. pretenziju, kurā dabiskā virsmaktīvā proteīna SP-C analogs ir ar vispārējo formulu (Ia)



kur

X, B un Q ir saskaņā ar iepriekš minēto;

a ir no 1 līdz 8, ieteicams no 1 līdz 3, vēl ieteicamāk 1;

b ir no 1 līdz 19, ieteicams no 5 līdz 15, vēl ieteicamāk 14; un

f un p ir 0 vai 1.

7. Pārveidots virsmaktīvais sastāvs saskaņā ar 6. pretenziju, kurā dabiskā virsmaktīvā proteīna SP-C analogs ir ar vispārējo formulu (Ib)



kur

X, B un Q ir saskaņā ar iepriekš minēto; un

p ir 0 vai 1.

8. Pārveidots virsmaktīvais sastāvs saskaņā ar 7. pretenziju, kurā dabiskā virsmaktīvā proteīna SP-C analogs ir ar vispārējo formulu (Ic)



kur

Q ir saskaņā ar iepriekš minēto; un

p ir 0 vai 1.

9. Pārveidots virsmaktīvais sastāvs saskaņā ar 8. pretenziju, kurā dabiskā virsmaktīvā proteīna SP-C analogs ir izvēlēts no grupas:



10. Pārveidota virsmaktīvā viela saskaņā ar 1. pretenziju, kurā dabiskā virsmaktīvā proteīna SP-C polipeptīda analogs ir



un

dabiskā virsmaktīvā proteīna SP-B polipeptīda analogs ir



11. Pārveidota virsmaktīvā viela saskaņā ar 1. pretenziju, kurā dabiskā virsmaktīvā proteīna SP-C polipeptīda analogs ir



un

dabiskā virsmaktīvā proteīna SP-B polipeptīda analogs ir



12. Pārveidota virsmaktīvā viela saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur fosfolipīdu maisījums satur dipalmitoilfosfatidilholīnu (DPPC) un palmitoiloleoilfosfolipīdu, kas izvēlēts no palmitoiloleoilfosfatidilglicerīna (POPG) vai tā maisījuma ar palmitoiloleoilfosfatidilholīnu (POPC) masas attiecības robežās no 95:5 līdz 50:50.

13. Pārveidota virsmaktīvā viela saskaņā ar 12. pretenziju, kurā fosfolipīdu maisījums satur DPPC un POPG masas attiecībā 68:31.

14. Farmaceutiskais sastāvs, kas ietver pārveidotu virsmaktīvu vielu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai.

15. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar 14. pretenziju, kas ir šķīduma, dispersijas, suspensijas vai sausa pulvera veidā.

16. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar 15. pretenziju, kas ir ūdens suspensijas veidā.

17. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar 16. pretenziju, kas ietver pārveidotu virsmaktīvu vielu koncentrācijā no 2 līdz 160 mg/ml.

18. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar 17. pretenziju, kurā pārveidotās virsmaktīvās vielas koncentrācija ir no 20 līdz 80 mg/ml.

19. Pārveidota virsmaktīvā viela saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai, kas paredzēta priekšlaicīgi dzimušu bērnu respiratorā distresa sindroma (RDS) ārstēšanai un profilaksei un citu slimību, kas saistītas ar virsmaktīvu vielu deficītu vai disfunkciju, ārstēšanai vai profilaksei.

20. Pārveidotas virsmaktīvās vielas pielietošana saskaņā ar 19. pretenziju, kur slimības, kas saistītas ar virsmaktīvu vielu deficītu vai disfunkciju, ietver pieaugušo RDS (ARDS), mekonija aspiratoro sindromu (MAS) un bronhopulmonāro displāziju (BPD).

(51) **C07D 471/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/437⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(11) **2086972**

(21) 07864681.7

(22) 20.11.2007

(43) 12.08.2009

(45) 20.11.2013

(31) 860749 P

(32) 22.11.2006 (33) US

(86) PCT/US2007/085289

20.11.2007

(87) WO2008/064255

29.05.2008

(73) The U.S.A. as represented by the Secretary, Department of Health and Human Services, Office of Technology Transfer, National Institutes of Health, 6011 Executive Boulevard, Suite 325 M, Bethesda, MD 20892-7660, US
PLEXXIKON INC., 91 Bolivar Drive, Suite A, Berkeley, CA 94710, US

(72) ZHANG, Chao, US

ZHANG, Jiazhong, US

IBRAHIM, Prabha N., US

ARTIS, Dean R., US

BREMER, Ryan, US

WU, Guoxian, US

ZHU, Hongyao, US

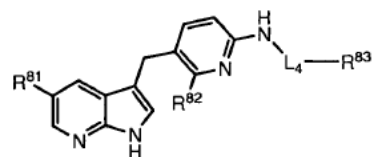
NESPI, Marika, US

(74) Zimmermann & Partner, Postfach 330 920, 80069 München, DE

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

(54) **SAVIEŅOJUMI, KAS MODULĒ C-FMS UN/VAI C-KIT AKTIVITĀTI, UN TO PIELIETOJUMI COMPOUNDS MODULATING C-FMS AND/OR C-KIT ACTIVITY AND USES THEREFOR**

(57) 1. Savienojums, kam piemīt ķīmiskā struktūra kā formulā (III)



vai tā sāls, tautomērs vai stereoisomērs,

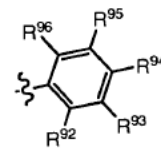
raksturīgs ar to, ka:

L₄ ir -CH₂-, -CH₂CH₂-, -CH(R⁴⁰)-, -C(O)- vai -C(O)NH-,

R⁸¹ ir hlora atoms,

R⁸² ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, C₁₋₃alkilgrupas, fluoraizvietotas C₂₋₃alkilgrupas, OH, C₁₋₃alkoksigrupas un fluoraizvietotas C₁₋₃alkoksigrupas,

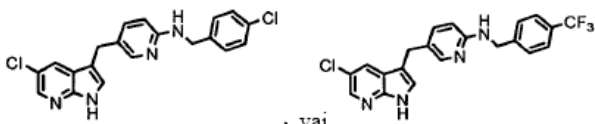
R⁸³ ir heterocikloalkilgrupa, heteroarilgrupa vai



kurā



norāda R⁸³ pievienošanas punktu pie L₄ formulā (III), raksturīga ar to, ka heterocikloalkilgrupa vai heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas ir izvēlēti no grupas, kas satur halogēna atomu, C₁₋₆alkilgrupu, fluoraizvietotu C₁₋₆alkilgrupu, cikloalkilaminogrupu, -NHR⁴¹, -NR⁴¹R⁴¹, -OR⁴¹ un -S(O)₂R⁴¹; R⁹², R⁹³, R⁹⁴, R⁹⁵ un R⁹⁶ ir neatkarīgi izvēlēti no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, halogēna atoma, C₁₋₆alkilgrupas, fluoraizvietotas C₁₋₆alkilgrupas, cikloalkilaminogrupas, -NHS(O)₂R⁴¹, -NHC(O)R⁴¹, -NHR⁴¹, -NR⁴¹R⁴¹, -OR⁴¹ un -S(O)₂R⁴¹; R⁴⁰ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas un fluoraizvietotas C₁₋₆alkilgrupas; R⁴¹ katrā gadījumā ir neatkarīgi izvēlēts no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas, cikloalkilgrupas, heterocikloalkilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas, raksturīgas ar to, ka C₁₋₆alkilgrupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem no grupas, kas satur fluora atomu, C₁₋₆alkoksigrupu, fluoraizvietotu C₁₋₆alkoksigrupu, C₁₋₆alkiltiogrupu, fluoraizvietotu C₁₋₆alkiltiogrupu, mono-alkilamino-grupu, di-alkilamino-grupu, cikloalkilgrupu, heterocikloalkilgrupu, arilgrupu un heteroarilgrupu, un pie tam cikloalkilgrupa, heterocikloalkilgrupa, arilgrupa un heteroarilgrupa ir tādas kā R⁴¹, vai ir kā aizvietotāji C₁₋₆alkilgrupām, kas ir neobligāti aizvietoti ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kura satur -OH, -NH₂, -CN, -NO₂, -S(O)₂NH₂, -C(O)NH₂, -OR⁴², -SR⁴², -NHR⁴², -NR⁴²R⁴², -NR³⁹C(O)R⁴², -NR³⁹S(O)₂R⁴², -S(O)₂R⁴², halogēnu, C₁₋₆alkilgrupu, fluoraizvietotu C₁₋₆alkilgrupu, un cikloalkilamino-grupu, un R⁴² katrā gadījumā ir neatkarīgi izvēlēts no grupas, kas satur C₁₋₆alkilgrupu, heterocikloalkilgrupu un heteroarilgrupu, raksturīgu ar to, ka C₁₋₆alkilgrupa ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kas satur fluora atomu, C₁₋₆alkoksigrupu, fluoraizvietotu C₁₋₆alkoksigrupu, C₁₋₆alkiltiogrupu, fluoraizvietotu C₁₋₆alkiltiogrupu, mono-alkilamino-grupu, di-alkilamino-grupu un cikloalkilamino-grupu, un kuri ir raksturīgi ar to, ka heterocikloalkilgrupa un heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas, kura satur halogēna atomu, -CN, C₁₋₆alkilgrupu, fluoraizvietotu C₁₋₆alkilgrupu, C₁₋₆alkoksigrupu un fluoraizvietotu C₁₋₆alkoksigrupu, tomēr ar nosacījumu, ka šis savienojums nav



2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, izvēlēts no grupas, kas satur (3-hlorpiridin-4-ilmetil)-[5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-amīnu, propān-1-sulfonskābes (3-[[5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-ilamino]-metil]-2,4-difluor-fenil)-amīdu, [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(2-metoksi-piridin-3-ilmetil)-amīnu, (2-hlorbenzil)-[5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-amīnu, [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(2-fluorbenzil)-amīnu, [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(6-trifluormetil-piridin-3-ilmetil)-amīnu, [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(6-metoksi-piridin-3-ilmetil)-amīnu, [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(2-trifluormetil-benzil)-amīnu, [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(2,6-difluor-benzil)-amīnu, [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(2,5-difluor-benzil)-amīnu, [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(5-fluorpiridin-3-ilmetil)-amīnu, [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(2-difluor-metoksibenzil)-amīnu, vai [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(6-(2,2,2-trifluoretoksi)-piridin-3-ilmetil)-amīnu, vai to sāli, tautomēru vai stereoizomēru.

- Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, izvēlēts no grupas, kas satur [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(6-trifluormetil-piridin-3-ilmetil)-amīnu, (3-hlor-piridin-4-ilmetil)-[5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-amīnu, [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(2-fluor-benzil)-amīnu, [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(2-trifluormetil-benzil)-amīnu, [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(2,6-difluor-benzil)-amīnu, (2-hlor-benzil)-[5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-amīnu, [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(6-metoksi-piridin-3-ilmetil)-amīnu, [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(2-metoksi-piridin-3-ilmetil)-amīnu, vai to sāli, tautomēru vai stereoizomēru.
- Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīgs ar to, ka savienojums ir (3-hlor-piridin-4-ilmetil)-[5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-amīns.
- Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīgs ar to, ka savienojums ir [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(2-fluor-benzil)-amīns.
- Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīgs ar to, ka savienojums ir [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(6-trifluormetil-piridin-3-ilmetil)-amīns.
- Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīgs ar to, ka savienojums ir [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(2-trifluormetil-benzil)-amīns.
- Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīgs ar to, ka savienojums ir [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(2,6-difluor-benzil)-amīns.
- Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīgs ar to, ka savienojums ir (2-hlor-benzil)-[5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-amīns.
- Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīgs ar to, ka savienojums ir [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(6-metoksi-piridin-3-ilmetil)-amīns.
- Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīgs ar to, ka savienojums ir [5-(5-hlor-1H-pirololo[2,3-b]piridin-3-ilmetil)piridin-2-il]-(2-metoksi-piridin-3-ilmetil)-amīns.
- Kompozīcija, kas satur farmaceitiski pieņemamu nesēju un savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai.
- Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai vai kompozīcija saskaņā ar 12. pretenziju pielietošanai metodē, lai ārstētu subjektu, kas cieš no c-kit un/vai c-fms mediētas slimības vai stāvokļa, vai ir saslimšanas risks, kura ietver minētā savienojuma vai kompozīcijas efektīva daudzuma ievadīšanu subjektam, raksturīga ar to, ka slimība vai stāvoklis ir izvēlēti no grupas, kas satur tuklo šūnu audzējus, sīkšūnu plaušu vēzi, sēklinieku vēzi, gremošanas trakta stromas audzējus, glioblastomu, astrocītomu, neuroblastomu, sieviešu dzimumceļu karcinomas, neuroektodermālas izcelsmes sarkomas, taisnās zarnas vēzi, karcinomu *in situ*, Švāna šūnu neoplāziju kas saistīta ar neurofibromatozi, akūtu mieloīdo leukēmiju, akūtu limfocītisko leukēmiju, hronisku mielogēno leukēmiju, multiplo mielomu, mastocitozi, melanomu, krūts vēzi, olnīcu vēzi, prostatas vēzi, sūņu tuklo šūnu audzējus, vēža metastāzes kaulos vai citos orgānos, hipertrofiju, astmu, reimatoīdo artrītu, alerģisko rinītu, izkaisīto sklerozi, iekaisīgu zarnu sindromu, transplantāta atgrūšanu, sistēmisko vilkēdi, čūlaino kolītu, Krona slimību, hronisku obstruktīvu plaušu slimību, emfizēmu, aterosklerozi, pirmā tipa diabētu, otrā tipa diabētu, insulīna rezistenci, hiperglikēmiju, lipolīzi, hipereozinofiliju, osteoporozī, paaugstinātu risku kaulu lūzumiem, Pageta slimību, hiperkalcēmiju, glomerulonefrītu, intersticiālu nefrītu, *lupus* nefrītu, tubulāro nekrozi, diabētisku nefropātiju, trieku, Alcheimera slimību, Pārkinsona slimību, iekaisīgas sāpes, hroniskas sāpes un kaulu sāpes.
- Savienojums vai kompozīcija lietošanai saskaņā ar 13. pretenziju, raksturīgi ar to, ka savienojums ir apstiprināts ievadīšanai cilvēkam.
- Komplekts, kas ietver kompozīciju saskaņā ar 12. pretenziju.

16. Komplekts saskaņā ar 15. pretenziju, raksturīgs ar to, ka kompozīcija ir apstiprināta medicīniskai indikācijai, kas izvēlēta no grupas, kas satur tuklo šūnu audzējus, sīkšūnu plaušu vēzi, sēklinieku vēzi, gremošanas trakta stromas audzējus, glioblastomu, astrocitomu, neuroblastomu, sieviešu dzimumceļu karcinomas, neiroektodermālas izcelsmes sarkomas, taisnās zarnas vēzi, karcinomu *in situ*, Švāna šūnu neoplāziju kas saistīta ar neirofibromatozi, akūtu mieloīdo leukēmiju, akūtu limfocītisko leukēmiju, hronisku mielogēno leukēmiju, multiplo mielomu, mastocitozi, melanomu, krūts vēzi, olnīcu vēzi, prostatas vēzi, suņu tuklo šūnu audzējus, vēža metastāzes kaulos vai citos orgānos, hipertrofiju, astmu, reimatoīdo artrītu, alerģisko rinītu, izkaisīto sklerozī, iekaisīgu zarnu sindromu, transplantāta atgrūšanu, sistēmisko vilkēdi, čūlaino kolītu, Krona slimību, hronisku obstruktīvu plaušu slimību, emfizēmu, aterosklerozī, pirmā tipa diabētu, otrā tipa diabētu, insulīna rezistenci, hiperglikēmiju, lipolīzi, hipereozinofiliju, osteoporozī, paaugstinātu risku kaulu lūzumiem, Pageta slimību, hiperkalcēmiju, glomerulonefrītu, intersticiālu nefrītu, *lupus* nefrītu, tubulāro nekrozi, diabētisku nefropātiju, trieku, Alzheimeras slimību, Pārkinsona slimību, iekaisīgas sāpes, hroniskas sāpes un kaulu sāpes.

- (51) **C07H 7/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2102224**
A61K 31/70⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 07850306.7 (22) 03.12.2007
 (43) 23.09.2009
 (45) 12.02.2014
 (31) 2006327019 (32) 04.12.2006 (33) JP
 868426 P 04.12.2006 US
 (86) PCT/JP2007/073729 03.12.2007
 (87) WO2008/069327 12.06.2008
 (73) Mitsubishi Tanabe Pharma Corporation, 2-6-18, Kitahama Chuo-ku Osaka-shi, Osaka 541-8505, JP
 (72) NOMURA, Sumihiro, JP
 KAWANISHI, Eiji, JP
 (74) Vossius & Partner, Siebertstrasse 4, 81675 München, DE
 Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV
 (54) **1-(BETA-D-GLIKOPIRANOZIL)-4-METIL-3-[5-(4-FLUORFENIL)-2-TIENILMETIL]BENZOLA HEMIHDRĀTA KRISTĀLISKA FORMA**
CRYSTALLINE FORM OF 1-(B-D-GLUCOPYRANOSYL)-4-METHYL-3-[5-(4-FLUOROPHENYL)-2-THIENYLMETHYL]BENZENE HEMIHYDRATE

(57) 1. 1-(β-D-glikopiranozil)-4-metil-3-[5-(4-fluorfenil)-2-tienilmetil]benzola hemihidrāta kristāliska forma, kuras rentgenstaru difraktogramma būtībā ir tāda, kā attēlots 1. zīmējumā.

2. 1-(β-D-glikopiranozil)-4-metil-3-[5-(4-fluorfenil)-2-tienilmetil]benzola hemihidrāta kristāliska forma, kuras IS spektri ir būtībā tādi, kā attēlots 2. zīmējumā.

3. 1-(β-D-glikopiranozil)-4-metil-3-[5-(4-fluorfenil)-2-tienilmetil]benzola hemihidrāta kristāliska forma saskaņā ar 2. pretenziju, kurai ir šādi galvenie maksimumi IS spektros: 1626, 1600, 1549 un 1507 cm⁻¹.

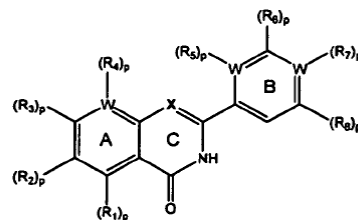
4. Process 1-(β-D-glikopiranozil)-4-metil-3-[5-(4-fluorfenil)-2-tienilmetil]benzola hemihidrāta kristāliskas formas saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju iegūšanai, kas ietver 1-(β-D-glikopiranozil)-4-metil-3-[5-(4-fluorfenil)-2-tienilmetil]benzola šķīduma veidošanu ūdenī saturošā šķīdinātājā un minētā hemihidrāta kristalizēšanu no šķīduma, nogulsnešanas vai rekristalizācijas ceļā.

5. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur efektīvu 1-(β-D-glikopiranozil)-4-metil-3-[5-(4-fluorfenil)-2-tienilmetil]benzola hemihidrāta kristāliskas formas saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju daudzumu un farmaceitiski pieņemamu nesēju.

6. 1-(β-D-glikopiranozil)-4-metil-3-[5-(4-fluorfenil)-2-tienilmetil]benzola hemihidrāta kristāliska forma saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju izmantošanai cukura diabēta, diabētiskās retinopātijas, diabētiskās neiropātijas, diabētiskas nefropātijas, kavētas brūču dzīšanas, insulīna rezistences, hiperglikēmijas, hiperinsulinēmijas, palielināta taukskābju līmeņa asinīs, palielināta glicerīna līmeņa asinīs, hiperlipidēmijas, aptaukošanās, hipertrigliceridēmijas, X sindroma, diabētisko komplikāciju, aterosklerozes vai hipertensijas ārstēšanai, progresēšanas vai attīstīšanās aizkavēšanai.

- (51) **C07D 239/91**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2118074**
A61K 31/4375⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/472⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/496⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/517⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/519⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/5377⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 3/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 9/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 217/24⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 401/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 401/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 403/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 405/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 413/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 471/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

- (21) 07710597.1 (22) 01.02.2007
 (43) 18.11.2009
 (45) 22.01.2014
 (86) PCT/CA2007/000146 01.02.2007
 (87) WO2008/092231 07.08.2008
 (73) RESVERLOGIX CORP., 202, 279 Midpark Way S.E., Calgary, Alberta T2X 1M2, CA
 (72) HANSEN, Henrik, CA
 (74) von Uexküll - Guldenband, Alexa, et al, Vossius & Partner, Siebertstrasse 4, 81675 München, DE
 Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV
 (54) **SAVIEŅOJUMI SIRDS UN ASINSVADU SLIMĪBU PROFILAKSEI UN ĀRSTĒŠANAI**
COMPOUNDS FOR THE PREVENTION AND TREATMENT OF CARDIOVASCULAR DISEASES
 (57) 1. Savienojums ar formulu (II) izmantošanai ApoA-I ekspresijas palielināšanai zidītājā:



Formula II

kur:

X ir slāpekļa atoms;

R₁ un R₃ katrs neatkarīgi ir izvēlēti no alkoksigrupas un ūdeņraža atoma;

R₂ ir izvēlēts no alkoksigrupas, alkilgrupas un ūdeņraža atoma;

R₆ un R₈ katrs neatkarīgi ir izvēlēti no alkilgrupas, alkoksigrupas, hlorīdgrupas un ūdeņraža atoma;

R₄ un R₅ ir ūdeņraža atoms;

R₇ ir izvēlēts no aminogrupas, hidroksilgrupas, alkoksigrupas un alkilgrupas, aizvietotas ar heterociklilgrupu, vai

divi blakus aizvietotāji, kas izvēlēti no R₆, R₇ un R₈, ir savienoti, lai veidotu heterociklilgrupu;

katrs W neatkarīgi ir izvēlēts no oglekļa atoma un slāpekļa atoma; p ir 1, izņemot, ja W ir N, tad p ir 0;

kur „alkil”, „alkenil”, „alkinil”, „alkoksi”, „amino” un „amīd” grupas var būt aizvietotas vai pārtrauktas, vai sazarotas ar vismaz vienu grupu,

izvēlētu no alkoksigrupas, ariloksigrupas, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, amīdgrupas, aminogrupas, arilgrupas, arilalkilgrupas, karbamātgrupas, karboksilgrupas, ciāngrupas, cikloalkilgrupas, estergrupas, ētergrupas, formilgrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, heteroarilgrupas, heterociklilgrupas, hidroksilgrupas, ketongrupas, nitrogrupas, fosfātgrupas, sulfīdgrupas, sulfīnīlgrupas, sulfonilgrupas, sulfonskābes grupas, sulfonamīdgrupas, tioketongrupas, ureidogrupas un slāpekļa atoma;

ar nosacījumu, ka, ja R₂ ir izvēlēts no alkoksigrupas vai ūdeņraža atoma, tad vismaz viens no R₁, un R₃ ir alkoksigrupa;

ar nosacījumu, ka, ja R₇ ir izvēlēts no hidroksilgrupas vai alkoksigrupas, tad vismaz viens no R₆ un R₈ neatkarīgi ir izvēlēts no alkilgrupas, alkoksigrupas un hlorīdgrupas;

ar nosacījumu, ka, ja $W-(R_7)_p$, W ir slāpekļa atoms un p ir 0, tad vismaz viens no R_6 un R_8 ir hlorīdgrupa; un tā farmaceutiski pieņemami sāļi un hidrāti.

2. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur vismaz viens no R_6 un R_8 ir izvēlēts no alkilgrupas, alkoksigrupas un hlorīdgrupas.

3. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur R_6 un R_8 katrs ir ūdeņraža atoms un $W-(R_7)_p$ ir $C-(R_7)_p$.

4. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur abi R_6 un R_8 nav ūdeņraža atoms.

5. Savienojums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1., 2. un 4. pretenzijas, kur

R_1 un R_3 ir alkoksigrupas;

R_6 un R_8 ir alkilgrupas; un

R_7 ir alkoksigrupa, aizvietota ar hidroksilgrupu.

6. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur R_7 ir izvēlēts no hidroksilgrupas, aminogrupas un alkoksigrupas.

7. Savienojums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1., 2., 4., 5. un 6. pretenzijas, kur savienojums ar formulu (II) ir 2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ons vai tā farmaceutiski pieņemams sāls vai hidrāts.

8. Savienojums izmantošanai ApoA-1 palielināšanai zīdītājā, kur savienojums ir izvēlēts no:

2-(4-hidroksi-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

2-(4-hidroksi-3-metoksifenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

2-(4-(bis(2-hidroksietil)amino)fenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

2-(4-(bis(2-hidroksietil)amino)fenil)-6,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

2-(2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioksin-6-il)-6,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

2-(4-((4-etilpiperazin-1-il)metil)fenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetoksihiprido[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona;

2-(2-hlor-6-metilpiridin-4-il)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

5,7-dimetoksi-2-(4-metoksi-3,5-dimetilfenil)hinazolin-4(3H)-ona;

2-(4-amino-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

N1-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)-N2-metilftalamīda;

2-(4-(2-aminoetoksi)-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)-4-metoksibenzolsulfonamīda;

4-hlor-N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)benzolsulfonamīda;

N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)metānsulfonamīda;

2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil propilkarbamāta;

2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil metilkarbamāta;

N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)-4-metilbenzamīda;

2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil cikloheksilkarbamāta;

N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)benzolsulfonamīda;

N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)-4-metilbenzolsulfonamīda;

N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)-4-metoksibenzamīda;

N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)acetamīda;

N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)benzamīda;

N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)izobutiramīda;

1-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)-3-metilurīnvielas;

1-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)-3-(4-metoksifenil)urīnvielas;

1-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)-3-fenilurīnvielas; un

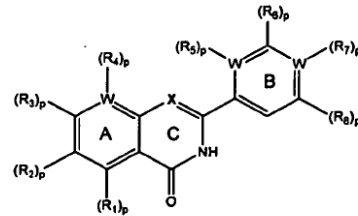
3-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)-1,1-dimetilurīnvielas,

vai tā farmaceutiski pieņemama sāls vai hidrāta.

9. Savienojums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kur terapeitiski efektīvs savienojuma ar formulu (II) daudzums tiek ievadīts ar farmaceutiski pieņemamu nesēju farmaceutiski pieņemamā kompozīcijā.

10. Savienojums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kas papildus ietver sirds un asinsvadu, ar holesterīnu vai lipīdiem saistīta traucējuma ārstēšanu vai profilaksi.

11. Savienojums ar formulu (II):



Formula II

kur:

X ir slāpekļa atoms;

R_1 un R_3 katrs neatkarīgi ir izvēlēti no alkoksigrupas un ūdeņraža atoma;

R_2 ir izvēlēts no alkoksigrupas, alkilgrupas un ūdeņraža atoma;

R_6 un R_8 katrs neatkarīgi ir izvēlēti no alkilgrupas, alkoksigrupas, hlorīdgrupas un ūdeņraža atoma;

R_4 un R_5 ir ūdeņraža atoms;

R_7 ir izvēlēts no aminogrupas, hidroksilgrupas, alkoksigrupas un alkilgrupas, aizvietotas ar heterociklilgrupu, vai divi blakus aizvietotāji, kas izvēlēti no R_6 , R_7 un R_8 , ir savienoti, lai veidotu heterociklilgrupu;

katrs W neatkarīgi ir izvēlēts no oglekļa atoma un slāpekļa atoma; p ir 1, izņemot, ja W ir slāpekļa atoms, tad p ir 0;

ar nosacījumu, ka, ja R_2 ir izvēlēts no alkoksigrupas vai ūdeņraža atoma, tad vismaz viens no R_1 un R_3 ir alkoksigrupa;

ar nosacījumu, ka, ja R_7 ir izvēlēts no hidroksilgrupas vai alkoksigrupas, tad vismaz viens no R_6 un R_8 neatkarīgi ir izvēlēti no alkilgrupas, alkoksigrupas un hlorīdgrupas;

ar nosacījumu, ka, ja $W-(R_7)_p$, W ir slāpekļa atoms un p ir 0, tad vismaz viens no R_6 un R_8 ir hlorīdgrupa; un tā farmaceutiski pieņemami sāļi un hidrāti.

12. Savienojums saskaņā ar 11. pretenziju, kur savienojums ir 2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ons vai tā farmaceutiski pieņemams sāls vai hidrāts.

13. Savienojums, izvēlēts no:

2-(4-hidroksi-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

2-(4-hidroksi-3-metoksifenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

2-(4-(bis(2-hidroksietil)amino)fenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

2-(4-(bis(2-hidroksietil)amino)fenil)-6,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

2-(2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioksin-6-il)-6,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

2-(4-((4-etilpiperazin-1-il)metil)fenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetoksihiprido[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona;

2-(2-hlor-6-metilpiridin-4-il)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

5,7-dimetoksi-2-(4-metoksi-3,5-dimetilfenil)hinazolin-4(3H)-ona;

2-(4-amino-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

N1-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)-N2-metilftalamīda;

2-(4-(2-aminoetoksi)-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetoksihinazolin-4(3H)-ona;

N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)-4-metoksibenzolsulfonamīda;

4-hlor-N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)benzolsulfonamīda;

N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohinazolin-2-il)-2,6-dimetilfenoksi)etil)metānsulfonamīda;

2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohiazolin-2-il)-2,6-dimetil-fenoksi)etil propilkarbamāta;
 2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohiazolin-2-il)-2,6-dimetil-fenoksi)etil metilkarbamāta;
 N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohiazolin-2-il)-2,6-dimetil-fenoksi)etil)-4-metilbenzamīda;
 2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohiazolin-2-il)-2,6-dimetil-fenoksi)etil cikloheksilkarbamāta;
 N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohiazolin-2-il)-2,6-dimetil-fenoksi)etil)benzolsulfonamīda;
 N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohiazolin-2-il)-2,6-dimetil-fenoksi)etil)-4-metilbenzolsulfonamīda;
 N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohiazolin-2-il)-2,6-dimetil-fenoksi)etil)-4-metoksibenzamīda;
 N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohiazolin-2-il)-2,6-dimetil-fenoksi)etil)acetamīda;
 N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohiazolin-2-il)-2,6-dimetil-fenoksi)etil)benzamīda;
 N-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohiazolin-2-il)-2,6-dimetil-fenoksi)etil)izobutiramīda;
 1-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohiazolin-2-il)-2,6-dimetil-fenoksi)etil)-3-metilurīnvielas;
 1-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohiazolin-2-il)-2,6-dimetil-fenoksi)etil)-3-(4-metoksifenil)urīnvielas;
 1-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohiazolin-2-il)-2,6-dimetil-fenoksi)etil)-3-fenilurīnvielas; un
 3-(2-(4-(5,7-dimetoksi-4-okso-3,4-dihidrohiazolin-2-il)-2,6-dimetil-fenoksi)etil)-1,1-dimetilurīnvielas;
 un to farmaceitiski pieņemamiem sāļiem un hidrātiem.

14. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 13. pretenzijai un farmaceitiski pieņemamu nesēju.

15. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 11., 12. vai 13. pretenzijas izmantošanai sirds un asinsvadu, ar holesterīnu vai lipīdiem saistītu traucējumu ārstēšanai.

16. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 11., 12. vai 13. pretenzijas izmantošanai ApoA-1 ekspresijas palielināšanai zīdītājā.

- (51) **C12Q 1/68⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2121989**
G01N 33/574⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 08742061.8 (22) 11.03.2008
 (43) 25.11.2009
 (45) 22.01.2014
 (31) 906943 P (32) 13.03.2007 (33) US
 (86) PCT/US2008/003312 11.03.2008
 (87) WO2008/112269 18.09.2008
 (73) Amgen Inc., One Amgen Center Drive, Thousand Oaks, CA 91320-1799, US
 (72) FREEMAN, Daniel, US
 JUAN, Todd, US
 RADINSKY, Robert, US
 (74) Grünecker, Kinkeldey, Stockmair & Schwanhäusser Anwaltssozietāt, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE
 Lūcija KUJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV

(54) **K-RAS MUTĀCIJAS UN ANTI-EGFR ANTIVIELU TERAPIJA**
K-RAS MUTATIONS AND ANTI-EGFR ANTIBODY THERAPY

(57) 1. Metode prognozēšanai, vai pacients, kas cieš no kolorektālā vēža, nereaģēs uz ārstēšanu ar panitumumabu, kas ietver K-ras mutācijas esamības vai neesamības noteikšanu minētā pacienta audzējā, turklāt K-ras mutācija ir izvēlēta no G12S, G12V, G12D, G12A, G12C un G13D, un, ja K-ras mutācija ir, tiek prognozēts, ka pacients nereaģēs uz ārstēšanu ar panitumumabu.

2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt K-ras mutācijas esamības vai neesamības audzējā noteikšanas solis ietver no audzēja iegūtas K-ras nukleīnskābes amplificēšanu un amplificētās nukleīnskābes sekvenēšanu.

3. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt K-ras mutācijas esamības vai neesamības audzējā noteikšanas solis ietver mutēta

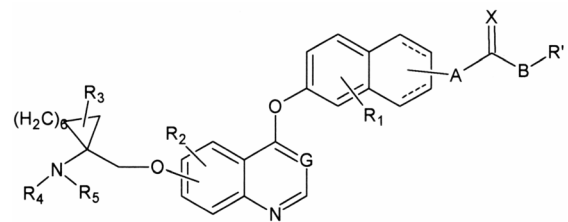
K-ras polipeptīda detektēšanu audzēja paraugā, izmantojot aģentu, kas specifiski saistās ar mutēto K-ras polipeptīdu.

4. Metode prognozēšanai, vai kolorektālā vēža audzējs nereaģēs uz ārstēšanu ar panitumumabu, kas ietver K-ras mutācijas esamības vai neesamības noteikšanu minētā audzēja paraugā, turklāt K-ras mutācija ir izvēlēta no G12S, G12V, G12D, G12A, G12C un G13D, un K-ras mutācijas esamība norāda uz to, ka audzējs nereaģēs uz ārstēšanu ar panitumumabu.

5. Metode saskaņā ar 4. pretenziju, turklāt K-ras mutācijas esamības vai neesamības minētā audzēja paraugā noteikšanas solis ietver no audzēja iegūtas K-ras nukleīnskābes amplificēšanu un amplificētās nukleīnskābes sekvenēšanu.

6. Metode saskaņā ar 4. pretenziju, turklāt K-ras mutācijas esamības vai neesamības minētā audzēja paraugā noteikšanas solis ietver mutēta K-ras polipeptīda detektēšanu audzēja paraugā, izmantojot aģentu, kas specifiski saistās ar mutēto K-ras polipeptīdu.

- (51) **C07D 215/26⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2125777**
C07D 413/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/47⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 35/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 08730590.0 (22) 24.02.2008
 (43) 02.12.2009
 (45) 10.04.2013
 (31) 894693 P (32) 14.03.2007 (33) US
 941699 P 04.06.2007 US
 36245 23.02.2008 US
 (86) PCT/US2008/054817 24.02.2008
 (87) WO2008/112408 18.09.2008
 (73) Advenchen Laboratories, LLC, 9135 Reseda Blvd, Ste 238, Northridge, CA 91324, US
 (72) CHEN, Guoqing, Paul, US
 (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) **SPIROAIZVIETOTI SAVIENOJUMI KĀ ANGIOĢENĒZES INHIBITORI**
SPIRO SUBSTITUTED COMPOUNDS AS ANGIOGENESIS INHIBITORS
 (57) 1. Savienojums ar formulu (III)



Formula (III),

kur

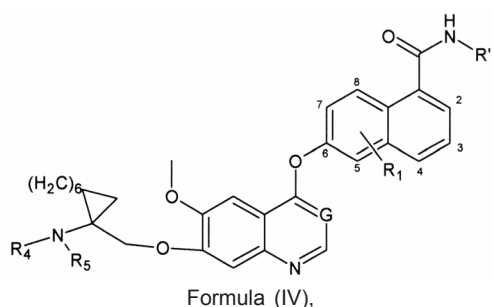
- A ir izvēlēts no tiešās saites vai -N(R')-;
 B ir izvēlēts no -N(R')-, -C(=X)- vai -C(=X)N(R')-;
 R' ir izvēlēts no grupas: H, halogēna atoms, halogēn-(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₆)alkilgrupa, arilgrupa vai heterociklilgrupa;
 G ir CH vai N;
 R1, R2 un R3 katrs neatkarīgi ir izvēlēts no grupas: H, halogēna atoms, halogēn-(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₆)alkilgrupa, hidroksilgrupa, (C₁-C₆)alkoksigrupa;
 R4 un R5 katrs neatkarīgi ir izvēlēts no grupas: H, halogēna atoms, halogēn-(C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₆)alkilgrupa, hidroksilgrupa, (C₁-C₆)alkoksigrupa, (C₁-C₆)alkoksialkoksigrupa, (C₂-C₆)alkenilgrupa, (C₂-C₆)alkinilgrupa, (C₁-C₆)alkil-OC(=O)-grupa, aril-OC(=O)-grupa, aril-(C₁-C₆)alkilēn-OC(=O)-grupa, (C₁-C₆)alkil-C(=O)-grupa, aril-C(=O)-grupa vai aril-(C₁-C₆)alkilēn-C(=O)-grupa;
 b ir izvēlēts no 1, 2 vai 3;

un kur

termins „arilgrupa” nozīmē organiskā savienojuma atlikumu, kas iegūts, aizvācot vienu ūdeņraža atomu no aromātiskā ogļūdeņraža, un nav aizvietojams, vai ir aizvietojams ar vienu vai diviem

aizvietotājiem, kas izvēlēti no grupas: halogēna atoms, halogēnzemākā alkilgrupa, zemākā alkilgrupa, zemākā alkenilgrupa, zemākā alkinilgrupa, cianogrupa, zemākā alkilcianogrupa, hidroksilgrupa, zemākā alkoksigrupa, karboksilgrupa, karboksialkilgrupa, amino-grupa, karbamoilgrupa, karbamāts, ureidogrupa, merkaptogrupa, sulfogrupa, zemākā alkilsufinilgrupa, zemākā alkānsulfonilgrupa, sulfonamīds; pie kam arilgrupa satur vienu aromātisku gredzenu, kas kondensēts ar alifātisku gredzenu; termins „heterociklilgrupa” nozīmē nearomātiskus, vienkāršus un kondensētus gredzenus, kuri satur līdz 4 heteroatomiem katrā gredzenā, pie kam katrs neatkarīgi ir izvēlēts no grupas: O, N un S, un gredzeni var būt neaizvietoti vai aizvietoti ar, piemēram, līdz 3 aizvietotājiem; katram heterocikliskajam gredzenam ir no 4 līdz 7, ieteicams 5 vai 6, gredzenu atomi; kondensētu heterociklisko gredzenu sistēma satur karbocikliskos gredzenus un tikai vienu heterociklisko gredzenu, kurš var būt daļēji piesātināts vai piesātināts; heterocikls un heterocikliskie gredzeni var būt pēc izvēles aizvietoti un aizvietotāji ir izvēlēti no grupas, kas ir saskaņā ar augstāk minētajiem arilgrupas aizvietotājiem; vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu (IV)



kur

R₁ ir izvēlēts no H vai 5-F;

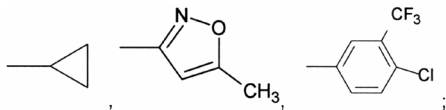
R₂ ir H vai CH₃;

R₅ ir izvēlēts no grupas: H, CH₃, CH₃CO-, BzIOCO- vai t-BuOCO-;

b ir izvēlēts no 1, 2 vai 3;

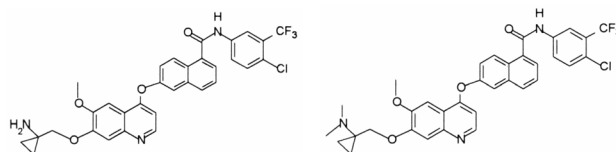
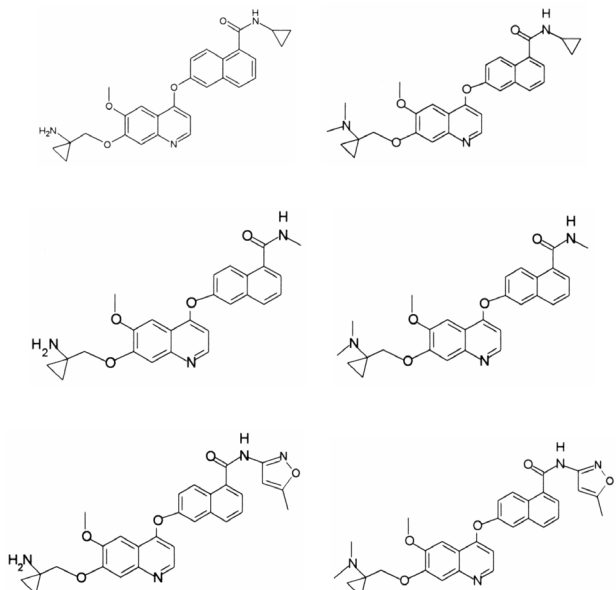
G ir CH vai N;

R¹ ir izvēlēts no šādas grupas: H, CH₃,



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir izvēlēts no grupas, kas ietver:



vai to farmaceutiski pieņemami sāļi.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš izvēlēts no grupas, kas ietver:

benzil-1-((6-metoksi-4-(5-(metilkarbamoil)naftalen-2-iloksi)hinolin-7-iloksi)metil)ciklopropilkarbamāts;

benzil-1-((4-(5-(ciklopropilkarbamoil)naftalen-2-iloksi)-6-metoksihinolin-7-iloksi)metil)-ciklopropilkarbamāts;

6-(7-((1-aminociklopropil)metoksi)-6-metoksihinolin-4-iloksi)-N-metil-1-naftamīds;

6-(7-((1-(dimetilamino)ciklopropil)metoksi)-6-metoksihinolin-4-iloksi)-N-metil-1-naftamīds;

6-(7-((1-aminociklopropil)metoksi)-6-metoksihinolin-4-iloksi)-N-ciklopropil-1-naftamīds;

N-ciklopropil-6-(7-((1-(dimetilamino)ciklopropil)metoksi)-6-metoksihinolin-4-iloksi)-1-naftamīds;

6-(7-((1-aminociklopropil)metoksi)-6-metoksihinolin-4-iloksi)-N-(5-metilizoksazol-3-il)-1-naftamīds;

6-(7-((1-(dimetilamino)ciklopropil)metoksi)-6-metoksihinolin-4-iloksi)-N-(5-metilizoksazol-3-il)-1-naftamīds;

6-(7-((1-aminociklopropil)metoksi)-6-metoksihinolin-4-iloksi)-N-(3-metilizoksazol-5-il)-1-naftamīds;

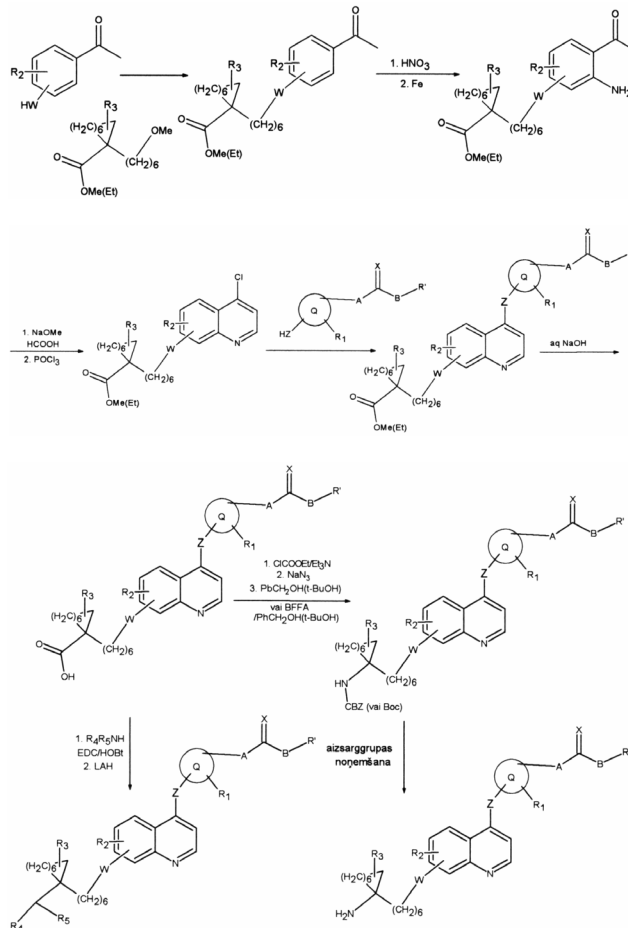
6-(7-((1-(dimetilamino)ciklopropil)metoksi)-6-metoksihinolin-4-iloksi)-N-(3-metilizoksazol-5-il)-1-naftamīds;

6-(7-((1-aminociklopropil)metoksi)-6-metoksihinolin-4-iloksi)-N-(4-hloro-3-(trifluormetil)fenil)-1-naftamīds;

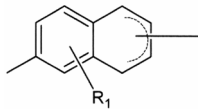
N-(4-hloro-3-(trifluormetil)fenil)-6-(7-((1-(dimetilamino)ciklopropil)metoksi)-6-metoksihinolin-4-iloksi)-1-naftamīds;

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

5. Paņēmiens savienojuma, kas ir saskaņā ar 1. pretenziju, ražošanai, izmantojot šādu ķīmisko procesu:



kur R₁, R₂, R₃, R', A, B, X un b ir saskaņā ar 1. pretenziju, Z un W ir O, c ir 1 un Q ir šāda grupa:



6. Farmaceutiska kompozīcija, kura kā aktīvo vielu satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai savienojuma farmaceutiski pieņemams sāls, vai savienojuma hidrāts vai solvāts, un farmaceutiski pieņemams nesējs.

7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kurš paredzēts izmantošanai vēža ārstēšanā.

8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kurš paredzēts izmantošanai angioģenēzes ārstēšanā.

- (51) **C07K 16/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2125889**
A61K 39/395⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 39/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 31/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 08725537.8 (22) 13.02.2008
(43) 02.12.2009
(45) 15.01.2014
(31) 902432 P (32) 21.02.2007 (33) US
(86) PCT/US2008/001922 13.02.2008
(87) WO2008/108918 12.09.2008
(73) University of Massachusetts, 225 Franklin Street, 12th Floor, Boston, MA 02110, US
(72) BROERING, Teresa, US
SLOAN, Susan, US
BABCOCK, Gregory, J., US
AMBROSINO, Donna, US
THOMAS, William D., Jr., US
(74) Tuxworth, Pamela M., J A Kemp, 14 South Square, Gray's Inn, London WC1R 5JJ, GB
Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga, LV-1050, LV
- (54) **CILVĒKA ANTIVIELAS PRET HEPATĪTA C VĪRUSU (HCV) UN TO IZMANTOŠANA**
HUMAN ANTIBODIES AGAINST HEPATITIS C VIRUS (HCV) USES THEREOF
- (57) 1. Izolēta cilvēka monoklonāla antivielai vai tās antigēnu saistošs fragments, kur antivielai vai tās antigēnu saistošais fragments satur:
(a) smagās un vieglās ķēdes mainīgus reģionus, kas satur sekvences SEQ ID NO: 1 un 2; vai
(b) smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR3 sekvenci, kas satur SEQ ID NO: 9, vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR3 sekvenci, kas satur SEQ ID NO: 18, smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR2 sekvenci, kas satur SEQ ID NO: 8, vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR2 sekvenci, kas satur SEQ ID NO: 17, smagās ķēdes mainīgā reģiona CDR1 sekvenci, kas satur SEQ ID NO: 7, un vieglās ķēdes mainīgā reģiona CDR1 sekvenci, kas satur SEQ ID NO: 6.
2. Antivielai saskaņā ar 1. pretenziju, kur antivielai ir pilna garuma antivielai.
3. Antivielai vai tās antigēnu saistošs fragments saskaņā ar 1. pretenziju, kas:
- satur Fc domēnu; vai
- ir vienas ķēdes antivielai; vai
- ir Fab fragments.
4. Izolēts polipeptīds, kas satur antivielas antigēnu saistošo fragmentu saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām.
5. Kompozīcija, kas satur antivielu vai antigēnu saistošo fragmentu saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām un farmaceutiski pieņemamu nesēju.
6. Izolēta nukleīnskābe, kas kodē antivielas, kas saista HCV, mainīgo reģionu, minētā nukleīnskābe satur SEQ ID NO: 25 un SEQ ID NO: 26.
7. Ekspresijas vektors vai saimniekšūna, kas satur nukleīnskābi saskaņā ar 6. pretenziju.
8. Komplekts, kas satur vienu vai vairākas izolētas monoklonālas antivielas vai to saistošus fragmentus saskaņā ar jebkuru

no 1. līdz 3. pretenzijai un instrukcijas lietošanai HCV izraisītas slimības ārstēšanā.

9. Izolēta monoklonāla antivielai vai tās antigēnu saistošs fragments saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai izmantošanai HCV infekcijas individuā ārstēšanas metodē.

10. Antivielai vai tās antigēnu saistošs fragments saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai izmantošanai HCV infekcijas ārstēšanas metodē saskaņā ar 9. pretenziju, kur:

- (a) indivīds ir cilvēks; vai
- (b) antivielai vai tās antigēnu saistošais fragments ir paredzēts intravenozai, intramuskulārai vai subkutānai ievadīšanai.

11. Antivielai vai tās antigēnu saistošs fragments saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai izmantošanai HCV infekcijas ārstēšanas metodē saskaņā ar 9. pretenziju, kurā metode ietver minētās antivielas vai tās antigēnu saistošā fragmenta ievadīšanu kombinācijā ar otru terapeitisku līdzekli, kas ir izvēlēts no:

- (i) otras antivielas vai tās antigēnu saistošā fragmenta;
- (ii) antivirāla līdzekļa; vai
- (iii) HCV vakcīnas, kas neobligāti ir HCV2 E2 proteīns vai tā fragments.

12. Kompozīcija izmantošanai HCV izraisītas zīdītāja slimības vai stāvokļa ārstēšanas metodē, kurā minētā kompozīcija satur antivielu vai tās antigēnu saistošo fragmentu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai farmaceutiski pieņemamā nesējā.

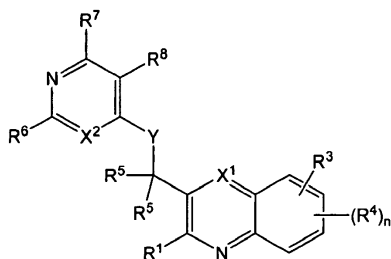
13. Kompozīcija saskaņā ar 12. pretenziju izmantošanai HCV izraisītas slimības vai stāvokļa ārstēšanas metodē saskaņā ar 12. pretenziju, kurā minētā kompozīcija papildus satur otru antivielu, kas saista HCV.

14. Paņēmiens HCV infekcijas atrašanai zīdītājā, kas ietver ķermeņa šķidruma, kas iegūts no zīdītāja, kontaktēšanu ar antivielu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai vai ar tās antigēnu saistošo fragmentu un noteikšanu, ja notiek saistīšana, minētā saistīšana norāda uz HCV infekcijas esamību.

- (51) **A61K 39/395⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2131860**
(21) 08731905.9 (22) 11.03.2008
(43) 16.12.2009
(45) 18.12.2013
(31) 895813 P (32) 20.03.2007 (33) US
(86) PCT/US2008/056527 11.03.2008
(87) WO2008/115732 25.09.2008
(73) Eli Lilly & Company, Lilly Corporate Center, Indianapolis, IN 46285, US
(72) KORYTKO, Andrew Ihor, US
MARQUIS, David Matthew, US
SMITH, Eric Michael, US
SWANSON, Barbara Anne, US
(74) Kent, Lindsey Ruth, Eli Lilly and Company Limited, Lilly Research Center, Erl Wood Manor, Sunninghill Road, Windlesham, Surrey GU20 6PH, GB
Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **ANTI-SKLEROSTĪNA ANTIVIELAS**
ANTI-SCLEROSTIN ANTIBODIES
- (57) 1. Antivielai vai tās funkcionāls fragments, kas specifiski saista cilvēka sklerostīnu, raksturīga ar to, ka antivielai vai tās funkcionālais fragments ietver sešus CDR ar sekojošām aminoskābju sekvencēm: HCDR1 ar SEQ ID NO: 26, HCDR2 ar SEQ ID NO: 27, HCDR3 ar SEQ ID NO: 28, LCDR1 ar SEQ ID NO: 29, LCDR2 ar SEQ ID NO: 30 un LCDR3 ar SEQ ID NO: 31.
2. Antivielai vai tās funkcionālais fragments saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver smagās ķēdes variablu rajonu un vieglās ķēdes variablu rajonu, raksturīga ar to, ka smagās ķēdes variablais rajons atbilst aminoskābju sekvencei SEQ ID NO: 15 un vieglās ķēdes variablais rajons atbilst aminoskābju sekvencei SEQ ID NO: 18.
3. Antivielai vai tās funkcionāls fragments saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas ietver smagās ķēdes polipeptīdu ar aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 3 un vieglās ķēdes polipeptīdu ar aminoskābju sekvenci SEQ ID NO: 6.
4. Farmaceutiska kompozīcija, kas ietver antivielu saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām un farmaceutiski pieņemamu nesēju vai atšķaidītāju.

5. Antiviela vai tās funkcionāls fragments saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai lietošanai par medikamentu.
6. Antiviela vai tās funkcionāls fragments saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai lietošanai, lai cilvēkam paaugstinātu vismaz vienu no parametriem: kaulu masu, kaulu minerāla blīvumu, kaulu minerāla saturu vai kaulu stiprumu.
7. Antiviela vai tās funkcionāls fragments saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai lietošanai slimību vai traucējumu, kas izvēlēti no osteoporozes, osteopēnijas, osteoartrīta, ar osteoartrītu saistītām sāpēm, reimatoīdā artrīta, periodontālās slimības vai multiplās mielomas, ārstēšanai cilvēkam.
8. Antiviela vai tās funkcionāls fragments saskaņā ar 7. pretenziju lietošanai osteoporozes ārstēšanai.

- (51) **C07D 401/12**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2139882**
C07D 401/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/4709⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/506⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 08742273.9 (22) 24.03.2008
(43) 06.01.2010
(45) 25.12.2013
(31) 919571 P (32) 23.03.2007 (33) US
(86) PCT/US2008/003936 24.03.2008
(87) WO2008/118455 02.10.2008
(73) Amgen Inc., One Amgen Center Drive, Thousand Oaks, CA 91320, US
(72) CHEN, Yi, US
CUSHING, Timothy D., US
HAO, Xiaolin, US
HE, Xiao, US
REICHEL, Andreas, US
RZASA, Robert M., US
SEGANISH, Jennifer, US
SHIN, Youngsook, US
ZHANG, Dawei, US
(74) Grünecker, Kinkeldey, Stockmair & Schwanhäusser Anwaltssozietät, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
(54) **3-AIZVIETOTI HINOLĪNA VAI HINOKSALĪNA ATVASINĀJUMI UN TO IZMANTOŠANA PAR FOSFATIDILINOZĪT-3-KINĀZES (PI3K) INHIBITORIEM**
3-SUBSTITUTED QUINOLINE OR QUINOXALINE DERIVATIVES AND THEIR USE AS PHOSPHATIDYL-INOSITOL 3-KINASE (PI3K) INHIBITORS
(57) 1. Savienojums ar struktūrformulu:



vai jebkurš tā farmaceitiski pieņemams sāls, kur:
X¹ ir C(R⁹) vai N;
X² ir C(R¹⁰) vai N;
Y ir N(R¹¹), O vai S;
n ir 0, 1, 2 vai 3;
R¹ ir tieši saistīts vai ar skābekli saistīts piesātināts, daļēji piesātināts vai nepiesātināts 5-, 6- vai 7-locekļu monocikliskais gredzens, kas satur 0, 1, 2, 3 vai 4 atomus, izvēlēts no N, O un S, bet nesatur vairāk par vienu O vai S, turklāt pieejamie gredzena oglekļa atomi ir aizvietoti ar 0, 1 vai 2 oksogrupām vai tioksogrupām, turklāt gredzens ir aizvietots ar 0 vai 1 aizvietotāju R² un gredzens ir papildus aizvietots ar 0, 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, kas ir neatkarīgi izvēlēti no halogēna atoma, nitrogrupas, ciāngrupas, C₁₋₄ alkilgrupas, OC₁₋₄ alkilgrupas, OC₁₋₄ halogēnalkilgrupas, NHC₁₋₄ alkilgrupas, N(C₁₋₄ alkil)C₁₋₄ alkilgrupas un C₁₋₄ halogēnalkilgrupas;

R² ir izvēlēts no halogēna atoma, C₁₋₄ halogēnalkilgrupas, ciāngrupas, nitrogrupas, -C(=O)R^a, -C(=O)OR^a, -C(=O)NR^aR^a, -C(=NR^a)NR^aR^a, -OR^a, -OC(=O)R^a, -OC(=O)NR^aR^a, -OC(=O)N(R^a)S(=O)₂R^a, -C₂₋₆ alkilNR^aR^a, -OC₂₋₆ alkilOR^a, -SR^a, -S(=O)R^a, -S(=O)₂R^a, -S(=O)₂NR^aR^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)R^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)OR^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)NR^aR^a, -NR^aR^a, -N(R^a)C(=O)R^a, -N(R^a)C(=O)OR^a, -N(R^a)C(=O)NR^aR^a, -N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a, -N(R^a)S(=O)₂R^a, -N(R^a)S(=O)₂NR^aR^a, -NR^aC₂₋₆ alkilNR^aR^a un -NR^aC₂₋₆ alkilOR^a; vai R² ir izvēlēts no C₁₋₆ alkilgrupas, fenilgrupas, benzilgrupas, heteroarilgrupas, heterocikla, -(C₁₋₃ alkil)heteroarilgrupas, -(C₁₋₃ alkil)heterocikla, -O(C₁₋₃ alkil)heteroarilgrupas, -O(C₁₋₃ alkil)heterocikla, -NR^a(C₁₋₃ alkil)heteroarilgrupas, -NR^a(C₁₋₃ alkil)heterocikla, -(C₁₋₃ alkil)fenilgrupas, -O(C₁₋₃ alkil)fenilgrupas un -NR^a(C₁₋₃ alkil)fenilgrupas, kuras(-i) visas(-i) ir aizvietotas(-i) ar 0, 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, kas izvēlēti no C₁₋₄ halogēnalkilgrupas, OC₁₋₄ alkilgrupas, Br, Cl, F, I un C₁₋₄ alkilgrupas;
R³ ir izvēlēts no H, halogēna atoma, C₁₋₄ halogēnalkilgrupas, ciāngrupas, nitrogrupas, -C(=O)R^a, -C(=O)OR^a, -C(=O)NR^aR^a, -C(=NR^a)NR^aR^a, -OR^a, -OC(=O)R^a, -OC(=O)NR^aR^a, -OC(=O)N(R^a)S(=O)₂R^a, -OC₂₋₆ alkilNR^aR^a, -OC₂₋₆ alkilOR^a, -SR^a, -S(=O)R^a, -S(=O)₂R^a, -S(=O)₂NR^aR^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)R^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)OR^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)NR^aR^a, -NR^aR^a, -N(R^a)C(=O)R^a, -N(R^a)C(=O)OR^a, -N(R^a)C(=O)NR^aR^a, -N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a, -N(R^a)S(=O)₂R^a, -N(R^a)S(=O)₂NR^aR^a, -NR^aC₂₋₆ alkilNR^aR^a, -NR^aC₂₋₆ alkilOR^a, C₁₋₆ alkilgrupas, fenilgrupas, benzilgrupas, heteroarilgrupas un heterocikla, turklāt C₁₋₆ alkilgrupas, fenilgrupas, benzilgrupas, heteroarilgrupas un heterocikls ir papildus aizvietotas(-s) ar 0, 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, kas izvēlēti no C₁₋₆ halogēnalkilgrupas, OC₁₋₆ alkilgrupas, Br, Cl, F, I un C₁₋₆ alkilgrupas;
R⁴ katrā gadījumā neatkarīgi ir halogēna atoms, nitrogrupa, ciāngrupa, C₁₋₄ alkilgrupa, OC₁₋₄ alkilgrupa, OC₁₋₄ halogēnalkilgrupa, NHC₁₋₄ alkilgrupa, N(C₁₋₄ alkil)C₁₋₄ alkilgrupa vai C₁₋₄ halogēnalkilgrupa;
R⁵ katrā gadījumā neatkarīgi ir H, halogēna atoms, C₁₋₆ alkilgrupa, C₁₋₄ halogēnalkilgrupa vai C₁₋₆ alkilgrupa, kas aizvietota ar 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, ciāngrupas, OH, OC₁₋₄ alkilgrupas, C₁₋₄ alkilgrupas, C₁₋₃ halogēnalkilgrupas, OC₁₋₄ alkilgrupas, NH₂, NHC₁₋₄ alkilgrupas, N(C₁₋₄ alkil)C₁₋₄ alkilgrupas; vai abas R⁵ grupas kopā veido C₃₋₆ spiroalkilgrupu, kas aizvietota ar 0, 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, ciāngrupas, OH, OC₁₋₄ alkilgrupas, C₁₋₄ alkilgrupas, C₁₋₃ halogēnalkilgrupas, OC₁₋₄ alkilgrupas, NH₂, NHC₁₋₄ alkilgrupas, N(C₁₋₄ alkil)C₁₋₄ alkilgrupas;
R⁶ ir izvēlēts no H, C₁₋₆ halogēnalkilgrupas, Br, Cl, F, I, OR^a, NR^aR^a, C₁₋₆ alkilgrupas, fenilgrupas, benzilgrupas, heteroarilgrupas un heterocikla, turklāt C₁₋₆ alkilgrupa, fenilgrupa, benzilgrupa, heteroarilgrupa un heterocikls ir papildus aizvietotas(-s) ar 0, 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, kas izvēlēti no C₁₋₆ halogēnalkilgrupas, OC₁₋₆ alkilgrupas, Br, Cl, F, I un C₁₋₆ alkilgrupas;
R⁷ ir izvēlēts no H, C₁₋₆ haloalkilgrupas, Br, Cl, F, I, OR^a, NR^aR^a, C₁₋₆ alkilgrupas, fenilgrupas, benzilgrupas, heteroarilgrupas un heterocikla, turklāt C₁₋₆ alkilgrupa, fenilgrupa, benzilgrupa, heteroarilgrupa un heterocikls ir papildus aizvietotas(-s) ar 0, 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, kas izvēlēti no C₁₋₆ halogēnalkilgrupas, OC₁₋₆ alkilgrupas, Br, Cl, F, I un C₁₋₆ alkilgrupas;
R⁸ ir izvēlēts no H, halogēna atoma, C₁₋₄ halogēnalkilgrupas, ciāngrupas, nitrogrupas, -C(=O)R^a, -C(=O)OR^a, -C(=O)NR^aR^a, -C(=NR^a)NR^aR^a, -OR^a, -OC(=O)R^a, -OC(=O)NR^aR^a, -OC(=O)N(R^a)S(=O)₂R^a, -OC₂₋₆ alkilNR^aR^a, -OC₂₋₆ alkilOR^a, -SR^a, -S(=O)R^a, -S(=O)₂R^a, -S(=O)₂NR^aR^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)R^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)OR^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)NR^aR^a, -NR^aR^a, -N(R^a)C(=O)R^a, -N(R^a)C(=O)OR^a, -N(R^a)C(=O)NR^aR^a, -N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a, -N(R^a)S(=O)₂R^a, -N(R^a)S(=O)₂NR^aR^a, -NR^aC₂₋₆ alkilNR^aR^a, -NR^aC₂₋₆ alkilOR^a, C₁₋₆ alkilgrupas, fenilgrupas, benzilgrupas, heteroarilgrupas un heterocikla, turklāt C₁₋₆ alkilgrupa, fenilgrupa, benzilgrupa, heteroarilgrupa un heterocikls ir papildus aizvietotas(-s) ar 0, 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, kas izvēlēti no C₁₋₆ halogēnalkilgrupas, OC₁₋₆ alkilgrupas, Br, Cl, F, I un C₁₋₆ alkilgrupas;
R⁹ ir izvēlēts no H, halogēna atoma, C₁₋₄ halogēnalkilgrupas, ciāngrupas, nitrogrupas, -C(=O)R^a, -C(=O)OR^a, -C(=O)NR^aR^a, -C(=NR^a)NR^aR^a, -OR^a, -OC(=O)R^a, -OC(=O)NR^aR^a, -OC(=O)N(R^a)S(=O)₂R^a, -OC₂₋₆ alkilNR^aR^a, -OC₂₋₆ alkilOR^a, -SR^a, -S(=O)R^a, -S(=O)₂R^a, -S(=O)₂NR^aR^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)R^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)OR^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)NR^aR^a, -NR^aR^a, -N(R^a)C(=O)R^a, -N(R^a)C(=O)OR^a, -N(R^a)C(=O)NR^aR^a, -N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a, -N(R^a)S(=O)₂R^a, -N(R^a)S(=O)₂NR^aR^a, -NR^aC₂₋₆ alkilNR^aR^a, -NR^aC₂₋₆ alkilOR^a, C₁₋₆ alkilgrupas, fenilgrupas, benzilgrupas, heteroarilgrupas un heterocikla, turklāt C₁₋₆ alkilgrupa, fenilgrupa, benzilgrupa, heteroarilgrupa un heterocikls ir papildus aizvietotas(-s) ar 0, 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, kas izvēlēti

no halogēna atoma, C_{1,4}halogēnalkilgrupas, ciāngrupas, nitrogrupas, -C(=O)R^a, -C(=O)OR^a, -C(=O)NR^aR^a, -C(=NR^a)NR^aR^a, -OR^a, -OC(=O)R^a, -OC(=O)NR^aR^a, -OC(=O)N(R^a)S(=O)₂R^a, -OC_{2,6}alkilNR^aR^a, -OC_{2,6}alkilOR^a, -SR^a, -S(=O)R^a, -S(=O)₂R^a, -S(=O)₂NR^aR^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)R^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)OR^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)NR^aR^a, -NR^aR^a, -N(R^a)C(=O)R^a, -N(R^a)C(=O)OR^a, -N(R^a)C(=O)NR^aR^a, -N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a, -N(R^a)S(=O)₂R^a, -N(R^a)S(=O)₂NR^aR^a, -NR^aC_{2,6}alkilNR^aR^a, -NR^aC_{2,6}alkilOR^a; vai R⁹ ir piesātināts, daļēji piesātināts vai nepiesātināts un 5-, 6- vai 7-locekļu monociklisks gredzens, kas satur 0, 1, 2, 3 vai 4 atomus, izvēlētus no N, O un S, bet nesatur vairāk par vienu O vai S, turklāt pieejamie gredzena oglekļa atomi ir aizvietoti ar 0, 1 vai 2 oksogrupām vai tioksogrupām, turklāt gredzens ir aizvietots ar 0, 1, 2, 3 vai 4 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, C_{1,4}halogēnalkilgrupas, ciāngrupas, nitrogrupas, -C(=O)R^a, -C(=O)OR^a, -C(=O)NR^aR^a, -C(=NR^a)NR^aR^a, -OR^a, -OC(=O)R^a, -OC(=O)NR^aR^a, -OC(=O)N(R^a)S(=O)₂R^a, -OC_{2,6}alkilNR^aR^a, -OC_{2,6}alkilOR^a, -SR^a, -S(=O)R^a, -S(=O)₂R^a, -S(=O)₂NR^aR^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)R^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)OR^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)NR^aR^a, -NR^aR^a, -N(R^a)C(=O)R^a, -N(R^a)C(=O)OR^a, -N(R^a)C(=O)NR^aR^a, -N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a, -N(R^a)S(=O)₂R^a, -N(R^a)S(=O)₂NR^aR^a, -NR^aC_{2,6}alkilNR^aR^a un -NR^aC_{2,6}alkilOR^a;

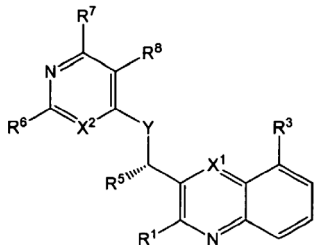
R¹⁰ ir H, C_{1,3}alkil, C_{1,3}halogēnalkilgrupa, ciāngrupa, nitrogrupa, CO₂R^a, C(=O)NR^aR^a, -C(=NR^a)NR^aR^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)R^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)OR^a, -S(=O)₂N(R^a)C(=O)NR^aR^a, S(=O)R^b, S(=O)₂R^b vai S(=O)₂NR^aR^a;

R¹¹ ir H vai C_{1,4}alkilgrupa;

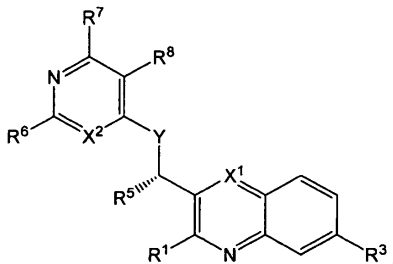
R^a katrā gadījumā neatkarīgi ir H vai R^b un

R^b katrā gadījumā neatkarīgi ir fenilgrupa, benzilgrupa vai C_{1,6}alkilgrupa, turklāt fenilgrupa, benzilgrupa un C_{1,6}alkilgrupa ir aizvietota ar 0, 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, kas izvēlēti no halogēna atoma, C_{1,4}alkilgrupas, C_{1,3}halogēnalkilgrupas, -OC_{1,4}alkilgrupas, -NH₂, -NHC_{1,4}alkilgrupas, -N(C_{1,4}alkil)C_{1,4}alkilgrupas; un turklāt „C_{α-β}alkil” nozīmē alkilgrupu, kas satur minimāli α un maksimāli β oglekļa atomus sazarotā, cikliskā vai lineārā saistībā vai jebkurā šo trīs saistību kombinācijā, turklāt α un β apzīmē veselus skaitļus, un turklāt alkilgrupa var arī saturēt vienu vai divas dubultsaites vai trīskāršās saites.

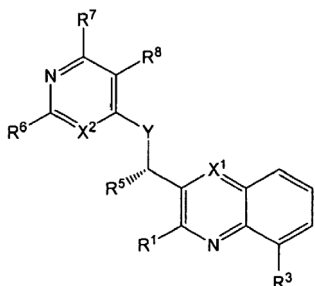
2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar struktūrformulu:



3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar struktūrformulu:



4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar struktūrformulu:



5. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur R³ ir F, Cl vai Br un n ir 0.

6. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur R¹ ir fenilgrupa, kas aizvietota ar 0 vai 1 aizvietotāju R², un fenilgrupa ir papildus aizvietota ar 0, 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, kas ir neatkarīgi izvēlēti no halogēna atoma, nitrogrupas, ciāngrupas, C_{1,4}alkilgrupas, OC_{1,4}alkilgrupas, OC_{1,4}halogēnalkilgrupas, NHC_{1,4}alkilgrupas, N(C_{1,4}alkil)C_{1,4}alkilgrupas un C_{1,4}halogēnalkilgrupas.

7. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur R¹ ir tieši saistīts vai ar skābekli saistīts piesātināts, daļēji piesātināts vai nepiesātināts 5-, 6- vai 7-locekļu monociklisks gredzens, kas satur 0, 1, 2, 3 vai 4 atomus, izvēlētus no N, O un S, bet nesatur vairāk par vienu O vai S, turklāt pieejamie gredzena oglekļa atomi ir aizvietoti ar 0, 1 vai 2 oksogrupām vai tioksogrupām, turklāt gredzens ir aizvietots ar 0 vai 1 aizvietotāju R² un gredzens ir papildus aizvietots ar 0, 1, 2 vai 3 aizvietotājiem, kas ir neatkarīgi izvēlēti no halogēna atoma, nitrogrupas, ciāngrupas, C_{1,4}alkilgrupas, OC_{1,4}alkilgrupas, OC_{1,4}halogēnalkilgrupas, NHC_{1,4}alkilgrupas, N(C_{1,4}alkil)C_{1,4}alkilgrupas un C_{1,4}halogēnalkilgrupas.

8. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai reimatoīdā artrīta, ankilozējoša spondilīta, osteoartrīta, psoriātiskā artrīta, psoriāzes, iekaisuma slimību un autoimūnu slimību, iekaisīgu zarnu saslimšanu, iekaisīgu acu saslimšanu, iekaisīgu vai nestabilu urīnpūšļa saslimšanu, ādas kaišu ar iekaisuma komponentiem, hronisku iekaisuma stāvokļu, autoimūnu slimību, sistēmiskās sarkanās vilkēdes (SLE), miastēnijas, reimatoīdā artrīta, akūta izkaisīts encefalomielīta, idiopātiskās trombocitopēniskās purpuras, multiplās sklerozes, Šegrēna sindroma un autoimūnas hemolītiskas anēmijas, alerģisku stāvokļu un hipersensitivitātes ārstēšanā.

9. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai tādu vēžu ārstēšanā, kas ir p110δ aktivitātes pastarpināti, atkarīgi no tās vai saistīti ar to.

10. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar 1. pretenziju un farmaceitiski pieņemamu atšķaidītāju vai nesēju.

(51) C07D 401/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 401/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 31/4545⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 23/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 417/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 417/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(11) 2142529

(21) 08737573.9

(22) 25.04.2008

(43) 13.01.2010

(45) 25.12.2013

(31) 926661 P

(32) 27.04.2007

(33) US

930036 P

11.05.2007

US

937003 P

21.06.2007

US

962409 P

27.07.2007

US

(86) PCT/IB2008/001069

25.04.2008

(87) WO2008/132600

06.11.2008

(73) Purdue Pharma LP, One Stamford Forum, 201 Tresser Boulevard, Stamford CT 06901, US
Shionogi & Co., Ltd., 1-8 Doshomachi 3 chome, Chuo-ku, Osaka, Osaka 541-0045, JP

(72) TAFESSE, Laykea, US

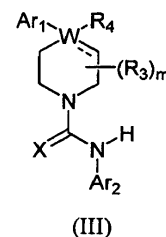
KUROSE, Noriyuki, JP

(74) Vos, Derk, Maiwald Patentanwalts GmbH, Elisenhof, Elisenstraße 3, 80335 München, DE
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV

(54) TRPV1 ANTAGONISTI UN TO IZMANTOŠANA

TRPV1 ANTAGONISTS AND USES THEREOF

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



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur
X ir O, S, N-CN, N-OH vai N-OR₁₀;
W ir N vai C;

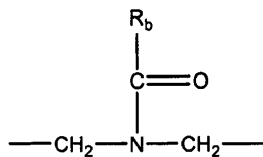
raustītā līnija nozīmē saites esamību vai neesamību un, kad raustītā līnija nozīmē saites esamību vai W ir N, tad R₄ nav, citādi R₃ ir -H, -OH, -OCF₃, -halogēna atoms, -(C₁-C₆)alkilgrupa, -CH₂OH, -CH₂Cl, -CH₂Br, -CH₂I, -CH₂F, -CH(halogēna atoms)₂, -CF₃, -OR₁₀, -SR₁₀, -COOH, -COOR₁₀, -C(O)R₁₀, -C(O)H, -OC(O)R₁₀, -OC(O)NHR₁₀, -NHC(O)R₁₃, -CON(R₁₃)₂, -S(O)₂R₁₀ vai -NO₂;

R₁₀ ir -(C₁-C₄)alkilgrupa;

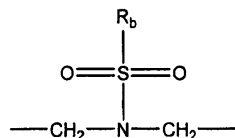
katrs R₁₃ neatkarīgi ir -H, -(C₁-C₄)alkilgrupa, -(C₁-C₄)alkenilgrupa, -(C₁-C₄)alkinilgrupa vai -fenilgrupa;

katrs R₃ neatkarīgi ir:

- H vai (C₁-C₆)alkilgrupa, vai
- divas R₃ grupas kopā veido (C₂-C₆)tiltiņu, kas ir neaizvietots vai aizvietots ar 1, 2 vai 3 neatkarīgi izvēlētiem R₈ grupām, un turklāt tiltiņš (C₂-C₆)tiltiņā eventuāli satur -HC=CH-, vai
- divas R₃ grupas kopā veido -CH₂-N(R₃)-CH₂- tiltiņu,



tiltiņu vai



tiltiņu;

R_a ir izvēlēts no -H, -(C₁-C₆)alkilgrupas, -(C₃-C₈)cikloalkilgrupas, -CH₂-C(O)-R_c, -(CH₂)₂-C(O)-OR_c, -(CH₂)₂-C(O)-N(R_c)₂, -(CH₂)₂-O-R_c, -(CH₂)₂-S(O)₂-N(R_c)₂ vai -(CH₂)₂-N(R_c)S(O)₂-R_c;

R_b ir izvēlēts no:

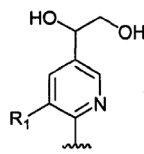
(a) -H, -(C₁-C₆)alkilgrupas, -(C₃-C₈)cikloalkilgrupas, -(3- līdz 7-locekļu)heterocikla, -N(R_c)₂, -N(R_c)-(C₃-C₈)cikloalkilgrupas vai -N(R_c)-(3- līdz 7-locekļu)heterocikla, vai

(b) -fenilgrupas, -(5- vai 6-locekļu)heteroarilgrupas, -N(R_c)-fenilgrupas vai -N(R_c)-(5- līdz 10-locekļu)heteroarilgrupas, kuras katra ir neaizvietota vai aizvietota ar 1, 2 vai 3 neatkarīgi izvēlētiem R₇ grupām;

katrs R_c neatkarīgi ir izvēlēts no -H vai -(C₁-C₄)alkilgrupas;

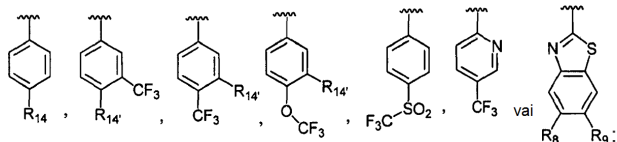
m ir vesels skaitlis 0, 1 vai 2;

turklāt Ar₁ ir:



R₁ ir -Cl, -F vai -CF₃;

turklāt Ar₂ ir:



R₁₄ ir -H, -Cl, -F, -Br, -CF₃, -OCF₃, -(C₁-C₆)alkilgrupa, -SO₂CF₃, -SO₂(C₁-C₆)alkilgrupa, -OCH₃, -OCH₂CH₃ vai -OCH(CH₃)₂, un labāk - ir -CF₃, -OCF₃, -Cl vai -F,

R_{14'} ir -H, -Cl, -F, -Br, -CH₃, -CH₂CH₃, -OCH₃, -OCH(CH₃)₂ vai -OCH₂CH₃ un

R₈ un R₉ katrs neatkarīgi ir -H, -Cl, -Br, -F, -CH₃, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -CF₃, -OCF₃, izopropilgrupa vai *tert*-butilgrupa.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā X = O.

3. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā R₄ ir halogēna atoms, labāk F.

4. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā R₁ ir halogēna atoms, labāk Cl vai F, vai CF₃.

5. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kurā W ir C un raustītā līnija nav.

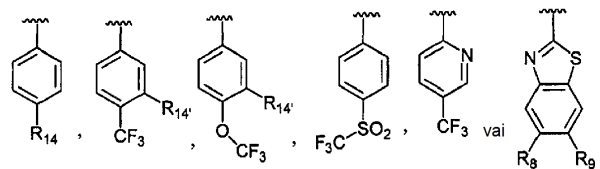
6. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kurā W ir C un raustītā līnija ir dubultsaite.

7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kurā W ir N, R₄ nav un raustītā līnija nav.

8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā m ir 0.

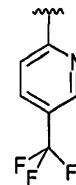
9. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kurā m = 1 un labāk - R₃ ir (C₁-C₆)alkilgrupa, un vēl labāk - ir -CH₃ vai -CH₂CH₃.

10. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kurā Ar₂ ir izvēlēts no



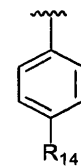
11. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kurā Ar₂ ir

a)



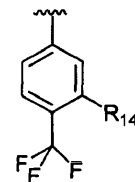
vai

b)



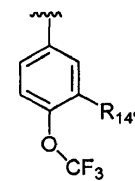
kurā R₁₄ ir izvēlēts no -H, -Cl, -F, -Br, -CF₃, -OCF₃, -(C₁-C₆)alkilgrupas, -SO₂CF₃, -SO₂(C₁-C₆)alkilgrupas, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -OCH(CH₃)₂, un labāk - ir -CF₃, -OCF₃, -Cl vai -F, vai

c)



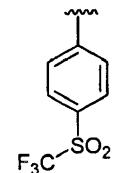
kurā R_{14'} ir izvēlēts no -H, -Cl, -F, -Br, -OCF₃, -CH₃, -CH₂CH₃, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -OCH(CH₃)₂, un labāk - ir -OCF₃, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -Cl vai -F, vai

d)

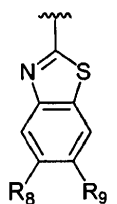


kurā R_{14'} ir izvēlēts no -H, -Cl, -F, -Br, -OCF₃, -CH₃, -CH₂CH₃, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -OCH(CH₃)₂, un labāk - ir -OCF₃, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -Cl vai -F, vai

e)

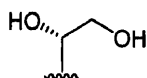


vai
f)



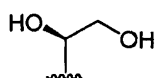
kurā R₈ un R₉ katrs neatkarīgi ir -H, -Cl, -Br, -F, -CH₃, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -CF₃, -OCF₃, izopropilgrupa vai *tert*-butilgrupa.

12. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, kurā Q-grupas hirālais oglekļa atoms ir (S)-konfigurācijā:

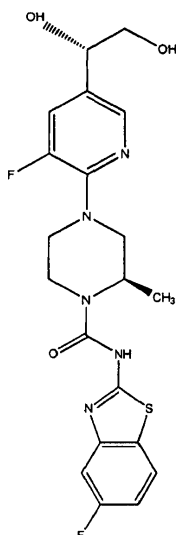


vai

kurā Q-grupas hirālais oglekļa atoms ir (R)-konfigurācijā:

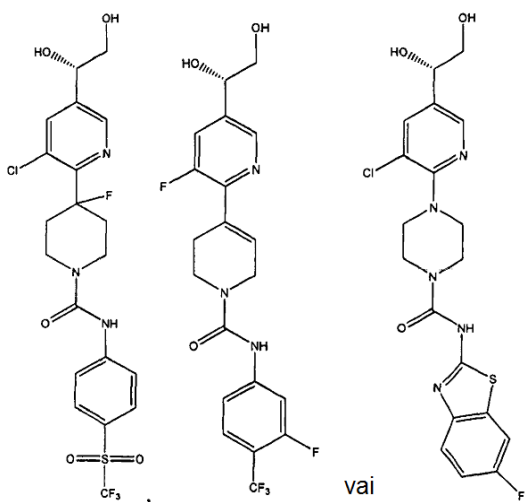
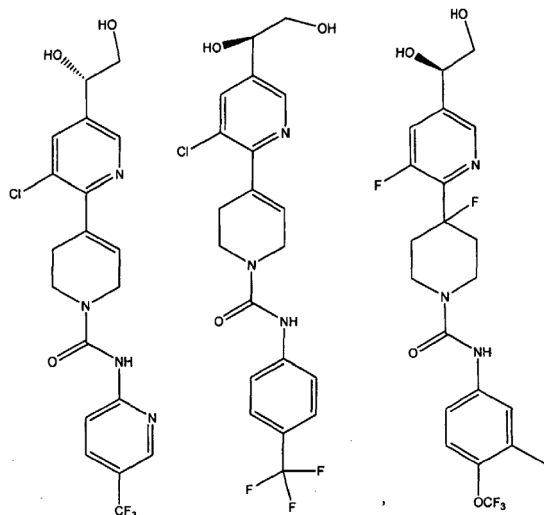


13. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

14. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

15. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt farmaceutiski pieņemamais sāls ir fumarāta sāls.

16. Kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli un farmaceutiski pieņemamu nesēju vai palīgvielu.

17. *In vitro* metode TRPV1 funkcijas inhibēšanai šūnā, kas ietver TRPV1 ekspresēt spējīgas šūnas pakļaušanu kontaktam ar savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemama sāls efektīvu daudzumu.

18. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemama sāls izmantošana medikamenta ražošanā sāpju, urīna nesaturēšanas (UI), čūlas, iekaisīgas zarnu slimības (IZS) vai kairinātas zarnas sindroma (KZS) ārstēšanai vai profilaksei dzīvniekam.

19. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai izmantošanai par medikamentu.

20. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai izmantošanai sāpju, urīna nesaturēšanas (UI), čūlas, iekaisīgas zarnu slimības (IZS) vai kairinātas zarnas sindroma (KZS) ārstēšanai vai profilaksē dzīvniekam.

(51) C07D 211/94⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(11) 2146961

A61K 31/451⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 25/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 25/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 25/18⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 25/22⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 25/24⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 25/28⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 25/30⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(21) 08741904.0

(22) 11.04.2008

(43) 27.01.2010

(45) 29.01.2014

(31) 0700893

(32) 12.04.2007 (33) SE

(86) PCT/SE2008/050414

11.04.2008

(87) WO2008/127188

23.10.2008

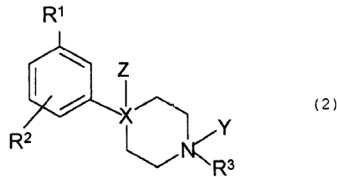
(73) IVAX International GmbH, Alpenstrasse 2, 8640 Rapperswil, CH

(72) WIKSTRÖM, Håkan, V., SE

(74) Grünecker, Kinkeldey, Stockmair & Schwanhäusser Anwaltssozietät, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE
Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra INTELS, a/k 30, Rīga, LV-1083, LV

(54) **DOPAMĪNA RECEPTORU STABILIZATORU/MODULATORU N-OKSĪDA UN/VAI DI-N-OKSĪDA ATVASINĀJUMI, KAS UZRĀDA UZLABOTU SIRDIS UN ASINSVADU BLAKUSPARĀDĪBU PROFILU**
N-OXIDE AND/OR DI-N-OXIDE DERIVATIVES OF DOPAMINE RECEPTOR STABILIZERS/MODULATORS DISPLAYING IMPROVED CARDIOVASCULAR SIDE-EFFECTS PROFILES

(57) 1. Savienojums ar formulu (2)



vai farmaceitiski pieņemams sāls, kurā

R¹ ir SO₂CH₃;

R² ir CH₃, F vai Cl;

R³ ir n-propilgrupa vai etilgrupa;

X ir C;

Y ir O; un

Z ir H;

vai 4-(3-metānsulfonilfenil)-1-propilpiperidīna-1 oksīds vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir 4-(3-metānsulfonilfenil)-1-propilpiperidīna-1 oksīds vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.

3. Farmaceutiska kompozīcija, kas sastāv no savienojuma saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, vai tā farmaceitiski pieņemams sāls un farmaceitiski pieņemams nesējs vai atšķaidītājs.

4. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju stāvokļa, kas izvēlēts no grupas, kurā ietilpst kustību traucējumi, tiks, trīce, Tureta sindroms, stostīšanās un citi runas traucējumi, ārstēšanai.

5. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 4. pretenziju, kurā minētie kustību traucējumi ir izvēlēti no jātrogēna un nejatrogēna parkinsonisma, diskinēzijas un distonijas.

6. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju stāvokļa, kas izvēlēts no grupas, kurā ietilpst jātrogēnas un nejatrogēnas psihozes un halucinācijas, ārstēšanai.

7. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 6. pretenziju, kurā minētās jātrogēnās un nejatrogēnās psihozes un halucinācijas ir izvēlētas no šizofrēnijas un šizofrēnijas formas traucējumiem.

8. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju stāvokļa, kas izvēlēts no grupas, kurā ietilpst garastāvokļa traucējumi un trauksme, depresija un obsesīvi kompulsīvā slimība, ārstēšanai.

9. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju stāvokļa, kas izvēlēts no grupas, kurā ietilpst uzmanības deficīta traucējumi, autisma traucējumi, bradikinēzija, bradifrēnija un kognitīvie traucējumi, ārstēšanai.

10. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju stāvokļa, kas izvēlēts no grupas, kurā ietilpst miega traucējumi, seksuālie traucējumi, ēšanas traucējumi, aptaukošanās, galvassāpes un sāpes, ārstēšanai.

11. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju kustību funkciju vai kognitīvo funkciju uzlabošanai saistībā ar neurodeģeratīvajiem un attīstības traucējumiem vai kustību funkciju vai kognitīvo funkciju uzlabošanai pēc smadzeņu traumas, ko izraisījuši traumatiski, toksiski, iekaisuma, infekcijas, neoplastiski, asinsvadu, hipoksiski vai metaboliski iemesli.

12. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju vai tā farmaceitiski pieņemams sāls medicīniskai izmantošanai.

13. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju vai tā farmaceitiski pieņemams sāls farmaceitiskas kompozīcijas izgatavošanai.

- (51) **A61P 1/16**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2153870**
A61K 31/192⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/198⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 09013613.6 (22) 28.11.2005
(43) 17.02.2010
(45) 25.12.2013
(31) 0426141 (32) 26.11.2004 (33) GB
0426142 26.11.2004 GB
(62) EP05808837.8 / EP1824563
(73) UCL Business PLC, The Network Building, 97 Tottenham Court Road, London W1T 4TP, GB
(72) JALAN, Rajiv, GB
JALAN, Kamal, Nayan, IN

(74) Ford, Hazel, 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, KAS SATUR ORNITĪNU UN FENILACETĀTU VAI FENILBUTIRĀTU, HEPĀTISKAS ENCEFALOPĀTIJAS ĀRSTĒŠANAI**
COMPOSITIONS COMPRISING ORNITHINE AND PHENYLACETATE OR PHENYLBUTYRATE FOR TREATING HEPATIC ENCEPHALOPATHY

(57) 1. Farmaceutiska kompozīcija ievadīšanai cilvēkam, kas satur ornitīnu un vismaz vienu no fenilacetāta un fenilbutirāta masu attiecībā no 2:1 līdz 1:2.

2. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur izoleicīnu.

3. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 2. pretenziju, kurā minētais izoleicīns ir klātesošs kā brīva monomēru aminoskābe vai fizioloģiski pieņemams sāls.

4. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas būtībā nesatur citu aminoskābi.

5. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas būtībā nesatur aspartātu vai vispār nesatur aspartātu.

6. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā minētais ornitīns ir klātesošs kā brīva monomēru aminoskābe vai fizioloģiski pieņemams sāls.

7. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā minētais ornitīns ir L-ornitīns.

8. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā vismaz viens no fenilacetāta un fenilbutirāta ir klātesošs kā nātrija fenilacetāts vai nātrija fenilbutirāts.

9. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas ir formulēta intravenozai vai perorālai ievadīšanai.

10. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kas ir formulēta intraperitoneālai, intragastrālai vai intravaskulārai ievadīšanai.

11. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā vismaz viens no fenilacetāta un fenilbutirāta ir fenilacetāts.

12. Farmaceutiska kompozīcija ievadīšanai cilvēkam, kura sastāv no ornitīna un vismaz viena no fenilacetāta un fenilbutirāta masu attiecībā no 2:1 līdz 1:2.

13. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur no 1 līdz 50 g ornitīna un no 1 līdz 50 g fenilacetāta vai fenilbutirāta.

14. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur no 5 līdz 30 g ornitīna un no 5 līdz 30 g fenilacetāta vai fenilbutirāta.

- (51) **A61K 31/74**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2182960**
A61Q 19/08⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 08794808.9 (22) 28.07.2008
(43) 12.05.2010
(45) 19.03.2014
(31) 952298 P (32) 27.07.2007 (33) US
(86) PCT/US2008/009117 28.07.2008
(87) WO2009/017705 05.02.2009
(73) Galderma Laboratories Inc., 14501 North Freeway, Fort Worth, Texas 76177, US
(72) DEJOVIN, Jack, US
(74) Hatzmann, Martin, et al, V.O. Johan de Wittlaan 7, 2517 JR Den Haag, NL
Svetlana MAKEJEVA, Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV
- (54) **SAVĪENOJUMI, ZĀĻU FORMAS UN METODES ĀDAS GRUMBU, RIEVU UN NOKARĀŠANĀS MAZINĀŠANAI**
REDUCING SKIN WRINKLES, CREAMING AND SAGGING
- (57) 1. Kompozīcija, kas satur vismaz vienu aktīvu sastāvdaļu, kas atlasīta no α₂ adrenerģisku receptoru agonista, tā farmaceitiski pieņemama sāls un to kombinācijas, izmantošanai

ādas nokarāšanās, rievu un/vai grumbu veidošanās terapeitiskajā mazināšanā, kur α_2 adrenerģisko receptoru agonists tiek atlasīts no grupas, kas sastāv no brimonidīna, tetrahidrozalīna, oksimetazolīna un ksilometazolīna, un kur minētā kompozīcija ir paredzēta lokālai ievadīšanai personai, kam nepieciešama ārstēšana, ādā, kas nokarājas, kļūst rievaina un/vai grumbaina, ādas nokarāšanās, rievu un/vai grumbu labošanai efektīvā daudzumā.

2. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur vismaz viens α_2 adrenerģisko receptoru agonists ir atgriezenisks α_2 adrenerģisko receptoru agonists.

3. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur kompozīcija papildus satur vismaz vienu farmaceitiski pieņemamu nesēju.

4. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kur kompozīcija ir formā, kas ir atlasīta no grupas, kas sastāv no izsmidzināma šķidrums, miglas, aerosola, losjona, želejas, krēma, balzama, putām, pastas, ziedes, emulsijas, liposomu suspensijas, koloīda un to kombinācijas.

5. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kur kompozīcija papildus satur kosmētisku līdzekli, pamatni, mitrinātāju un saules aizsardzības līdzekli.

6. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur kompozīcijas daudzums, kas izmantojams uz bojātās vietas, ir robežās no apmēram 0,1 g/cm² līdz apmēram 5 g/cm² ādas virsmas platības.

7. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur kompozīcija papildus satur vismaz vienu citu aktīvu sastāvdaļu, kas atlasīta no grupas, kas sastāv no azelaīnskābes, benzoilperoksīda, izotretinoīna, antibiotikas, ķīmiski modificētas antibiotikas, to farmaceitiski pieņemama sāļa un to kombinācijas, ādas nokarāšanās, rievu un/vai grumbu labošanai efektīvā daudzumā.

8. Kompozīcija saskaņā ar 7. pretenziju, kur antibiotika tiek atlasīta no grupas, kas sastāv no klindamicīna, doksiciklīna, eritromicīna, metronidazola, sulfacetamīda un tetraciklīna.

9. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur daudzums, kas ir efektīvs ādas nokarāšanās, rievu un/vai grumbu labošanai, ir daudzums, kas izlabo ādas nokarāšanos, rievu un/vai grumbas apmēram 5 minūšu laikā pēc ievadīšanas.

10. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur daudzums, kas ir efektīvs ādas nokarāšanās, rievu un/vai grumbu labošanai, ir daudzums, kas izlabo ādas nokarāšanos, rievu un/vai grumbas vismaz uz apmēram 8 stundām, labāk uz apmēram 12 stundām, vēl labāk uz apmēram 18 stundām un vislabāk uz apmēram 24 stundām.

11. Kompozīcijas, kas definēta jebkurā no 1. līdz 10. pretenzijai, izmantošana medikamenta pagatavošanai ādas nokarāšanās, rievu un/vai grumbu veidošanās mazināšanai.

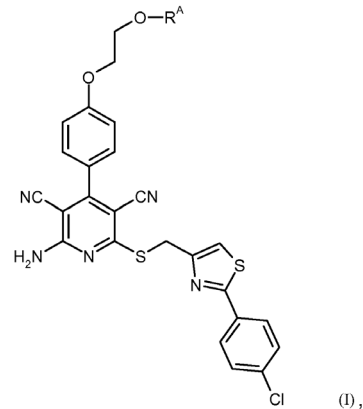
12. Kosmētiska produkta, kas satur vismaz vienu no α_2 adrenerģisko receptoru agonistiem, un/vai tā farmaceitiski pieņemama sāļa izmantošana ādas nokarāšanās, rievu un/vai grumbu veidošanās kosmētiskai mazināšanai, kur α_2 adrenerģisko receptoru agonists tiek atlasīts no grupas, kas sastāv no brimonidīna, tetrahidrozalīna, oksimetazolīna un ksilometazolīna, un kur minētā kompozīcija ir paredzēta lokālai ievadīšanai personai ādā, kas nokarājas, kļūst rievaina un/vai grumbaina.

(74) BIP Patents, c/o Bayer Intellectual Property GmbH, Creative Campus, Monheim, Alfred-Nobel-Straße 10, 40789 Monheim, DE

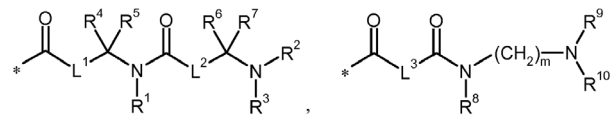
Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga, LV-1050, LV

(54) **DIPEPTĪDU PRIEKŠTEĶĻI UN TO IZMANTOŠANA DIPEPTĪDU PRODRUGS AND THE USE THEREOF**

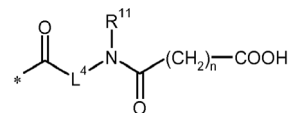
(57) 1. Savienojums ar formulu (I):



kurā R^A apzīmē grupu ar formulu:



vai



kurā

* apzīmē savienojšanās vietu ar O atomu;

L¹ un L² neatkarīgi viens no otra apzīmē saiti vai -CH₂-;

R¹, R² un R³ neatkarīgi viens no otra apzīmē ūdeņraža atomu vai metilgrupu;

R⁴ un R⁶ ir vienādi vai dažādi un apzīmē, neatkarīgi viens no otra, ūdeņraža atomu vai metilgrupu (alanīnu), propan-2-ilgrupu (valīnu), propan-1-ilgrupu (norvalīnu), 2-metilpropan-1-ilgrupu (leicīnu), 1-metilpropan-1-ilgrupu (izoleicīnu), butan-1-ilgrupu (norleicīnu), *tert*-butilgrupu (2-*tert*-butilglicīnu), fenilgrupu (2-fenilglicīnu), benzilgrupu (fenilalanīnu), *p*-hidroksibenzilgrupu (tirozīnu), indol-3-ilmetilgrupu (triptofānu), imidazol-4-ilmetil (histidīnu), hidroksimetilgrupu (serīnu), 2-hidroksietilgrupu (homoserīnu), 1-hidroksietilgrupu (treonīnu), merkaptometilgrupu (cisteīnu), metil-tiometilgrupu (S-metilcisteīnu), 2-merkaptometilgrupu (homocisteīnu), 2-metiltioetilgrupu (metionīnu), karbamoilmetilgrupu (asparagīnu), 2-karbamoiletalgrupu (glutamīnu), karboksimetilgrupu (asparagīnskābi), 2-karboksietil (glutamīnskābi), 4-aminobutan-1-ilgrupu (lizīnu), 4-amino-3-hidroksibutan-1-ilgrupu (hidroksilizīnu), 3-aminopropan-1-ilgrupu (ornitīnu), 2-aminoetilgrupu (2,4-diaminosviestskābi), aminometilgrupu (2,3-diaminopropionskābi), 3-guanidinopropan-1-ilgrupu (arginīnu), 3-ureidopropan-1-ilgrupu (citrulīnu);

R⁵ un R⁷ apzīmē, neatkarīgi viens no otra, ūdeņraža atomu vai metilgrupu;

L³ apzīmē C₂₋₆alkāndiilgrupu ar taisnu vai sazarotu ķēdi, kas papildus ir aizvīvēta ar aminogrupu;

R⁸, R⁹ un R¹⁰ apzīmē, neatkarīgi viens no otra, ūdeņraža atomu vai metilgrupu;

m apzīmē skaitli 2, 3, 4, 5 vai 6;

L⁴ apzīmē C₂₋₆alkāndiilgrupu ar taisnu vai sazarotu ķēdi, kas papildus ir aizvīvēta ar karboksilgrupu;

R¹¹ apzīmē ūdeņraža atomu vai metilgrupu;

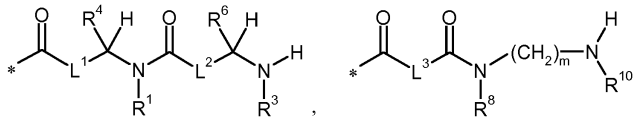
un

n apzīmē skaitli 1, 2, 3 vai 4;

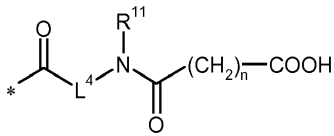
kā arī tā sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

2. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R^A apzīmē grupu ar formulu:

(51) C07D 417/12 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾	(11) 2185552		
A61K 31/4439 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾			
A61P 9/00 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾			
(21) 08784986.5	(22) 23.07.2008		
(43) 19.05.2010			
(45) 12.03.2014			
(31) 102007036076	(32) 01.08.2007	(33)	DE
(86) PCT/EP2008/006027	23.07.2008		
(87) WO2009/015811	05.02.2009		
(73) Bayer Intellectual Property GmbH, Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim, DE			
(72) LERCHEN, Hans-Georg, DE			
KRENZ, Ursula, DE			
KELDENICH, Jörg, DE			
DIEDRICHS, Nicole, DE			
KRAHN, Thomas, DE			
HIRTH-DIETRICH, Claudia, DE			
ALBRECHT-KÜPPER, Barbara, DE			



vai



kurā

* apzīmē savienošanas vietu ar O atomu;

L¹ un L² katrs apzīmē saiti;

L² apzīmē saiti vai -CH₂-;

R¹ un R³ neatkarīgi viens no otra apzīmē ūdeņraža atomu vai metilgrupu;

R⁴ apzīmē ūdeņraža atomu, metilgrupu, propan-2-ilgrupu, propan-1-ilgrupu 2-metilpropan-1-ilgrupu, 1-metilpropan-1-ilgrupu, butan-1-ilgrupu, benzilgrupu, *p*-hidroksibenzilgrupu, imidazol-4-il-metil, hidroksimetilgrupu, 1-hidroksietilgrupu, karbamoilmetilgrupu vai 2-karbamoiletilgrupu;

R⁶ apzīmē ūdeņraža atomu, imidazol-4-ilmetilgrupu, 4-aminobutan-1-ilgrupu, 3-aminopropan-1-ilgrupu, 2-aminoetilgrupu, aminometilgrupu vai 3-guanidinopropan-1-ilgrupu;

L³ apzīmē C₂₋₄alkāndiilgrupu ar taisnu ķēdi, kas papildus ir aizvietota ar aminogrupu;

R⁸ un R¹⁰ apzīmē neatkarīgi viens no otra ūdeņraža atomu vai metilgrupu;

m apzīmē skaitli 2, 3 vai 4;

L⁴ apzīmē C₂₋₄alkāndiilgrupu ar taisnu ķēdi, kas papildus ir aizvietota ar karboksilgrupu;

R¹¹ apzīmē ūdeņraža atomu vai metilgrupu;

un

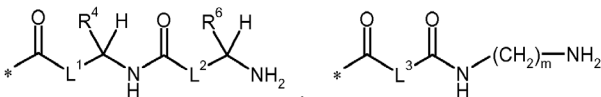
n apzīmē skaitli 2, 3 vai 4;

kā arī tā sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

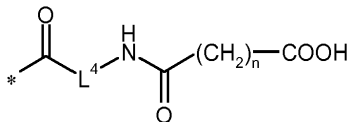
3. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju,

kurā:

R^A apzīmē grupu ar formulu:



vai



kurā

* apzīmē savienošanas vietu ar O atomu;

L¹ un L² katrs apzīmē saiti;

R⁴ apzīmē ūdeņraža atomu, metilgrupu, propan-2-ilgrupu, propan-1-ilgrupu 2-metilpropan-1-ilgrupu, 1-metilpropan-1-ilgrupu, butan-1-ilgrupu, benzilgrupu, *p*-hidroksibenzilgrupu, imidazol-4-ilmetilgrupu, hidroksimetilgrupu, 1-hidroksietilgrupu, karbamoilmetilgrupu vai 2-karbamoiletilgrupu;

R⁶ apzīmē imidazol-4-ilmetilgrupu, 4-aminobutan-1-ilgrupu, 3-aminopropan-1-ilgrupu, 2-aminoetilgrupu, aminometilgrupu vai 3-guanidinopropan-1-ilgrupu;

L³ apzīmē grupu ar formulu -CH(NH₂)-CH₂-, -CH₂-CH(NH₂)-, -CH₂-CH(NH₂)-CH₂-, -CH(NH₂)-CH₂-CH₂- vai -CH₂-CH₂-CH(NH₂)-, m apzīmē skaitli 2, 3 vai 4;

L⁴ apzīmē grupu ar formulu *-CH₂-CH(COOH)- vai *-CH₂-CH₂-CH(COOH)-, kurā

** apzīmē savienošanās vietu ar blakus esošu karbonilgrupu

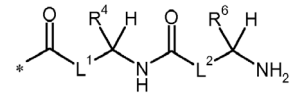
un

n apzīmē skaitli 2 vai 3;

kā arī tā sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

4. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju, kurā:

R^A apzīmē grupu ar formulu:



kurā

* apzīmē savienošanas vietu ar O atomu;

L¹ un L² katrs apzīmē saiti;

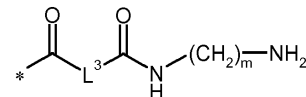
R⁴ apzīmē ūdeņraža atomu, metilgrupu, propan-2-ilgrupu, 2-metilpropan-1-ilgrupu, benzilgrupu, hidroksimetilgrupu vai 1-hidroksietilgrupu; un

R⁶ apzīmē imidazol-4-ilmetilgrupu, 4-aminobutan-1-ilgrupu, 3-aminopropan-1-ilgrupu, 2-aminoetilgrupu, aminometilgrupu vai 3-guanidinopropan-1-ilgrupu;

kā arī tā sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

5. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju, kurā:

R^A apzīmē grupu ar formulu:



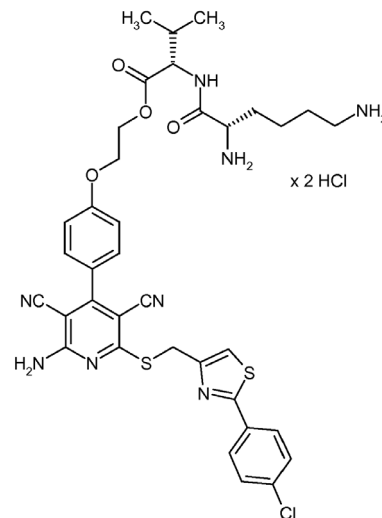
kurā

* apzīmē savienošanās vietu ar O atomu;

L³ apzīmē grupu ar formulu -CH(NH₂)-CH₂-, -CH₂-CH(NH₂)-, -CH(NH₂)-CH₂-CH₂- vai -CH₂-CH₂-CH(NH₂)-; un m apzīmē 2 vai 3;

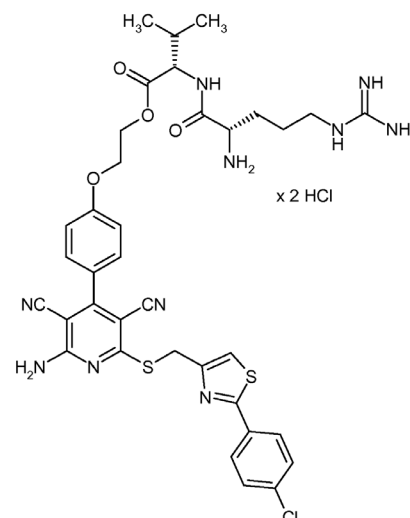
kā arī tā sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

6. Savienojums saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju ar formulu:



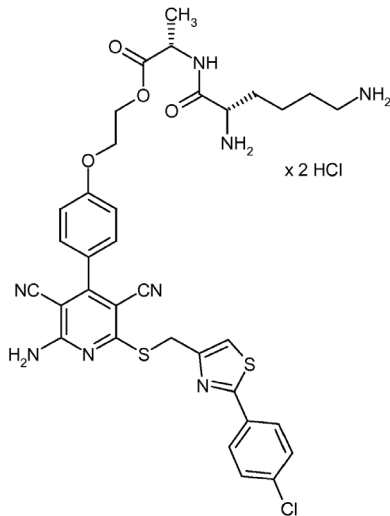
2-{4-[2-amino-6-({[2-(4-ħlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}tio)-3,5-diciānpiridin-4-il]fenoksietil-L-lizil-L-valināta dihidroħlorīds.

7. Savienojums saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju ar formulu:



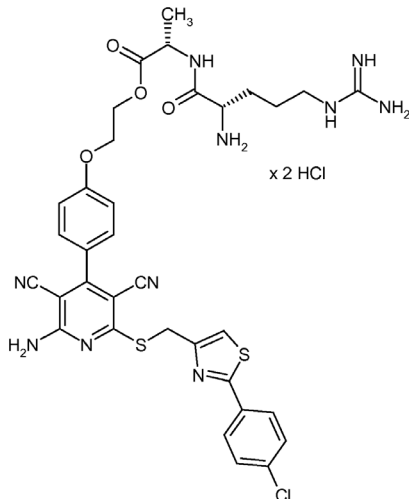
2-{4-[2-amino-6-({[2-(4-hlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}tio)-3,5-diciānpiridin-4-il]fenoksi}etil-L-arginil-L-valināta dihidrohlorīds.

8. Savienojums saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju ar formulu:



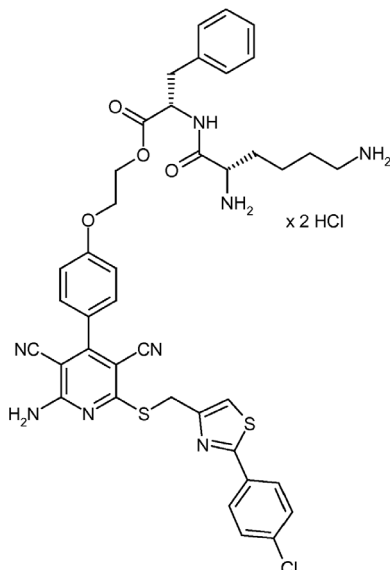
2-{4-[2-amino-6-({[2-(4-hlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}tio)-3,5-diciānpiridin-4-il]fenoksi}etil-L-lizil-L-alanināta dihidrohlorīds.

9. Savienojums saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju ar formulu:



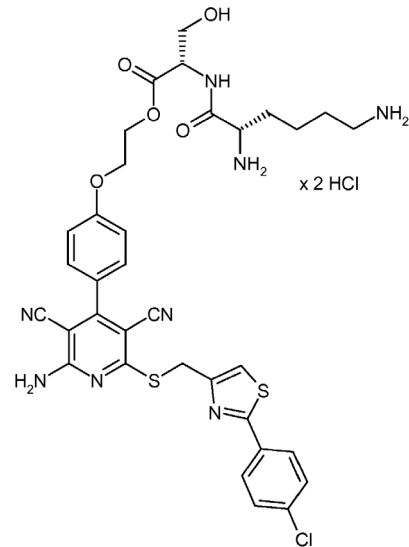
2-{4-[2-amino-6-({[2-(4-hlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-diciānpiridin-4-il]fenoksi}etil-L-arginil-L-alanināta dihidrohlorīds.

10. Savienojums saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju ar formulu:



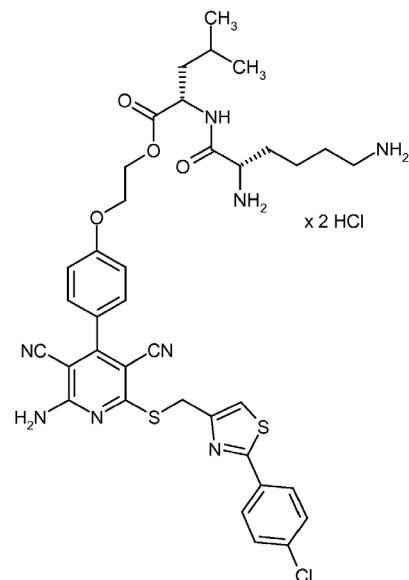
2-{4-[2-amino-6-({[2-(4-hlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-diciānpiridin-4-il]fenoksi}etil-L-lizil-L-fenilalanināta dihidrohlorīds.

11. Savienojums saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju ar formulu:



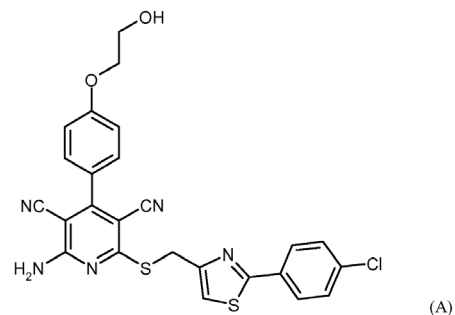
2-{4-[2-amino-6-({[2-(4-hlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}tio)-3,5-diciānpiridin-4-il]fenoksi}etil-L-lizil-L-serināta dihidrohlorīds.

12. Savienojums saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju ar formulu:



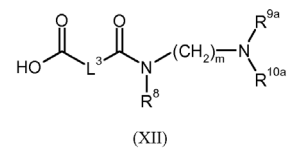
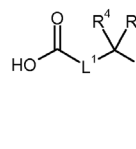
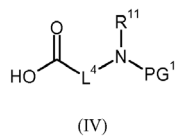
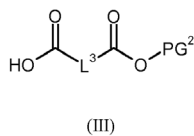
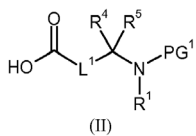
2-{4-[2-amino-6-({[2-(4-hlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-diciānpiridin-4-il]fenoksi}etil-L-lizil-L-leicināta dihidrohlorīds.

13. Paņēmiens savienojumu ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 12. pretenzijai, iegūšanai, kas raksturīgs ar to, ka savienojums (A):

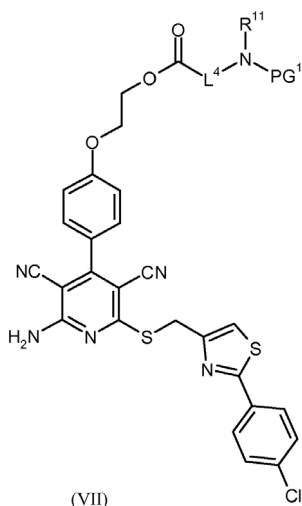
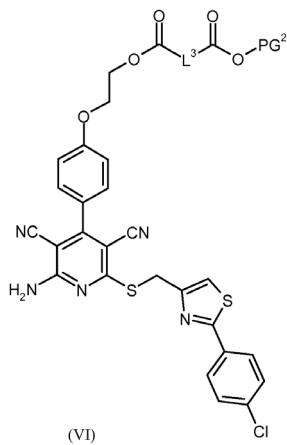
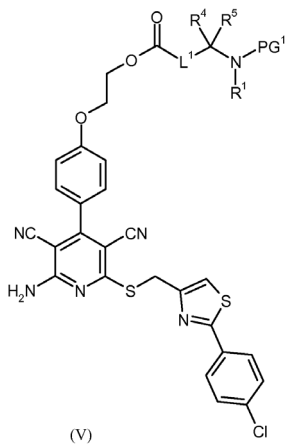
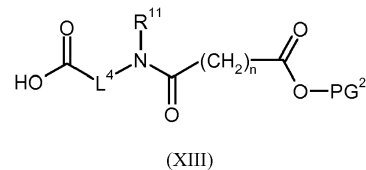


vai nu

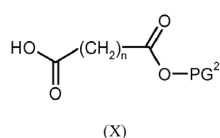
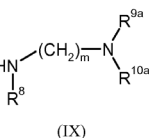
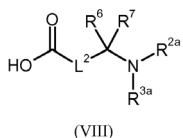
[A] tiek esterificēts inertā šķīdinātājā kondensējoša līdzekļa klātbūtnē vispirms ar kabonskābi ar formulu (II), (III) vai (IV):



kurās L¹, L³, L⁴, R¹, R⁴, R⁵ un R¹¹ attiecīgas nozīmes ir minētas jebkurā no 1. līdz 5. pretenzijai; un PG¹ apzīmē pārejošu amino aizsarggrupu, kā, piemēram, *tert*-butoksikarbonilgrupu; un PG² apzīmē pārejošu karboksilgrupas aizsarggrupu, kā, piemēram, *tert*-butilgrupu, lai iegūtu savienojumus ar formulu (V), (VI) vai (VII):



kurās L¹, L³, L⁴, R¹, R⁴, R⁵, R¹¹, PG¹ un PG² attiecīgas nozīmes ir iepriekš minētas, pēc tam, pēc aizsarggrupas PG¹ vai PG² atšķelšanas, savienojums tiek saistīts inerti šķīdinātājā kondensējoša līdzekļa klātbūtnē, savienojuma (V) gadījumā ar savienojumu ar formulu (VIII), savienojuma (VI) gadījumā – ar savienojumu ar formulu (IX) un savienojuma (VII) gadījumā – ar savienojumu ar formulu (X):



kurās L², R⁶, R⁷, R⁸, PG², m un n attiecīgas nozīmes ir minētas jebkurā no 1. līdz 5. pretenzijai, un R^{2a} un R^{3a}, kā arī R^{9a} un R^{10a} katrā gadījumā ir vienādi vai dažādi un tiem ir jebkurā no 1. līdz 5. pretenzijai minētās R², R³, R⁹ un R¹⁰ nozīmes, vai tie apzīmē pārejošu amino aizsarggrupu, kā, piemēram, *tert*-butoksikarbonilgrupu, un pēc tam neobligāti esošas aizsarggrupas tiek atkal nošķeltas; vai [B] tiek saistīts inerti šķīdinātājā kondensējoša līdzekļa klātbūtnē ar savienojumu ar formulu (XI), (XII) vai (XIII):

kurās L¹, L², L³, L⁴, R¹, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R¹¹, m un n attiecīgas nozīmes ir minētas jebkurā no 1. līdz 5. pretenzijai, R^{2a} un R^{3a}, kā arī R^{9a} un R^{10a}, katrā gadījumā ir vienādi vai dažādi un tiem ir jebkurā no 1. līdz 5. pretenzijai minētās R², R³, R⁹ un R¹⁰ nozīmes, vai tie apzīmē pārejošu amino aizsarggrupu, kā, piemēram, *tert*-butoksikarbonilgrupu, un PG² apzīmē pārejošu karboksilu aizsarggrupu, kā, piemēram, *tert*-butilgrupu, un pēc tam neobligāti esošas aizsarggrupas tiek atkal nošķeltas un iegūtie savienojumi ar formulu (I) neobligāti tiek pārvērsti ar piemērotiem (i) šķīdinātājiem un/vai (ii) skābēm vai bāzēm to solvātos, šajos un/vai sāļu solvātos.

14. Savienojums, kā definēts jebkurā no 1. līdz 12. pretenzijai, slimību ārstēšanai un/vai profilaksei.

15. Savienojuma, kā definēts jebkurā no 1. līdz 12. pretenzijai, izmantošana medikamenta ražošanā, kas paredzēts sirds un asinsvadu saslimšanu ārstēšanai un/vai profilaksei.

16. Medikaments, kas satur savienojumu, kā definēts jebkurā no 1. līdz 12. pretenzijai, neobligāti kombinācijā ar vienu vai vairākām inertām, netoksiskām, farmaceutiski pieņemamām palīgvielām.

17. Medikaments, kas satur savienojumu, kā definēts jebkurā no 1. līdz 12. pretenzijai, kombinācijā ar vienu vai vairākām papildu aktīvām vielām.

18. Medikaments saskaņā ar 16. vai 17. pretenziju sirds un asinsvadu saslimšanu ārstēšanai un/vai profilaksei.

- | | | |
|---|---------------------|---------|
| (51) A63F 5/04 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | (11) 2190540 | |
| (21) 08779506.8 | (22) 15.07.2008 | |
| (43) 02.06.2010 | | |
| (45) 15.01.2014 | | |
| (31) 200700194 | (32) 08.08.2007 | (33) SI |
| 200800134 | 26.05.2008 | SI |
| (86) PCT/SI2008/000041 | 15.07.2008 | |
| (87) WO2009/020437 | 12.02.2009 | |
| (73) Novomatic AG, Wiener Strasse 158, 2352 Gumpoldskirchen, AT | | |
| (72) HERCOG, Ivan, SI | | |
| DOMINICO, Gino, SI | | |
| (74) Pipan, Marjan, Kotnikova 5, 1000 Ljubljana, SI | | |
| Svetlana MAKEJEVA, Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV | | |
| (54) RULETES BUMBIŅAS PALAIŠANAS MEHĀNISMS | | |
| MECHANISM FOR LAUNCHING THE ROULETTE BALL | | |

(57) 1. Mehānisms (1) ruletes bumbiņas (11) palaišanai, kas ir ierīkots ruletes rata (2) korpusa (3) perifērijā, ar ierīci (17) bumbiņas (11) automātiskai atgriešanai no spraugas (18) kanālā (10), kas beidzas palaišanas mehānismā (1), kurš satur korpusu (5), kura iekšienē ir ievietots pirmais aksiāli pārvietojamais virzulis (6) kopā ar pirmo atsperi (7), pie tam pirmais aksiāli pārvietojamais virzulis (6) pirmās atsperes (6) pusē sniedzas ārpus korpusa (5) ar rokturi (8),

kas raksturīgs ar to, ka otrais mazākais aksiāli pārvietojamais virzulis (13) ir ievietots pirmajā virzulī (6), un ar to, ka otrais virzulis (13) ir ievietots kopā ar otro atsperi (15) un dzelksni (14) kanālā (10) virzienā bumbiņas (11) novadīšanai uz ruletes ratu (2).

2. Mehānisms (1) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tas ir ievietojams gar ruletes rata (2) korpusa (3) perifēriju

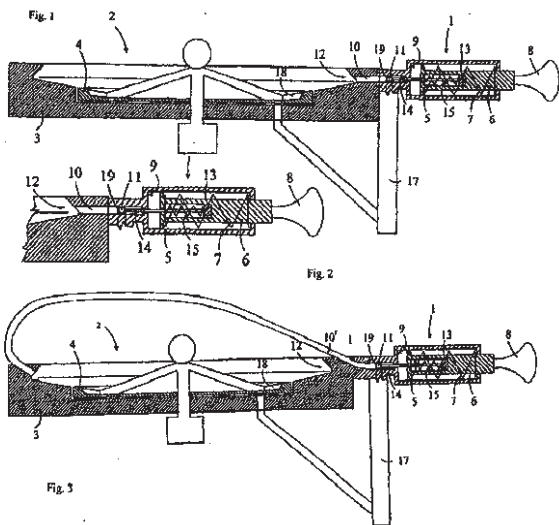
tā, lai virzuļu (6) un (13) un dzelkšņa (14) asis būtu novietotas koaksiāli palaišanas kanālam (10) korpusa (3) iekšienē.

3. Mehānisms (1) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tas ir ievietojams gar ruletes (2) korpusa (3) perifēriju tā, lai ierīces (17) vadotnē (19) bumbiņa (11) būtu novietota tieši dzelkšņa (14) priekšā tikai ar daļēji saspringtu virzuli (6).

4. Mehānisms (1) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tas ir savienots ar ruletes ratu (2) ar garāku izsviešanas kanālu (10), kas var tikt izvietots ārpus korpusa (3), un izsviešanas kanāls (10) ir novirzīts tā, lai tas paceltos mehānisma (1) priekšā un tad nolaiestos atpakaļ ruletes rata (2) virzienā.

5. Mehānisms (1) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka ir aprīkots ar sensoru bumbiņas (11) palaišanas ātruma mērīšanai, kurā ir iebūvēta vadotne (19), pie tam izmantošanas procesā izmērītais ātrums, kas ir mazāks par paredzēto minimālo ātrumu, izraisa spēles anulēšanu.

6. Mehānisms (1) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka ir aprīkots ar sensoru bumbiņas (11) palaišanas ātruma mērīšanai, kurā ir iebūvēta vadotne (19), pie tam izmantošanas procesā izmērītais ātrums individuālā spēlē tiek ņemts vērā datorizētā ruletes rata rotējošās daļas ātruma koriģēšanai.



SEQ ID No:245 = Asp Tyr Asn Met His;

1 5

SEQ ID No:246 = Glu Ile Asn Pro Asn Ser Gly Gly Ala Gly Tyr Asn Gln Lys Phe Lys Gly;

1 5 10 15

SEQ ID No:247 = Leu Gly Tyr Asp Asp Ile Tyr Asp Asp Trp Tyr Phe Asp Val;

1 5 10

SEQ ID No: 78 = Arg Ala Ser Gln Asp Ile Ser Asn Tyr Leu Asn;

1 5 10

SEQ ID No: 79 = Tyr Thr Ser Arg Leu Leu Ser;

1 5

un

SEQ ID No: 80 = Gln Gln Gly Asp Thr Leu Pro Tyr Thr.

1 5

2. Antiviela izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur ievadāmais antisklerostīna daudzums ir no 1 līdz 3 mg/kg.

3. Antiviela izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur ievadāmais antisklerostīna daudzums ir aptuveni 2 mg/kg.

4. Antiviela izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur ievadāmais antisklerostīna daudzums ir aptuveni 3 mg/kg.

5. Antiviela izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur metode ietver devas no 70 līdz 450 mg ievadīšanu.

6. Antiviela izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur metode ietver aptuveni 140 mg devas ievadīšanu.

7. Antiviela izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur metode ietver aptuveni 210 mg devas ievadīšanu.

8. Antiviela izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur antisklerostīna antivielas daudzumu pacientam ievada vienu reizi katrās divās nedēļās.

9. Antiviela izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kur antisklerostīna antivielas daudzumu pacientam ievada vienu reizi mēnesī.

10. Antiviela izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur antiiviela ir cilvēka antiiviela, humanizēta antiiviela, monoklonāla antiiviela vai himēriskā antiiviela.

11. Antiviela izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur cilvēks cieš no traucējuma, kas ir saistīts ar kauliem un ko izvēlas no rindas, kas sastāv no ahondroplāzijas, kleidokraniālās disostoze, enhondromatozes, fibrozās displāzijas, Gošē slimības, hipofosfatēmiskā rahīta, Marfāna sindroma, multiplās iedzimtās eksotozes, neurofibromatozes, osteogenesis imperfecta, osteopetrozes, osteopoikilozes, sklerotiskiem bojājumiem, pseidoartrozes, piogēnā osteomiēlīta, periodontālās slimības, pretepilepsijas zāļu inducētā kaulu zuduma, primārā un sekundārā hiperparatiroidisma, ģimenes hiperparatiroidisma sindromiem, bezsvara stāvokļa inducētā kaulu zuduma, osteoporozes vīriešiem, kaulu postmenopauzes zuduma, osteoartrīta, renālās osteodistrofijas, infiltratīviem kaulu traucējumiem, mutes kaulu zuduma, žokļu osteonekrozes, juvenīlas Pedžeta slimības, meloreostoze, metaboliskām kaulu slimībām, mastocitozes, sirpjveida šūnu anēmijas/slimības, ar orgāna transplantātu saistīta kaulu zuduma, ar nieru transplantātu saistītā kaulu zuduma, sistēmiskās vilkēdes, ankilozējošā spondilīta, epilepsijas, juvenīliem artrītiem, talasēmijas, mukopolisaharidozes, Fābri slimības, Tērnera sindroma, Dauna sindroma, Kliefeltera sindroma, lepras, Pertesa slimības, pusaudžu idiopātiskās skoliozes, zīdaiņu agrīnās multisistēmiskās iekaisuma slimības, Vinčestera sindroma, Menkes slimības, Vilsona slimības, išēmiskās kaulu slimības, Lega-Kalvē-Pertesa slimības, reģionālās migrējošās osteoporozes, anēmiskajiem stāvokļiem, steroidu izraisītajiem stāvokļiem, glikokortikoīdu inducētā kaulu zuduma, heparīna

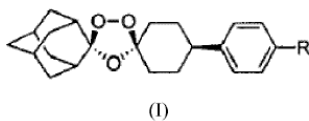
- (51) **A61K 39/395**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2195026**
- A61P 19/08**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 08832690.5 (22) 17.09.2008
- (43) 16.06.2010
- (45) 25.12.2013
- (31) 973024 P (32) 17.09.2007 (33) US
- (86) PCT/US2008/076679 17.09.2008
- (87) WO2009/039175 26.03.2009
- (73) Amgen, Inc, Patent Operations, M/S 28-2-C One Amgen Center Drive, Thousand Oaks, California 91320-1799, US
- (72) PADHI, Ian, Desmond, US
- JANG, Graham, Richard, US
- (74) Campbell, Patrick John Henry, 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) **ANTISKLEROSTĪNA ANTIVIELAS ANTI-SCLEROSTIN ANTIBODIES**
- (57) 1. Antisklerostīna antiiviela izmantošanai metodē kaulu audu resorbcijas inhibēšanai cilvēkam, kurā cilvēkam ievada antisklerostīna antiivielu daudzumā no 1 līdz 5 mg/kg, kur antisklerostīna antiiviela ir antiiviela vai tās fragments, kas: (a) izrāda sasaistošu afinitāti pret sklerostīnu ar SEQ ID NO: 1 mazāku vai vienādu ar 1x10⁻⁷M; un (b) satur SEQ ID NO: 245 CDR-H1, SEQ ID NO: 246 CDR-H2, SEQ ID NO: 247 CDR-H3, SEQ ID NO: 78 CDR-L1, SEQ ID NO: 79 CDR-L2 un SEQ ID NO: 80 CDR-L3, kur:

14. Dispiro-1,2,4-trioksolāns saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai, izvēlēts no *cis*-adamantān-2-spiro-3'-8'-[4'-[2'-(4'-morfolinil)etoksi]fenil]-1',2',4'triokspiro[4.5]dekāna, *cis*-adamantān-2-spiro-3'-8'-[4'-[2'-(4'-morfolinil)etoksi]fenil]-1',2',4'triokspiro[4.5]dekāna mezilāta, *cis*-adamantān-2-spiro-3'-8'-[4'-[2'-(4'-morfolinil)etoksi]fenil]-1',2',4'triokspiro[4.5]dekāna tozilāta, *cis*-adamantān-2-spiro-3'-8'-[4'-[2'-(4'-morfolinil)etoksi]fenil]-1',2',4'triokspiro[4.5]dekāna maleāta, *cis*-adamantān-2-spiro-3'-8'-[4'-[2'-(4'-morfolinil)etoksi]fenil]-1',2',4'triokspiro[4.5]dekāna hidrohlorīda, *cis*-adamantān-2-spiro-3'-8'-[4'-[2'-(4'-morfolinil)etoksi]fenil]-1',2',4'triokspiro[4.5]dekāna izetionāta, *cis*-adamantān-2-spiro-3'-8'-[4'-[2'-(4'-morfolinil)etoksi]fenil]-1',2',4'triokspiro[4.5]dekāna hidrogēnfumarāta, *cis*-adamantān-2-spiro-3'-8'-[4'-[2'-(4'-morfolinil)etoksi]fenil]-1',2',4'triokspiro[4.5]dekāna dihidrogēnfosfāta un *cis*-adamantān-2-spiro-3'-8'-[4'-[2'-(4'-morfolinil)etoksi]fenil]-1',2',4'triokspiro[4.5]dekāna tartrāta.

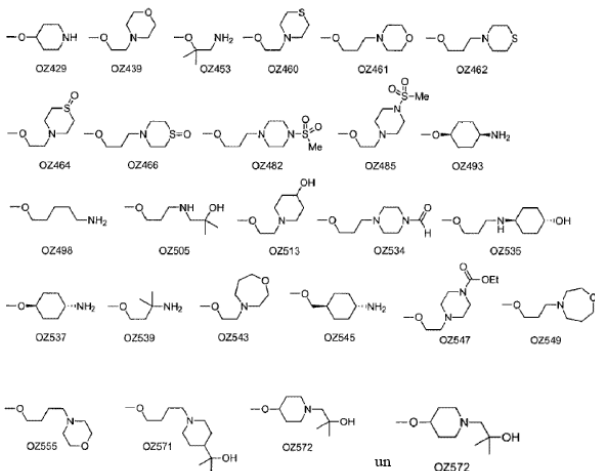
15. Dispiro-1,2,4-trioksolāns saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai, izvēlēts no *cis*-adamantān-2-spiro-3'-8'-[4'-(*cis*-4'-aminocikloheksiloksi)fenil]-1',2',4'triokspiro[4.5]dekāna, *cis*-adamantān-2-spiro-3'-8'-[4'-(*cis*-4'-aminocikloheksiloksi)fenil]-1',2',4'triokspiro[4.5]dekāna hidrohlorīda un *cis*-adamantān-2-spiro-3'-8'-[4'-(*cis*-4'-aminocikloheksiloksi)fenil]-1',2',4'triokspiro[4.5]dekāna maleāta.

16. Dispiro-1,2,4-trioksolāns saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka triksolāns ir ievadāms orāli.

17. Kompozīcijas malārijas profilaksei un ārstēšanai ražošanas metode, kas ietver: malārijas profilaksei vai malārijas ārstēšanai atbilstoša efektīva daudzuma dispiro-1,2,4-trioksolāna, tā prekursoru un optisko izomēru sajaukšanu ar farmaceitiski pieņemamu nesēju, un minētais triksolāns ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no savienojumiem ar formulu (I)



raksturīgiem ar to, ka R ir izvēlēts no:



farmaceutiski pieņemamiem to sāļiem, un to kombinācijām.

- | | | |
|---|---------------------|---------|
| (51) A61K 39/395 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | (11) 2203478 | |
| A61K 45/06 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| A61K 31/663 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| C07K 16/18 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| G01N 33/68 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| (21) 08838428.4 | (22) 10.10.2008 | |
| (43) 07.07.2010 | | |
| (45) 20.11.2013 | | |
| (31) 07118414 | (32) 12.10.2007 | (33) EP |
| 08151911 | 25.02.2008 | EP |
| 08161342 | 29.07.2008 | EP |

- | | |
|---|------------|
| (86) PCT/EP2008/063691 | 10.10.2008 |
| (87) WO2009/047356 | 16.04.2009 |
| (73) Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH | |
| (72) KNEISSEL, Michaela, CH | |
| HALLEUX, Christine, CH | |
| HU, Shou-Ih, US | |
| DIEFENBACH-STREIBER, Beate, DE | |
| PRASSLER, Josef, DE | |
| (74) Spinner, David Richard, Novartis Pharma AG Patent Department, 4002 Basel, CH | |
| Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV | |
| (54) KOMPOZĪCIJAS UN PAŅĒMIENI ANTIVIELU IZMANTOŠANAI PRET SKLEROSTĪNU | |
| COMPOSITIONS AND METHODS FOR USE OF ANTI-BODIES AGAINST SCLEROSTIN | |

(57) 1. Anti-sklerostīna antivielas, kas ietver smagās ķēdes variabla rajona polipeptīda sekvenci, kas satur SEQ ID NO: 70, un vieglās ķēdes variabla rajona polipeptīda sekvenci, kas satur SEQ ID NO: 81.

2. Antivielas saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver pilna garuma smagās ķēdes aminoskābes sekvenci, kas satur SEQ ID NO: 114.

3. Antivielas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 2. pretenzijai, kas ietver pilna garuma vieglās ķēdes aminoskābes sekvenci, kas satur SEQ ID NO: 125

4. Antivielas, kas ietver smagās ķēdes SEQ ID NO: 114 sekvenci un vieglās ķēdes SEQ ID NO: 125 sekvenci.

5. Antivielas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai izmantošanai par medikamentu.

6. Antivielas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai izmantošana medikamenta ražošanā tāda patoloģiska traucējuma ārstēšanai, kuru pastarpina sklerostīns, vai kas ir saistīts ar sklerostīna paaugstinātu līmeni, kur patoloģiskais traucējums ir vismaz viens no primārās vai sekundārās osteoporozes, osteopēnijas, osteomalācijas, nepilnīgas osteoģenēzes, avaskulāras nekrozes, zināmas arī kā osteonekroze, lūzumiem un implantāta dzīšanas, ieskaitot zobu implantātus un gūžas implantātus, kaulu zaudējuma, kas radies citu traucējumu rezultātā, tādu kā kaulu zaudējuma, kas saistīts ar HIV infekciju, ļaundabīgiem audzējiem vai artrītu.

7. Antivielas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai izmantošanai tāda patoloģiska traucējuma ārstēšanā, kuru pastarpina sklerostīns, vai kas ir saistīts ar sklerostīna paaugstinātu līmeni, kur patoloģiskais traucējums ir vismaz viens no primārās vai sekundārās osteoporozes, osteopēnijas, osteomalācijas, nepilnīgas osteoģenēzes, avaskulāras nekrozes, zināmas arī kā osteonekroze, lūzumiem un implantāta dzīšanas, ieskaitot zobu implantātus un gūžas implantātus, kaulu zaudējuma, kas radies citu traucējumu rezultātā, tādu kā kaulu zaudējuma, kas saistīts ar HIV infekciju, ļaundabīgiem audzējiem vai artrītu.

8. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur antivielu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai.

9. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 8. pretenziju kombinācijā ar vienu vai vairākām farmaceitiski pieņemamām palīgvielām, šķīdinātājiem vai nesējiem.

10. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 8. vai 9. pretenziju, kas papildus satur citas aktīvas sastāvdaļas.

11. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 8. vai 9. pretenziju, kas papildus satur vismaz vienu citu pretiekaisuma vai pretosteoporozes līdzekli.

12. Izolēta polinukleotīda sekvence, kas kodē antivielu, saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai.

13. Klonēšanas vai ekspresijas vektors, kas satur vienu vai vairākas polinukleotīda sekvences saskaņā ar 12. pretenziju.

14. Vektors saskaņā ar 13. pretenziju, kur vektors satur vismaz vienu nukleīnskābes sekvenci no grupas, kas sastāv no SEQ ID NO: 136 un 147.

15. Saimniekšūna, kas ietver vienu vai vairākus klonēšanas vai ekspresijas vektorus saskaņā ar 13. vai 14. pretenziju.

16. Paņēmiens antivielas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai ražošanai, kas ietver saimniekšūnas saskaņā ar 15. pretenziju kultivēšanu un minētās antivielas izdalīšanu.

17. Antivielas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai farmaceitiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 11. pretenzijai, izmantošanai tāda patoloģiska traucējuma ārstēšanā vai

profilaksē, kuru pastarpina sklerostīns, vai kas ir saistīts ar sklerostīna paaugstinātu līmeni, kur patoloģiskais traucējums ir vismaz viens no primārās vai sekundārās osteoporozes, osteopēnijas, osteomalācijas, nepilnīgas osteoģenēzes, avaskulāras nekrozes, zināmas arī kā osteonekroze, lūzumiem un implantāta dzišanas, ieskaitot zobu implantātus un gūžas implantātus, kaulu zaudējuma, kas radies citu traucējumu rezultātā, tādu kā kaulu zaudējuma, kas saistīts ar HIV infekciju, ļaundabīgiem audzējiem vai artrītu.

18. Diagnostikas komplekts, kas satur antivielu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai.

19. *In vitro* paņēmieni šūnas vai audu ekspresējoša sklerostīna identificēšanai, kas ietver minētās šūnas vai audu kontaktēšanu ar antivielu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kur minētā antivielu papildus ietver tādu nosakāmu iezīmēšanu, kā radioaktīvu, fluorescentu, magnētisku, paramagnētisku vai hemiluminescentu iezīmi.

20. Antivielas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai un (i) zoledronskābes, (ii) anti-DKK1 antivielas, (iii) alendronāta, (iv) anti-LRP4 antivielas, (v) hPTH un/vai (vi) paratiroīdā hormona iedarbības līdzekļa, tāda kā kalcilītiskie savienojumi, izmantošana medikamenta ražošanā tāda patoloģiska traucējuma ārstēšanai, kuru pastarpina sklerostīns, vai kas ir saistīts ar sklerostīna paaugstinātu līmeni, kur patoloģiskais traucējums ir vismaz viens no primārās vai sekundārās osteoporozes, osteopēnijas, osteomalācijas, nepilnīgas osteoģenēzes, avaskulāras nekrozes, zināmas arī kā osteonekroze, lūzumiem un implantāta dzišanas, ieskaitot zobu implantātus un gūžas implantātus, kaulu zaudējuma, kas radies citu traucējumu rezultātā, tādu kā kaulu zaudējuma, kas saistīts ar HIV infekciju, ļaundabīgiem audzējiem vai artrītu.

21. Antivielas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai izmantošana medikamenta ražošanā tāda patoloģiska traucējuma ārstēšanai, kuru pastarpina sklerostīns, vai kas ir saistīts ar sklerostīna paaugstinātu līmeni, kur medikaments tiek izmatots kopā ar (i) zoledronskābi, (ii) anti-DKK1 antivielu, (iii) alendronātu, (iv) anti-LRP4 antivielu, (v) hPTH un/vai (vi) paratiroīdā hormona iedarbības līdzekļiem, tādiem kā kalcilītiskie savienojumi, un kur patoloģiskais traucējums ir vismaz viens no primārās vai sekundārās osteoporozes, osteopēnijas, osteomalācijas, nepilnīgas osteoģenēzes, avaskulāras nekrozes, zināmas arī kā osteonekroze, lūzumiem un implantāta dzišanas, ieskaitot zobu implantātus un gūžas implantātus, kaulu zaudējuma, kas radies citu traucējumu rezultātā, tādu kā kaulu zaudējuma, kas saistīts ar HIV infekciju, ļaundabīgiem audzējiem vai artrītu.

22. (i) Zoledronskābes, (ii) anti-DKK1 antivielas, (iii) alendronāta, (iv) anti-LRP4 antivielas, (v) hPTH un/vai (vi) paratiroīdā hormona iedarbības līdzekļu, tādu kā kalcilītiskie savienojumi, izmantošana medikamenta ražošanā tāda patoloģiska traucējuma ārstēšanai, kuru pastarpina sklerostīns, vai kas ir saistīts ar sklerostīna paaugstinātu līmeni, kur medikaments ir izmatots kopā ar antivielu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai un kur patoloģiskais traucējums ir vismaz viens no primārās vai sekundārās osteoporozes, osteopēnijas, osteomalācijas, nepilnīgas osteoģenēzes, avaskulāras nekrozes, zināmas arī kā osteonekroze, lūzumiem un implantāta dzišanas, ieskaitot zobu implantātus un gūžas implantātus, kaulu zaudējuma, kas radies citu traucējumu rezultātā, tādu kā kaulu zaudējuma, kas saistīts ar HIV infekciju, ļaundabīgiem audzējiem vai artrītu.

23. Antivielas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai izmantošana medikamenta ražošanā tāda patoloģiska traucējuma ārstēšanai, kuru pastarpina sklerostīns, vai kas ir saistīts ar sklerostīna paaugstinātu līmeni, kur pacientam iepriekš ir tikusi ievadīta (i) zoledronskābe, (ii) anti-DKK1 antivielu, (iii) alendronāts, (iv) anti-LRP4 antivielu, (v) hPTH un/vai (vi) paratiroīdā hormona iedarbības līdzekļi, tādi kā kalcilītiskie savienojumi, un kur patoloģiskais traucējums ir vismaz viens no primārās vai sekundārās osteoporozes, osteopēnijas, osteomalācijas, nepilnīgas osteoģenēzes, avaskulāras nekrozes, zināmas arī kā osteonekroze, lūzumiem un implantāta dzišanas, ieskaitot zobu implantātus un gūžas implantātus, kaulu zaudējuma, kas radies citu traucējumu rezultātā, tādu kā kaulu zaudējuma, kas saistīts ar HIV infekciju, ļaundabīgiem audzējiem vai artrītu.

24. (i) Zoledronskābes, (ii) anti-DKK1 antivielas, (iii) alendronāta, (iv) anti-LRP4 antivielas, (v) hPTH un/vai (vi) paratiroīdā hormona iedarbības līdzekļu, tādu kā kalcilītiskie savienojumi, izmantošana

medikamenta ražošanā tāda patoloģiska traucējuma ārstēšanai, kuru pastarpina sklerostīns, vai kas ir saistīts ar sklerostīna paaugstinātu līmeni, kur pacientam iepriekš ir tikusi ievadīta antivielu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, un kur patoloģiskais traucējums ir vismaz viens no primārās vai sekundārās osteoporozes, osteopēnijas, osteomalācijas, nepilnīgas osteoģenēzes, avaskulāras nekrozes, zināmas arī kā osteonekroze, lūzumiem un implantāta dzišanas, ieskaitot zobu implantātus un gūžas implantātus, kaulu zaudējuma, kas radies citu traucējumu rezultātā, tādu kā kaulu zaudējuma, kas saistīts ar HIV infekciju, ļaundabīgiem audzējiem vai artrītu.

25. Antivielu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai un (i) zoledronskābe, (ii) anti-DKK1 antivielu, (iii) alendronāts, (iv) anti-LRP4 antivielu, (v) hPTH un/vai (vi) paratiroīdā hormona iedarbības līdzekļi, tādi kā kalcilītiskie savienojumi, izmantošanai tāda patoloģiska traucējuma ārstēšanā, kuru pastarpina sklerostīns, vai kas ir saistīts ar sklerostīna paaugstinātu līmeni, kur patoloģiskais traucējums ir vismaz viens no primārās vai sekundārās osteoporozes, osteopēnijas, osteomalācijas, nepilnīgas osteoģenēzes, avaskulāras nekrozes, zināmas arī kā osteonekroze, lūzumiem un implantāta dzišanas, ieskaitot zobu implantātus un gūžas implantātus, kaulu zaudējuma, kas radies citu traucējumu rezultātā, tādu kā kaulu zaudējuma, kas saistīts ar HIV infekciju, ļaundabīgiem audzējiem vai artrītu.

26. Antivielu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas izmantota kopā ar (i) zoledronskābi, (ii) anti-DKK1 antivielu, (iii) alendronātu, (iv) anti-LRP4 antivielu, (v) hPTH un/vai (vi) paratiroīdā hormona iedarbības līdzekļiem, tādiem kā kalcilītiskie savienojumi, izmantošanai tāda patoloģiska traucējuma ārstēšanā, kuru pastarpina sklerostīns, vai kas ir saistīts ar sklerostīna paaugstinātu līmeni, kur patoloģiskais traucējums ir vismaz viens no primārās vai sekundārās osteoporozes, osteopēnijas, osteomalācijas, nepilnīgas osteoģenēzes, avaskulāras nekrozes, zināmas arī kā osteonekroze, lūzumiem un implantāta dzišanas, ieskaitot zobu implantātus un gūžas implantātus, kaulu zaudējuma, kas radies citu traucējumu rezultātā, tādu kā kaulu zaudējuma, kas saistīts ar HIV infekciju, ļaundabīgiem audzējiem vai artrītu.

27. Antivielu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai izmantošanai tāda patoloģiska traucējuma ārstēšanā, kuru pastarpina sklerostīns, vai kas ir saistīts ar sklerostīna paaugstinātu līmeni, kur pacientam iepriekš ir tikusi ievadīta (i) zoledronskābe, (ii) anti-DKK1 antivielu, (iii) alendronāts, (iv) anti-LRP4 antivielu, (v) hPTH un/vai (vi) paratiroīdā hormona iedarbības līdzekļi, tādi kā kalcilītiskie savienojumi, un kur patoloģiskais traucējums ir vismaz viens no primārās vai sekundārās osteoporozes, osteopēnijas, osteomalācijas, nepilnīgas osteoģenēzes, avaskulāras nekrozes, zināmas arī kā osteonekroze, lūzumiem un implantāta dzišanas, ieskaitot zobu implantātus un gūžas implantātus, kaulu zaudējuma, kas radies citu traucējumu rezultātā, tādu kā kaulu zaudējuma, kas saistīts ar HIV infekciju, ļaundabīgiem audzējiem vai artrītu.

28. (i) Zoledronskābe, (ii) anti-DKK1 antivielu, (iii) alendronāts, (iv) anti-LRP4 antivielu, (v) hPTH un/vai (vi) paratiroīdā hormona iedarbības līdzekļi, tādi kā kalcilītiskie savienojumi izmantošanai tāda patoloģiska traucējuma ārstēšanā, kuru pastarpina sklerostīns, vai kas ir saistīts ar sklerostīna paaugstinātu līmeni, kur pacientam iepriekš ir tikusi ievadīta antivielu, saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, un kur patoloģiskais traucējums ir vismaz viens no primārās vai sekundārās osteoporozes, osteopēnijas, osteomalācijas, nepilnīgas osteoģenēzes, avaskulāras nekrozes, zināmas arī kā osteonekroze, lūzumiem un implantāta dzišanas, ieskaitot zobu implantātus un gūžas implantātus, kaulu zaudējuma, kas radies citu traucējumu rezultātā, tādu kā kaulu zaudējuma, kas saistīts ar HIV infekciju, ļaundabīgiem audzējiem vai artrītu.

29. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 20. līdz 28. pretenzijai, kur hPTH ir hPTH(1-34).

(51) **A61K 31/472**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2207550**

A61K 31/4725⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 25/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 25/22⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

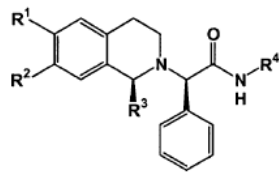
A61P 43/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(21) 08807937.1

(22) 09.10.2008

(43) 21.07.2010

- (45) 11.12.2013
 (31) PCT/IB2007/054130 (32) 10.10.2007 (33) WO
 (86) PCT/IB2008/054138 09.10.2008
 (87) WO2009/047723 16.04.2009
 (73) Actelion Pharmaceuticals Ltd., Gewerbestrasse 16, 4123 Allschwil, CH
 (72) JENCK, François, CH
 (74) Velker, Jörg, et al, Actelion Pharmaceuticals Ltd, Gewerbestrasse 16, 4123 Allschwil, CH
 Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
 (54) **TETRAHIDROHINOLĪNA ATVASINĀJUMI POSTTRAUMATISKĀ STRESA TRAUCĒJUMU ĀRSTĒŠANAI**
TETRAHYDROQUINOLINE DERIVATIVES FOR TREATING POST-TRAUMATIC STRESS DISORDERS
 (57) 1. Savienojuma ar formulu (Ia)



Ia

kur R¹ un R² katrs neatkarīgi ir (C₁-C₄)alkoksigrupa, R³ ir aril-(C₁-C₄)alkilgrupa vai heteroaril-(C₁-C₄)alkilgrupa, un R⁴ ir (C₁-C₃)alkilgrupa, vai minētā savienojuma ar formulu (Ia) farmaceitiski pieņemama sāls pielietošana, lai iegūtu medikamentu posttraumatisko stresa traucējumu novēršanai vai ārstēšanai.

2. Pielietošana saskaņā ar 1. pretenziju raksturīga ar to, ka savienojums ar formulu (Ia) vai tā farmaceitiski pieņemamais sāls satur R¹, kas ir metoksigrupa vai etoksigrupa.

3. Pielietošana saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju raksturīga ar to, ka savienojums ar formulu (Ia) vai tā farmaceitiski pieņemamais sāls satur R², kas ir metoksigrupa vai etoksigrupa.

4. Pielietošana saskaņā ar 1. līdz 3. pretenziju, raksturīga ar to, ka savienojums ar formulu (Ia) vai tā farmaceitiski pieņemamais sāls satur R³, kas ir aril-(C₁-C₄)alkilgrupa.

5. Pielietošana saskaņā ar 4. pretenziju, raksturīga ar to, ka savienojums ar formulu (Ia) vai tā farmaceitiski pieņemamais sāls satur R³, kas ir 2-(4-trifluormetilfenil)etilgrupa.

6. Pielietošana saskaņā ar 1. līdz 3. pretenziju, raksturīga ar to, ka savienojums ar formulu (Ia) vai tā farmaceitiski pieņemamais sāls satur R³, kas ir heteroaril-(C₁-C₄)alkilgrupa.

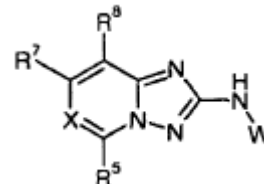
7. Pielietošana saskaņā ar 1. līdz 6. pretenziju, raksturīga ar to, ka savienojums ar formulu (Ia) vai tā farmaceitiski pieņemamais sāls satur R⁴, kas ir metilgrupa.

8. Pielietošana saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīga ar to, ka savienojums ar formulu (Ia) vai tā farmaceitiski pieņemamais sāls ir (R)-2-((S)-6,7-dimetoksi-1-[2-(4-trifluormetilfenil)-etil]-3,4-dihidro-1H-izohinolin-2-il)-N-metil-2-fenil-acetamīds vai viens no tā farmaceitiski pieņemamiem sāļiem.

9. Pielietošana saskaņā ar 8. pretenziju, raksturīga ar to, ka tiek lietots (R)-2-((S)-6,7-dimetoksi-1-[2-(4-trifluormetilfenil)-etil]-3,4-dihidro-1H-izohinolin-2-il)-N-metil-2-fenil-acetamīda hidrohlorīds.

10. Savienojums ar formulu (Ia) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemamais sāls lietošanai posttraumatisko stresa traucējumu novēršanai vai ārstēšanai.

- (21) 08806565.1 (22) 10.10.2008
 (43) 18.08.2010
 (45) 04.12.2013
 (31) 978792 P (32) 10.10.2007 (33) US
 0719803 10.10.2007 GB
 (86) PCT/GB2008/003428 10.10.2008
 (87) WO2009/047514 16.04.2009
 (73) Cancer Research Technology Limited, Angel Building, 407 St John Street, London EC1V 4AD, GB
 (72) PAVÉ, Grégoire, Alexandre, GB
 FIRTH, James, Donald, GB
 STEWART, Lorna, GB
 RIGOREAU, Laurent, Jean, Martin, GB
 WYNNE, Emma, Louise, GB
 (74) Wytenburg, Wilhelmus Johannes, et al, Mewburn Ellis LLP, 33 Gutter Lane, London EC2V 8AS, GB
 Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
 (54) **[1,2,4]TRIAZOL[1,5-A]PIRIDĪNA UN [1,2,4]TRIAZOL[1,5-C]PIRIMIDĪNA SAVIENOJUMI UN TO PIELIETOŠANA**
[1,2,4]TRIAZOLO[1,5-A]PYRIDINE AND [1,2,4]TRIAZOLO[1,5-C]PYRIMIDINE COMPOUNDS AND THEIR USE
 (57) 1. Savienojums, izvēlēts no savienojumiem ar sekojošo formulu, un tā farmaceitiski pieņemami sāļi, hidrāti un solvāti:



raksturīgs ar to, ka:

- X= ir neatkarīgi -CR⁶= grupa;
- R⁵ ir neatkarīgi -R^{5A} grupa;
- R⁶ ir neatkarīgi -R^{6A} grupa;
- R⁷ ir neatkarīgi -R^{7A} grupa;
- W ir neatkarīgi -W^A grupa; un
- W^A ir neatkarīgi -R^{WA1} grupa;

raksturīgs ar to, ka:

- R^{5A} ir neatkarīgi -Q^{5A};
- Q^{5A} ir neatkarīgi -R^{2A7} vai -R^{2A8};
- R^{6A} ir neatkarīgi -H;
- R^{7A} ir neatkarīgi -H;
- R^{8A} ir neatkarīgi -H;
- R^{WA1} ir neatkarīgi -R^{1A7} vai -R^{1A8};

raksturīgs ar to, ka:

- R^{1A7} ir neatkarīgi fenilgrupa; un
- R^{1A8} ir neatkarīgi furanilgrupa, tienilgrupa, piridilgrupa vai pirimidinilgrupa;

raksturīgs ar to, ka:

- R^{1A7} un -R^{1A8} ir neobligāti aizvietoti ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{1B1} un/vai vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{1B2};

raksturīgs ar to, ka:

- katrs -R^{1B1} ir neatkarīgi:
- R^{1D1}, -R^{1D2}, -R^{1D3}, -R^{1D4}, -R^{1D5}, -R^{1D6}, -R^{1D7}, -R^{1D8},
- L^{1D}, -R^{1D4}, -L^{1D}, -R^{1D5}, -L^{1D}, -R^{1D6}, -L^{1D}, -R^{1D7} vai -L^{1D}, -R^{1D8};

katrs -R^{1B2} ir neatkarīgi:

- F, -Cl, -Br, -I,
- CF₃, -OCF₃,
- OH, -L^{1C}-OH, -O-L^{1C}-OH,
- OR^{1C1}, -L^{1C}-OR^{1C1}, -O-L^{1C}-OR^{1C1},
- SH, -SR^{1C1},
- CN,
- NO₂,
- NH₂, -NHR^{1C1}, -NR^{1C1}, -NR^{1C2}R^{1C3},
- L^{1C}-NH₂, -L^{1C}-NHR^{1C1}, -L^{1C}-NR^{1C1}₂, -L^{1C}-NR^{1C2}R^{1C3},
- O-L^{1C}-NH₂, -O-L^{1C}-NHR^{1C1}, -O-L^{1C}-NR^{1C1}₂, -O-L^{1C}-NR^{1C2}R^{1C3},
- C(=O)OH, -C(=O)OR^{1C1},
- C(=O)R^{1C1},
- C(=O)NH₂, -C(=O)NHR^{1C1}, -C(=O)NR^{1C1}₂, -C(=O)NR^{1C2}R^{1C3},
- NHC(=O)R^{1C1}, -NR^{1C1}C(=O)R^{1C1},

- (51) C07D 249/18⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) 2217578
 C07D 401/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 C07D 403/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 C07D 403/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 C07D 405/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 C07D 407/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 C07D 409/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 C07D 413/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 C07D 413/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 C07D 471/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

-NHC(=O)OR^{1C1}, -NR^{1C1}C(=O)OR^{1C1},
 -OC(=O)NH₂, -OC(=O)NHR^{1C1}, -OC(=O)NR^{1C1}₂, -OC(=O)NR^{1C2}R^{1C3},
 -NHC(=O)NH₂, -NHC(=O)NHR^{1C1},
 -NHC(=O)NR^{1C1}₂, -NHC(=O)NR^{1C2}R^{1C3},
 -NR^{1C1}C(=O)NH₂, -NR^{1C1}C(=O)NHR^{1C1},
 -NR^{1C1}C(=O)NR^{1C1}₂, -NR^{1C1}C(=O)NR^{1C2}R^{1C3},
 -NHS(=O)₂R^{1C1}, -NR^{1C1}S(=O)₂R^{1C1},
 -S(=O)₂NH₂, -S(=O)₂NHR^{1C1}, -S(=O)₂NR^{1C1}₂, -S(=O)₂NR^{1C2}R^{1C3},
 -S(=O)₂R^{1C1}, -S(=O)₂R^{1C1}, -OS(=O)₂R^{1C1} vai -S(=O)₂OR^{1C1};

raksturīgs ar to, ka:

katrs -L^{1C-} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₅alkilēngrupa;
 katrs -NR^{1C2}R^{1C3} ir neatkarīgi azetidīngrupa, pirolidīngrupa, imid-
 azolidīngrupa, pirazolidīngrupa, piperidīngrupa, piperazīngrupa,
 morfolīngrupa, azepīngrupa vai diazepīngrupa, un ir neobligāti
 aizvietots ar vienu vai vairākām grupām, kas ir izvēlētas no pie-
 sātinātām alifātiskām C₁₋₃alkilgrupām, -F un -CF₃ grupām;

katrs -R^{1C1} ir neatkarīgi:

-R^{1D1}, -R^{1D2}, -R^{1D3}, -R^{1D4}, -R^{1D5}, -R^{1D6}, -R^{1D7}, -R^{1D8},
 -L^{1D}-R^{1D4}, -L^{1D}-R^{1D5}, -L^{1D}-R^{1D6}, -L^{1D}-R^{1D7} vai -L^{1D}R^{1D8};

katrs -R^{1D1} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₆alkilgrupa;

katrs -R^{1D2} ir neatkarīgi alifātiska C₂₋₆alkenilgrupa;

katrs -R^{1D3} ir neatkarīgi alifātiska C₂₋₆alkenilgrupa;

katrs -R^{1D4} ir neatkarīgi piesātināta C₃₋₆cikloalkilgrupa;

katrs -R^{1D5} ir neatkarīgi C₃₋₆cikloalkilgrupa;

katrs -R^{1D6} ir neatkarīgi nearomātiska C₃₋₈heterociklilgrupa;

katrs -R^{1D7} ir neatkarīgi C₆₋₁₀karboarilgrupa;

katrs -R^{1D8} ir neatkarīgi C₅₋₁₀heteroarilgrupa;

katrs -L^{1D-} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₃alkilēngrupa;

raksturīgs ar to, ka:

katrs -R^{1D4}, -R^{1D5}, -R^{1D6}, -R^{1D7}, un -R^{1D8} ir neobligāti aizvietots ar
 vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{1E1} un/vai vienu vai vairākiem
 aizvietotājiem -R^{1E2};

katrs -R^{1D1}, -R^{1D2}, -R^{1D3}, un -L^{1D-} ir neobligāti aizvietots ar vienu vai
 vairākiem aizvietotājiem -R^{1E2}, un

raksturīgs ar to, ka:

katrs -R^{1E1} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₄alkilgrupa, fenil-
 grupa vai benzilgrupa;

katrs -R^{1E2} ir neatkarīgi:

-F, -Cl, -Br, -I,
 -CF₃, -OCF₃,
 -OH, -L^{1F}-OH, -O-L^{1F}-OH,
 -OR^{1F1}, -L^{1F}-OR^{1F1}, -O-L^{1F}-OR^{1F1},
 -SH, -SR^{1F1},
 -CN,
 -NO₂,

-NH₂, -NHR^{1F1}, -NR^{1F1}₂, -NR^{1F2}R^{1F3},
 -L^{1F}-NH₂, -L^{1F}-NHR^{1F1}, -L^{1F}-NR^{1F1}₂, -L^{1F}-NR^{1F2}R^{1F3},
 -C(=O)OH, -C(=O)OR^{1F1},
 -C(=O)NH₂, -C(=O)NHR^{1F1}, -C(=O)NR^{1F1}₂ vai -C(=O)NR^{1F2}R^{1F3};

raksturīgs ar to, ka:

katrs -R^{1F1} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₄alkilgrupa, fenil-
 grupa vai benzilgrupa;

katrs -L^{1F-} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₅alkilēngrupa; un
 katrs -NR^{1F2}R^{1F3} ir neatkarīgi azetidīngrupa, pirolidīngrupa, imid-
 azolidīngrupa, pirazolidīngrupa, piperidīngrupa, piperazīngrupa,
 morfolīngrupa, azepīngrupa vai diazepīngrupa, un ir neobligāti
 aizvietots ar vienu vai vairākām grupām, kas ir izvēlētas no C₁₋₃alkil-
 grupām, -F, un -CF₃;

raksturīgs ar to, ka:

-R^{2A7} ir neatkarīgi fenilgrupa vai naftilgrupa; un

-R^{2A8} ir neatkarīgi furanilgrupa, tienilgrupa, pirazolilgrupa, piridil-
 grupa, pirimidinilgrupa, 2,3-dihidro-benzofuranilgrupa, benzo[1,3]di-
 oksolilgrupa, 2,3-dihidro-benzo[1,4]dioksilinilgrupa, 3,4-dihidro-2H-
 benzo[b][1,4]dioxepinilgrupa vai 3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oks-
 azinilgrupa;

raksturīgs ar to, ka:

-R^{2A7} un -R^{2A8} ir neobligāti aizvietoti ar vienu vai vairākiem aiz-
 vietotājiem -R^{2B1} un/vai vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{2B2};

raksturīgs ar to, ka:

katrs -R^{2B1} ir neatkarīgi:

-R^{2D1}, -R^{2D2}, -R^{2D3}, -R^{2D4}, -R^{2D5}, -R^{2D6}, -R^{2D7}, -R^{2D8},
 -L^{2D}-R^{2D4}, -L^{2D}-R^{2D5}, -L^{2D}-R^{2D6}, -L^{2D}-R^{2D7} vai -L^{2D}-R^{2D8};

katrs -R^{2B2} ir neatkarīgi:

-F, -Cl, -Br, -I,

-CF₃, -OCF₃,
 -OH, -L^{2C}-OH, -O-L^{2C}-OH,
 -OR^{2C1}, -L^{2C}-OR^{2C1}, -O-L^{2C}-OR^{2C1},
 -SH, -SR^{2C1},

-CN,

-NO₂,

-NH₂, -NHR^{2C1}, -NR^{2C12}, -NR^{2C2}R^{2C3},

-L^{2C}-NH₂, -L^{2C}-NHR^{2C1}, -L^{2C}-NR^{2C1}₂, -L^{2C}-NR^{2C2}R^{2C3},

-O-L^{2C}-NH₂, -O-L^{2C}-NHR^{2C1}, -O-L^{2C}-NR^{2C1}₂, -O-L^{2C}-NR^{2C2}R^{2C3},

-C(=O)OH, -C(=O)OR^{2C1},

-C(=O)R^{2C1},

-C(=O)NH₂, -C(=O)NHR^{2C1}, -C(=O)NR^{2C1}₂, -C(=O)NR^{2C2}R^{2C3},

-NHC(=O)R^{2C1}, -NR^{2C1}C(=O)R^{2C1},

-NHC(=O)OR^{2C1}, -NR^{2C1}C(=O)OR^{2C1},

-OC(=O)NH₂, -OC(=O)NHR^{2C1}, -OC(=O)NR^{2C1}₂, -OC(=O)NR^{2C2}R^{2C3},

-NHC(=O)NH₂, -NHC(=O)NHR^{2C1},

-NHC(=O)NR^{2C1}₂, -NHC(=O)NR^{2C2}R^{2C3},

-NR^{2C1}C(=O)NH₂, -NR^{2C1}C(=O)NHR^{2C1},

-NR^{2C1}C(=O)NR^{2C1}₂, -NR^{2C1}C(=O)NR^{2C2}R^{2C3},

-NHS(=O)₂R^{2C1}, -NR^{2C1}S(=O)₂R^{2C1},

-S(=O)₂NH₂, -S(=O)₂NHR^{2C1}, -S(=O)₂NR^{2C1}₂, -S(=O)₂NR^{2C2}R^{2C3},

-S(=O)₂R^{2C1}, -S(=O)₂R^{2C1}, -OS(=O)₂R^{2C1} vai -S(=O)₂OR^{2C1};

raksturīgs ar to, ka:

katrs -L^{2C-} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₅alkilēngrupa;

katrs -NR^{2C2}R^{2C3} ir neatkarīgi azetidīngrupa, pirolidīngrupa, imid-
 azolidīngrupa, pirazolidīngrupa, piperidīngrupa, piperazīngrupa,
 morfolīngrupa, azepīngrupa vai diazepīngrupa, un ir neobligāti
 aizvietots ar vienu vai vairākām grupām, kas ir izvēlētas no pie-
 sātinātām alifātiskām C₁₋₃alkilgrupām, -F, un -CF₃;

katrs -R^{2C1} ir neatkarīgi:

-R^{2D1}, -R^{2D2}, -R^{2D3}, -R^{2D4}, -R^{2D5}, -R^{2D6}, -R^{2D7}, -R^{2D8},
 -L^{2D}-R^{2D4}, -L^{2D}-R^{2D5}, -L^{2D}-R^{2D6}, -L^{2D}-R^{2D7} vai -L^{2D}-R^{2D8};

katrs -R^{2D1} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₆alkilgrupa;

katrs -R^{2D2} ir neatkarīgi alifātiska C₂₋₆alkenilgrupa;

katrs -R^{2D3} ir neatkarīgi alifātiska C₂₋₆alkenilgrupa;

katrs -R^{2D4} ir neatkarīgi piesātināta C₃₋₆cikloalkilgrupa;

katrs -R^{2D5} ir neatkarīgi C₃₋₆cikloalkenilgrupa;

katrs -R^{2D6} ir neatkarīgi nearomātiska C₃₋₈heterociklilgrupa;

katrs -R^{2D7} ir neatkarīgi C₆₋₁₀karboarilgrupa;

katrs -R^{2D8} ir neatkarīgi C₅₋₁₀heteroarilgrupa;

katrs -L^{2D-} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₃alkilēngrupa;

raksturīgs ar to, ka:

katrs -R^{2D4}, -R^{2D5}, -R^{2D6}, -R^{2D7}, un -R^{2D8} ir neobligāti aizvietots ar
 vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{2E1} un/vai vienu vai vairākiem
 aizvietotājiem -R^{2E2};

katrs -R^{2D1}, -R^{2D2}, -R^{2D3}, un -L^{2D-} ir neobligāti aizvietots ar vienu vai
 vairākiem aizvietotājiem -R^{2E2}, un

raksturīgs ar to, ka:

katrs -R^{2E1} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₄alkilgrupa, fenil-
 grupa vai benzilgrupa;

katrs -R^{2E2} ir neatkarīgi:

-F, -Cl, -Br, -I,
 -CF₃, -OCF₃,
 -OH, -L^{2F}-OH, -O-L^{2F}-OH,
 -OR^{2F1}, -L^{2F}-OR^{2F1}, -O-L^{2F}-OR^{2F1},
 -SH, -SR^{2F1},

-CN,

-NO₂,

-NH₂, -NHR^{2F1}, -NR^{2F1}₂, -NR^{2F2}R^{2F3},

-L^{2F}-NH₂, -L^{2F}-NHR^{2F1}, -L^{2F}-NR^{2F1}₂, -L^{2F}-NR^{2F2}R^{2F3},

-C(=O)OH, -C(=O)OR^{2F1},

-C(=O)NH₂, -C(=O)NHR^{2F1}, -C(=O)NR^{2F1}₂ vai -C(=O)NR^{2F2}R^{2F3},

raksturīgs ar to, ka:

katrs -R^{2F1} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₄alkilgrupa, fenil-
 grupa vai benzilgrupa;

katrs -L^{2F-} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₅alkilēngrupa; un
 katrs -NR^{2F2}R^{2F3} ir neatkarīgi azetidīngrupa, pirolidīngrupa, imid-
 azolidīngrupa, pirazolidīngrupa, piperidīngrupa, piperazīngrupa,
 morfolīngrupa, azepīngrupa vai diazepīngrupa, un ir neobligāti
 aizvietots ar vienu vai vairākām grupām, kas ir izvēlētas no C₁₋₃alkil-
 grupām, -F, un -CF₃.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīgs ar to, ka
 -R^{WA1} ir neatkarīgi -R^{1A1}.

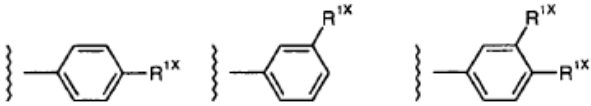
3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīgs ar to, ka

-R^{WA1} ir neatkarīgi -R^{1A8}.

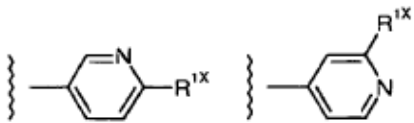
4. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka -Q^{5A} ir neatkarīgi Q^{2A7}.

5. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka -Q^{5A} ir neatkarīgi Q^{2A8}.

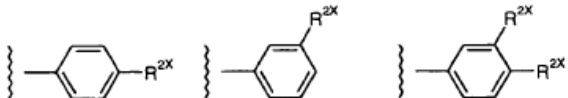
6. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka -R^{1A7}, ja tāds ir, ir neatkarīgi izvēlēts no grupām ar sekojošām formulām, kur katrs -R^{1X} ir neatkarīgi -R^{1B1} vai -R^{1B2}:



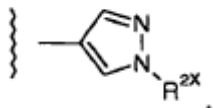
7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka -R^{1A8}, ja tāds ir, ir neatkarīgi izvēlēts no grupām ar sekojošām formulām, kur katrs -R^{1X} ir neatkarīgi -R^{1B1} vai -R^{1B2}:



8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka -R^{2A}, ja tāds ir, ir neatkarīgi izvēlēts no grupām ar sekojošām formulām, kur katrs -R^{2X} ir neatkarīgi -A^{2B1} vai -A^{1B2}:

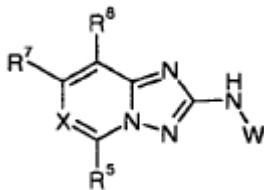


9. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka -R^{2A8}, ja tāds ir, ir neatkarīgi izvēlēts no grupām ar sekojošo formulu, kur katrs -R^{2X} ir neatkarīgi -R^{2B1} vai -R^{2B2}:



10. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka -R^{2A8}, ja tāds ir, ir neatkarīgi 2,3-dihidro-benzo[1,4]doksīn-6-il un ir neobligāti aizvietots.

11. Savienojums, izvēlēts no savienojumiem ar sekojošo formulu un tā farmaceitiski pieņemami sāļi, hidrāti un solvāti:



raksturīgs ar to, ka,

-X= ir neatkarīgi -CR⁶;

-R⁵ ir neatkarīgi -R^{5A};

-R⁶ ir neatkarīgi -R^{6A};

-R⁷ ir neatkarīgi -R^{7A};

-R⁸ ir neatkarīgi -R^{8A};

-W ir neatkarīgi -W^A; un

-W^A ir neatkarīgi -C(=O)R^{WA2};

raksturīgs ar to, ka:

-R^{5A} ir neatkarīgi -Q^{5A};

-Q^{5A} ir neatkarīgi -R^{2A}, -R^{2A8} vai -NHR^{2C1};

-R^{6A} ir neatkarīgi -H;

-R^{7A} ir neatkarīgi -H;

-R^{8A} ir neatkarīgi -H;

-R^{WA2} ir neatkarīgi -R^{1A1}, -R^{1A4} vai -L^{1A}-R^{1A4};

raksturīgs ar to, ka:

-R^{1A1} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₆alkilgrupa;

katrs -R^{1A4} ir neatkarīgi piesātināta C₃₋₆cikloalkilgrupa;

-L^{1A} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₃alkilēngrupa;

raksturīgs ar to, ka:

katrs -R^{1A4} ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{1B1} un/vai vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{1B2}; un katrs -R^{1A1} un -L^{1A} ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{1B2};

raksturīgs ar to, ka:

katrs -R^{1B1} ir neatkarīgi:

-R^{1D1}, -R^{1D2}, -R^{1D3}, -R^{1D4}, -R^{1D5}, -R^{1D6}, -R^{1D7}, -R^{1D8}, -L^{1D}-R^{1D4}, -L^{1D}-R^{1D5}, -L^{1D}-R^{1D6}, -L^{1D}-R^{1D7} vai -L^{1D}-R^{1D8};

katrs -R^{1B2} ir neatkarīgi:

-F, -Cl, -Br, -I,

-CF₃, -OCF₃,

-OH, -L^{1C}-OH, -O-L^{1C}-OH,

-OR^{1C1}, -L^{1C}-OR^{1C1}, -O-L^{1C}-OR^{1C1},

-SH, -SR^{1C1},

-CN,

-NO₂,

-NH₂, -NHR^{1C1}, -NR^{1C1}, -NR^{1C2}R^{1C3},

-L^{1C}-NH₂, -L^{1C}-NHR^{1C1}, -L^{1C}-NR^{1C1}, -L^{1C}-NR^{1C2}R^{1C3},

-O-L^{1C}-NH₂, -O-L^{1C}-NHR^{1C1}, -O-L^{1C}-NR^{1C1}, -O-L^{1C}-NR^{1C2}R^{1C3},

-C(=O)OH, -C(=O)OR^{1C1},

-C(=O)R^{1C1},

-C(=O)NH₂, -C(=O)NHR^{1C1}, -C(=O)NR^{1C1}, -C(=O)NR^{1C2}R^{1C3},

-NHC(=O)R^{1C1}, -NR^{1C1}C(=O)R^{1C1},

-NHC(=O)OR^{1C1}, -NR^{1C1}C(=O)OR^{1C1},

-OC(=O)NH₂, -OC(=O)NHR^{1C1}, -OC(=O)NR^{1C1}, -OC(=O)NR^{1C2}R^{1C3},

-NHC(=O)NH₂, -NHC(=O)NHR^{1C1},

-NHC(=O)NR^{1C1}, -NHC(=O)NR^{1C2}R^{1C3},

-NR^{1C1}C(=O)NH₂, -NR^{1C1}C(=O)NHR^{1C1},

-NR^{1C1}C(=O)NR^{1C1}, -NR^{1C1}C(=O)NR^{1C2}R^{1C3},

-NHS(=O)₂R^{1C1}, -NR^{1C1}S(=O)₂R^{1C1},

-S(=O)₂NH₂, -S(=O)₂NHR^{1C1}, -S(=O)₂NR^{1C1}, -S(=O)₂NR^{1C2}R^{1C3},

-S(=O)₂R^{1C1}, -S(=O)₂R^{1C1}, -OS(=O)₂R^{1C1} vai -S(=O)₂OR^{1C1};

raksturīgs ar to, ka:

katrs -L^{1C} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₅alkilēngrupa;

katrs -NR^{1C2}R^{1C3} ir neatkarīgi azetidīngrupa, pīrolidīngrupa, imidazolidīngrupa, pīrazolidīngrupa, pīperidīngrupa, pīperazīngrupa, morfolīngrupa, azepīngrupa vai diazepīngrupa, un ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākām grupām, kas ir izvēlētas no piesātinātām alifātiskām C₁₋₃alkilgrupām, -F, un -CF₃;

katrs -R^{1C1} ir neatkarīgi:

-R^{1D1}, -R^{1D2}, -R^{1D3}, -R^{1D4}, -R^{1D5}, -R^{1D6}, -R^{1D7}, -R^{1D8},

-L^{1D}-R^{1D4}, -L^{1D}-R^{1D5}, -L^{1D}-R^{1D6}, -L^{1D}-R^{1D7} vai -L^{1D}-R^{1D8};

katrs -R^{1D1} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₆alkilgrupa;

katrs -R^{1D2} ir neatkarīgi alifātiska C₂₋₆alkenilgrupa;

katrs -A^{1D3} ir neatkarīgi alifātiska C₂₋₆alkinilgrupa;

katrs -R^{1D4} ir neatkarīgi piesātināta C₃₋₆cikloalkilgrupa;

katrs -R^{1D5} ir neatkarīgi C₃₋₆cikloalkenilgrupa;

katrs -R^{1D6} ir neatkarīgi nearomātiska C₃₋₈heterociklilgrupa;

katrs -R^{1D7} ir neatkarīgi C₆₋₁₀karboarilgrupa;

katrs -R^{1D8} ir neatkarīgi C₅₋₁₀heteroarilgrupa;

katrs -L^{1D} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₃alkilēngrupa;

raksturīgs ar to, ka:

katrs -R^{1D4}, -R^{1D5}, -R^{1D6}, -R^{1D7}, un -R^{1D8} ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{1E1} un/vai vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{1E2},

katrs -R^{1D1}, -R^{1D2}, -R^{1D3}, un -L^{1D} ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{1E2}, un

raksturīgs ar to, ka:

katrs -R^{1E1} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₄alkilgrupa, fenilgrupa vai benzilgrupa;

katrs -R^{1E2} ir neatkarīgi:

-F, -Cl, -Br, -I,

-CF₃, -OCF₃,

-OH, -L^{1F}-OH, -O-L^{1F}-OH,

-OR^{1F1}, -L^{1F}-OR^{1F1}, -O-L^{1F}-OR^{1F1},

-SH, -SR^{1F1},

-CN,

-NO₂,

-NH₂, -NHR^{1F1}, -NR^{1F1}, -NR^{1F2}R^{1F3},

-L^{1F}-NH₂, -L^{1F}-NHR^{1F1}, -L^{1F}-NR^{1F1}, -L^{1F}-NR^{1F2}R^{1F3},

-C(=O)OH, -C(=O)OR^{1F1},

-C(=O)NH₂, -C(=O)NHR^{1F1}, -C(=O)NR^{1F1}₂ vai -C(=O)NR<sup>1F2R^{1F3}; raksturīgs ar to, ka:
 katrs -R^{1F1} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₄alkilgrupa, fenilgrupa vai benzilgrupa;
 katrs -L^{1F} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₅alkilēngrupa; un katrs -NR<sup>1F2R^{1F3} ir neatkarīgi azetidīngrupa, pīrolidīngrupa, imidazolidīngrupa, pirazolidīngrupa, piperidīngrupa, piperazīngrupa, morfolīngrupa, azepīngrupa vai diazepīngrupa, un ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākām grupām, kas ir izvēlētas no C₁₋₃alkilgrupām, -F, un -CF₃;
 raksturīgs ar to, ka:
 -R^{2A7} ir neatkarīgi fenilgrupa vai naftilgrupa; un
 -R^{2A8} ir neatkarīgi furanilgrupa, tienilgrupa, pirazolilgrupa, piridilgrupa, pirimidinilgrupa, 2,3-dihidro-benzofuranilgrupa, benzo[1,3]dioksolilgrupa, 2,3-dihidro-benzo[1,4]dioksinilgrupa, 3,4-dihidro-2H-benzo[b][1,4]dioksepinilgrupa vai 3,4-dihidro-2H-benzo[1,4]oksazinilgrupa;
 raksturīgs ar to, ka:
 -R^{2A7} un -R^{2A8} ir neobligāti aizvietoti ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{2B1} un/vai vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{2B2};
 raksturīgs ar to, ka:
 katrs -R^{2B1} ir neatkarīgi:
 -R^{2D1}, -R^{2D2}, -R^{2D3}, -R^{2D4}, -R^{2D5}, -R^{2D6}, -R^{2D7}, -R^{2D8},
 -L^{2D}, -R^{2D4}, -L^{2D}, -R^{2D5}, -L^{2D}, -R^{2D6}, -L^{2D}, -R^{2D7} vai -L^{2D}, -R^{2D8};
 katrs -R^{2B2} ir neatkarīgi:
 -F, -Cl, -Br, -I,
 -CF₃, -OCF₃,
 -OH, -L^{2C}, -OH, -O-L^{2C}, -OH,
 -OR^{2C1}, -L^{2C}, -OR^{2C1}, -O-L^{2C}, -OR^{2C1},
 -SH, -SR^{2C1},
 -CN,
 -NO₂,
 -NH₂, -NHR^{2C1}, -NR^{2C1}, -NR<sup>2C2R^{2C3},
 -L^{2C}, -NH₂, -L^{2C}, -NHR^{2C1}, -L^{2C}, -NR^{2C1}, -L^{2C}, -NR<sup>2C2R^{2C3},
 -O-L^{2C}, -NH₂, -O-L^{2C}, -NHR^{2C1}, -O-L^{2C}, -NR^{2C1}, -O-L^{2C}, -NR<sup>2C2R^{2C3},
 -C(=O)OH, -C(=O)OR^{2C1},
 -C(=O)R^{2C1},
 -C(=O)NH₂, -C(=O)NHR^{2C1}, -C(=O)NR^{2C1}, -C(=O)NR<sup>2C2R^{2C3},
 -NHC(=O)R^{2C1}, -NR^{2C1}C(=O)R^{2C1},
 -NHC(=O)OR^{2C1}, -NR^{2C1}C(=O)OR^{2C1},
 -OC(=O)NH₂, -OC(=O)NHR^{2C1}, -OC(=O)NR^{2C1}, -OC(=O)NR<sup>2C2R^{2C3},
 -NHC(=O)NH₂, -NHC(=O)NHR^{2C1},
 -NHC(=O)NR^{2C1}, -NHC(=O)NR<sup>2C2R^{2C3},
 -NR^{2C1}C(=O)NH₂, -NR^{2C1}C(=O)NHR^{2C1},
 -NR^{2C1}C(=O)NR^{2C1}, -NR^{2C1}C(=O)NR<sup>2C2R^{2C3},
 -NHS(=O)₂R^{2C1}, -NR^{2C1}S(=O)₂R^{2C1},
 -S(=O)₂NH₂, -S(=O)₂NHR^{2C1}, -S(=O)₂NR^{2C1}, -S(=O)₂NR<sup>2C2R^{2C3},
 -S(=O)₂R^{2C1}, -S(=O)₂R^{2C1}, -OS(=O)₂R^{2C1} vai -S(=O)₂OR^{2C1};
 raksturīgs ar to, ka:
 katrs -L^{2C} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₅alkilēngrupa;
 katrs -NR<sup>2C2R^{2C3} ir neatkarīgi azetidīngrupa, pīrolidīngrupa, imidazolidīngrupa, pirazolidīngrupa, piperidīngrupa, piperazīngrupa, morfolīngrupa, azepīngrupa vai diazepīngrupa, un ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākām grupām, kas ir izvēlētas no piesātinātām alifātiskām C₁₋₃alkilgrupām, -F, un -CF₃;
 katrs -R^{2C1} ir neatkarīgi:
 -R^{2D1}, -R^{2D2}, -R^{2D3}, -R^{2D4}, -R^{2D5}, -R^{2D6}, -R^{2D7}, -R^{2D8},
 -L^{2D}, -R^{2D4}, -L^{2D}, -R^{2D5}, -L^{2D}, -R^{2D6}, -L^{2D}, -R^{2D7} vai -L^{2D}, -R^{2D8};
 katrs -R^{2D1} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₆alkilgrupa;
 katrs -R^{2D2} ir neatkarīgi alifātiska C₂₋₆alkenilgrupa;
 katrs -R^{2D3} ir neatkarīgi alifātiska C₂₋₆alkinilgrupa;
 katrs -R^{2D4} ir neatkarīgi piesātināta C₃₋₆cikloalkilgrupa;
 katrs -R^{2D5} ir neatkarīgi C₃₋₆cikloalkenilgrupa;
 katrs -R^{2D6} ir neatkarīgi nearomātiska C₃₋₈heterociklilgrupa;
 katrs -R^{2D7} ir neatkarīgi C₆₋₁₀karboarilgrupa;
 katrs -R^{2D8} ir neatkarīgi C₅₋₁₀heteroarilgrupa;
 katrs -L^{2D} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₃alkilēngrupa;
 raksturīgs ar to, ka:
 katrs -R^{2D4}, -R^{2D5}, -R^{2D6}, -R^{2D7}, un -R^{2D8} ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{2E1} un/vai vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{2E2};
 katrs -R^{2D1}, -R^{2D2}, -R^{2D3}, un -L^{2D} ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem -R^{2E2}, un
 raksturīgs ar to, ka:</sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup></sup>

katrs -R^{2E1} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₄alkilgrupa, fenilgrupa vai benzilgrupa;
 katrs -R^{2E2} ir neatkarīgi:
 -F, -Cl, -Br, -I,
 -CF₃, -OCF₃,
 -OH, -L^{2F}, -OH, -O-L^{2F}, -OH,
 -OR^{2F1}, -L^{2F}, -OR^{2F1}, -O-L^{2F}, -OR^{2F1},
 -SH, -SR^{2F1},
 -CN,
 -NO₂,
 -NH₂, -NHR^{2F1}, -NR^{2F1}, -NR<sup>2F2R^{2F3},
 -L^{2F}, -NH₂, -L^{2F}, -NHR^{2F1}, -L^{2F}, -NR^{2F1}, -L^{2F}, -NR<sup>2F2R^{2F3},
 -C(=O)OH, -C(=O)OR^{2F1},
 -C(=O)NH₂, -C(=O)NHR^{2F1}, -C(=O)NR^{2F1}, -C(=O)NR<sup>2F2R^{2F3};
 raksturīgs ar to, ka:
 katrs -R^{2E1} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₄alkilgrupa, fenilgrupa vai benzilgrupa;
 katrs -L^{2F} ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C₁₋₅alkilēngrupa; un katrs -NR<sup>2F2R^{2F3} ir neatkarīgi azetidīngrupa, pīrolidīngrupa, imidazolidīngrupa, pirazolidīngrupa, piperidīngrupa, piperazīngrupa, morfolīngrupa, azepīngrupa vai diazepīngrupa, un ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākām grupām, kas ir izvēlētas no C₁₋₃alkilgrupām, -F, un -CF₃;
 ar nosacījumu, kas šis savienojums nav savienojums, kas ir izvēlēts no šādiem savienojumiem:
 ciklopropānkarbonskābes (5-fenil-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il)-amīds (PP-001) (WW-001);
 ciklopropānkarbonskābes [5-(3-acetilamīn-fenil)-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il]-amīds (PP-002) (WW-002);
 ciklopropānkarbonskābes {5-[4-(4-metil-piperazin-1-il)-fenil]-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il}-amīds (PP-003) (WW-003);
 ciklopropānkarbonskābes [5-(3-hlor-fenil)-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il]-amīds (PP-004) (WW-004);
 ciklopropānkarbonskābes [5-(4-metoksi-fenil)-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il]-amīds (PP-005) (WW-005);
 ciklopropānkarbonskābes [5-(6-metoksi-piridin-3-il)-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il]-amīds (PP-006) (WW-006);
 ciklopropānkarbonskābes [5-(3-fluor-fenil)-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il]-amīds (PP-007) (WW-007);
 ciklopropānkarbonskābes [5-(4-hidroksi-3,5-dimetil-fenil)-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il]-amīds (PP-008) (WW-008);
 4-[2-(ciklopropānkarbonil-amīn)-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-5-il]-N-(2-dimetilamīn-etil)-benzamīds (PP-009) (WW-009);
 ciklopropānkarbonskābes [5-(2,4-dimetoksi-fenil)-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il]-amīds (PP-010) (WW-010);
 ciklopropānkarbonskābes [5-(3-metānsulfonilamīn-fenil)-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il]-amīds (PP-011) (WW-011);
 ciklopropānkarbonskābes [5-(2-dimetilamīn-fenil)-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il]-amīds (PP-012);
 ciklopropānkarbonskābes [5-(3-hlor-4-fluor-fenil)-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il]-amīds (PP-013);
 ciklopropānkarbonskābes [5-(3-trifluormetoksi-fenil)-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il]-amīds (PP-014);
 ciklopropānkarbonskābes [5-((E)-stiril)-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il]-amīds (PP-015);
 ciklopropānkarbonskābes (5-tiofen-3-il-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il)-amīds (PP-016);
 3-cikloheksil-N-[5-(4-hidroksi-3,5-dimetil-fenil)-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il]-propionamīds (PP-017);
 cikloheksānkarbonskābes (5-tiofen-3-il-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il)-amīds (PP-018);
 3-metoksi-N-(5-tiofen-3-il-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il)-propionamīds (PP-021);
 4-[2-(ciklopropānkarbonil-amīn)-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-5-il]-N-(2-hidroksi-etil)-benzamīds (PP-022); un
 ciklopropānkarbonskābes (5-furan-3-il-[1,2,4]triazol[1,5-a]piridin-2-il)-amīds (PP-023).
 12. Savienojums saskaņā ar 11. pretenziju, raksturīgs ar to, ka -R^{WA2} ir neatkarīgi -R^{1A1}.
 13. Savienojums saskaņā ar 11. pretenziju, raksturīgs ar to, ka -R^{WA2} ir neatkarīgi -R^{1A4}.
 14. Savienojums saskaņā ar 11. pretenziju, raksturīgs ar to, ka -R^{WA2} ir neatkarīgi -L^{1A}-R^{1A4}.
 15. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 14. pretenzijai,</sup></sup></sup></sup>

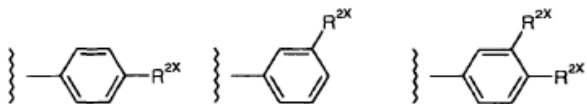
raksturīgs ar to, ka $-Q^{5A}$ ir neatkarīgi $-R^{2A7}$.

16. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 14. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka $-Q^{5A}$ ir neatkarīgi $-R^{2A8}$.

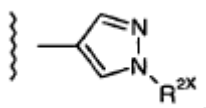
17. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 14. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka $-Q^{5A}$ ir neatkarīgi $-NHR^{2C1}$.

18. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 17. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka katrs $-R^{1A4}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi piesātināta C_3 cikloalkilgrupa.

19. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 18. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka $-R^{2A7}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi izvēlēts no grupām ar sekojošām formulām, kur katrs $-R^{2X}$ ir neatkarīgi $-R^{2B1}$ vai $-R^{2B2}$:



20. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 19. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka $-R^{2A8}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi izvēlēts no grupas ar sekojošo formulu, kur katrs $-R^{2X}$ ir neatkarīgi $-R^{2B1}$ vai $-R^{2B2}$:



21. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 19. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka $-R^{2A8}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi 2,3-dihidro-benzo[1,4]dioksin-6-il un ir neobligāti aizvietots.

22. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 21. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka:

katrs $-R^{1B1}$ ir neatkarīgi:

$-R^{1D1}$, $-R^{1D2}$, $-R^{1D4}$, $-R^{1D7}$, $-R^{1D8}$, $-L^{1D}-R^{1D4}$, $-L^{1D}-R^{1D6}$, $-L^{1D8}-R^{1D7}$ vai $-L^{1D}-R^{1D8}$;

katrs $-R^{1B2}$ ir neatkarīgi:

$-F$, $-Cl$,

$-CF_3$, $-OCF_3$,

$-OH$, $-L^{1C}-OH$, $-O-L^{1C}-OH$,

$-OR^{1C1}$, $-L^{1C}-OR^{1C1}$, $-O-L^{1C}-OR^{1C1}$,

$-SR^{1C1}$,

$-CN$,

$-NO_2$,

$-NH_2$, $-NHR^{1C1}$, $-NR^{1C1}$, $-NA^{1C2R^{1C3}}$,

$-L^{1C}-NH_2$, $-L^{1C}-NHR^{1C1}$, $-L^{1C}-NR^{1C1}$, $-L^{1C}-NR^{1C2R^{1C3}}$,

$-O-L^{1C}-NH_2$, $-O-L^{1C}-NHR^{1C1}$, $-O-L^{1C}-NR^{1C1}$, $-O-L^{1C}-NR^{1C2R^{1C3}}$,

$-C(=O)R^{1C1}$,

$-C(=O)NHR^{1C1}$, $-C(=O)NR^{1C1}$, $-C(=O)NR^{1C2R^{1C3}}$,

$-NHC(=O)R^{1C1}$, $-NR^{1C1}C(=O)R^{1C1}$,

$-NHC(=O)NHR^{1C1}$,

$-NHC(=O)NR^{1C1}$, $-NHC(=O)NR^{1C2R^{1C3}}$,

$-NR^{1C1}C(=O)NHR^{1C1}$,

$-NR^{1C1}(=O)NR^{1C1}$, $-NR^{1C1}C(=O)NR^{1C2R^{1C3}}$,

$-NHS(=O)_2R^{1C1}$, $-NR^{1C1}S(=O)_2R^{1C1}$,

$-S(=O)_2NHR^{1C1}$, $-S(=O)_2NR^{1C1}$, $-S(=O)_2NR^{1C2R^{1C3}}$,

$-S(=O)R^{1C1}$ vai $-S(=O)_2R^{1C1}$;

katrs $-L^{1C}$ ir piesātināta alifātiska C_{1-3} alkilēngrupa;

katrs $-NR^{1C2R^{1C3}}$ ir neatkarīgi pirolidīngrupa, piperidīngrupa, piperazīngrupa vai morfolīngrupa, un ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākām grupām, kas ir izvēlētas no piesātinātām alifātiskām C_{1-3} alkilgrupām, $-F$, un $-CF_3$;

katrs $-R^{1C1}$ ir neatkarīgi: $-R^{1D1}$, $-R^{1D7}$, $-R^{1D8}$, $-L^{1D}-R^{1D7}$ vai $-L^{1D}-R^{1D8}$;

katrs $-L^{1D}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi $-CH_2-$;

katrs $-R^{1D1}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C_{1-3} alkilgrupa;

katrs $-R^{1D4}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi piesātināta C_{5-6} cikloalkilgrupa;

katrs $-R^{1D6}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi pirolidīngrupa, piperidīngrupa, piperazīngrupa, morfolīngrupa, tetrahidrofuranilgrupa vai tetrahidropiranilgrupa, un ir neobligāti aizvietots;

katrs $-R^{1D7}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi fenilgrupa vai naftilgrupa, un ir neobligāti aizvietots;

katrs $-R^{1D8}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi furanilgrupa, tienilgrupa, pirolilgrupa, imidazolilgrupa, pirazolilgrupa, triazolilgrupa, oksazolilgrupa, izoksazolilgrupa, tiazolilgrupa, izotiazolilgrupa, piridilgrupa, pirimidinilgrupa vai piridazinilgrupa, un ir neobligāti aizvietots; vai

katrs $-R^{1D8}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi benzofuranilgrupa, benzotienilgrupa, benzopirolilgrupa, benzoimidazolilgrupa, benzopirazolilgrupa, benzotriazolilgrupa, benzoksazolilgrupa, benzoizoksazolilgrupa, benzotiazolilgrupa, benzoizotiazolilgrupa, benzopiridilgrupa, benzopirimidinilgrupa vai benzopiridazinilgrupa, un ir neobligāti aizvietots; katrs $-R^{1E1}$ ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C_{1-4} alkilgrupa;

katrs $-R^{1E2}$ ir neatkarīgi:

$-F$, $-Cl$,

$-CF_3$, $-OCF_3$,

$-CN$,

$-OH$, $-L^{1F}-OH$, $-O-L^{1F}-OH$,

$-OR^{1F1}$, $-L^{1F}-OR^{1F1}$, $-O-L^{1F}-OR^{1F1}$,

$-NH_2$, $-NHR^{1F1}$, $-NR^{1F1}$, $-NR^{1F2R^{1F3}}$,

$-L^{1F}-NH_2$, $-L^{1F}-NHR^{1F1}$, $-L^{1F}-NR^{1F1}$, $-L^{1F}-NR^{1F2R^{1F3}}$,

$-C(=O)NHR^{1F1}$, $-C(=O)NR^{1F2}$ vai $-C(=O)NR^{1F2R^{1F3}}$;

katrs $-R^{1F1}$ ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C_{1-4} alkilgrupa;

katrs $-L^{1F}$ ir piesātināta alifātiska C_{1-3} alkilēngrupa; un

katrs $-NR^{1F2R^{1F3}}$ ir neatkarīgi pirolidīngrupa, piperidīngrupa, piperazīngrupa vai morfolīngrupa, un ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākām grupām, kas ir izvēlētas no C_{1-3} alkilgrupām, $-F$, un $-CF_3$.

23. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 22. pretenzijai, raksturīgs ar to, ka:

katrs $-R^{2B1}$ ir neatkarīgi:

$-R^{2D1}$, $-R^{2D2}$, $-R^{2D4}$, $-R^{2D7}$, $-R^{2D8}$, $-L^{2D}-R^{2D4}$, $-L^{2D}-R^{2D7}$ vai $-L^{2D}-R^{2D8}$;

katrs $-R^{2B2}$ ir neatkarīgi:

$-F$, $-Cl$,

$-CF_3$, $-OCF_3$,

$-OH$, $-L^{2C}-OH$, $-O-L^{2C}-OH$,

$-OR^{2C1}$, $-L^{2C}-OR^{2C1}$, $-O-L^{2C}-OR^{2C1}$,

$-SR^{2C1}$,

$-CN$,

$-NO_2$,

$-NH_2$, $-NHR^{2C1}$, $-NR^{2C1}$, $-NR^{2C2RR^{2C3}}$,

$-LR^{2C}-NH_2$, $-LR^{2C}-NHR^{2C1}$, $-L^{2C}-NRR^{2C1}$, $-LR^{2C}-NRR^{2C2R^{2C3}}$,

$-O-L^{2C}-NH_2$, $-O-LR^{2C}-NHR^{2C1}$, $-O-LR^{2C}-NRR^{2C1}$, $-O-LR^{2C}-NRR^{2C2R^{2C3}}$,

$-C(=O)R^{2C1}$,

$-C(=O)NH_2$, $-C(=O)NHR^{2C1}$, $-C(=O)NRR^{2C1}$, $-C(=O)NR^{2C2R^{2C3}}$,

$-NHC(=O)R^{2C1}$, $-NR^{2C1}C(=O)R^{2C1}$,

$-NHC(=O)NH_2$, $-NHC(=O)NHR^{2C1}$,

$-NHC(=O)NA^{2C1}$, $-NHC(=O)NR^{2C2R^{2C3}}$,

$-NA^{2C1}C(=O)NH_2$, $-NR^{2C1}C(=O)NHR^{2C1}$,

$-NR^{2C1}C(=O)NR^{2C1}$, $-NR^{2C1}C(=O)NR^{2C2R^{2C3}}$,

$-NHS(=O)_2R^{2C1}$, $-NR^{2C1}S(=O)_2R^{2C1}$,

$-S(=O)_2NH_2$, $-S(=O)_2NHR^{2C1}$, $-S(=O)_2NR^{2C1}$, $-S(=O)_2NR^{2C2R^{2C3}}$,

$-S(=O)R^{2C1}$ vai $-S(=O)_2R^{2C1}$;

katrs $-L^{2C}$ ir piesātināta alifātiska C_{1-3} alkilēngrupa;

katrs $-NR^{2C2R^{2C3}}$ ir neatkarīgi pirolidīngrupa, piperidīngrupa, piperazīngrupa vai morfolīngrupa, un ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākām grupām, kas ir izvēlētas no piesātinātām alifātiskām C_{1-3} alkilgrupām, $-F$, un $-CF_3$;

katrs $-R^{2D1}$, ir neatkarīgi: $-R^{2D7}$, $-R^{2D8}$, $-L^{2D}-R^{2D7}$ vai $-L^{2D}-R^{2D8}$;

katrs $-L^{2D}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi $-CH_2-$;

katrs $-R^{2D1}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C_{1-3} alkilgrupa;

katrs $-R^{2D4}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi piesātināta C_{5-6} cikloalkilgrupa;

katrs $-R^{2D6}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi pirolidīngrupa, piperidīngrupa, piperazīngrupa, morfolīngrupa, tetrahidrofuranilgrupa vai tetrahidropiranilgrupa, un ir neobligāti aizvietots;

katrs $-R^{2D7}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi fenilgrupa vai naftilgrupa, un ir neobligāti aizvietots;

katrs $-R^{2D8}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi furanilgrupa, tienilgrupa, pirolilgrupa, imidazolilgrupa, pirazolilgrupa, triazolilgrupa, oksazolilgrupa, izoksazolilgrupa, tiazolilgrupa, izotiazolilgrupa, piridilgrupa, pirimidinilgrupa vai piridazinilgrupa, un ir neobligāti aizvietots; vai

katrs $-R^{2D8}$, ja tāds ir, ir neatkarīgi benzofuranilgrupa, benzotienilgrupa, benzopirolilgrupa, benzoimidazolilgrupa, benzopirazolilgrupa, benzotriazolilgrupa, benzoksazolilgrupa, benzoizoksazolilgrupa, benzotiazolilgrupa, benzoizotiazolilgrupa, benzopiridilgrupa, benzopirimidinilgrupa,

vai benzopiridazinilgrupa, un ir neobligāti aizvietots;

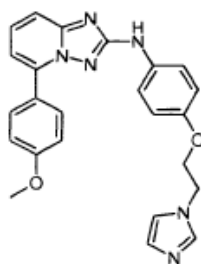
katrs $-R^{2E1}$ ir neatkarīgi piesātināta alifātiska C_{1-4} alkilgrupa;

katrs $-R^{2E2}$ ir neatkarīgi:

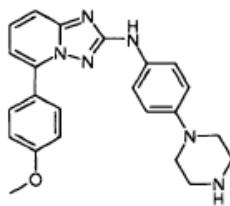
$-F$, $-Cl$,

$-CF_3$, $-OCF_3$,

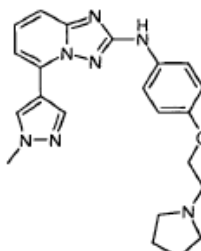
$-OH$, $-L^{2F}-OH$, $-O-L^{2F}-OH$,



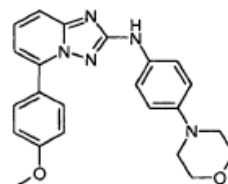
XX-016



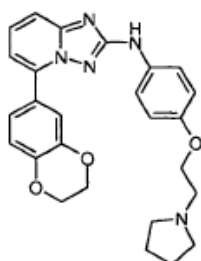
XX-023



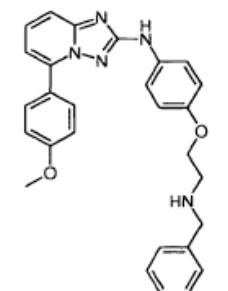
XX-017



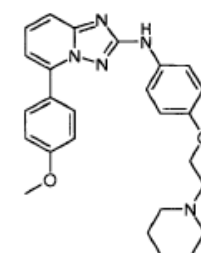
XX-024



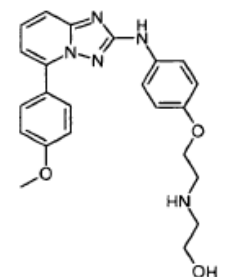
XX-018



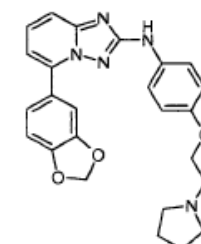
XX-025



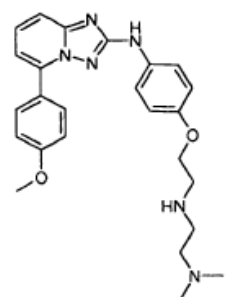
XX-019



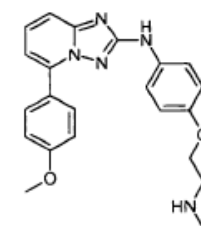
XX-026



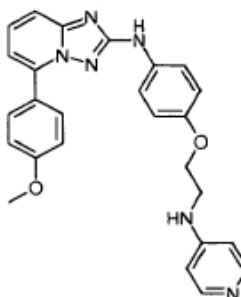
XX-021



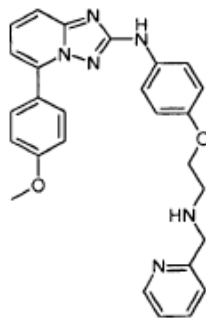
XX-027



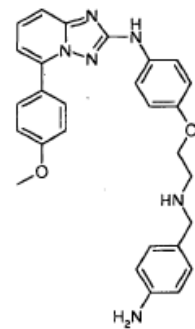
XX-022



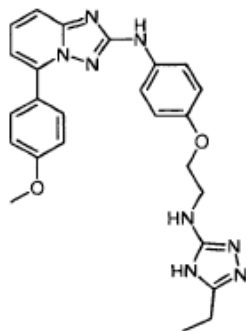
XX-028



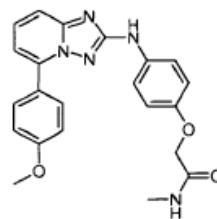
XX-029



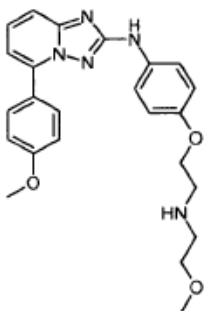
XX-034



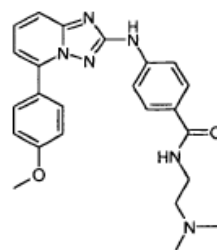
XX-030



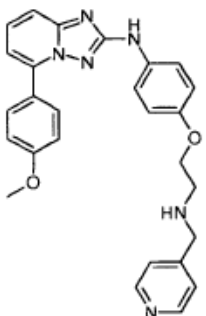
XX-035



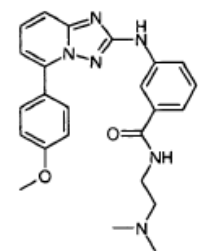
XX-031



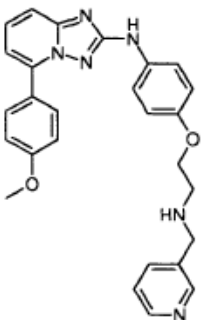
XX-036



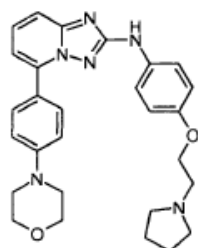
XX-032



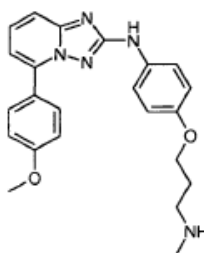
XX-037



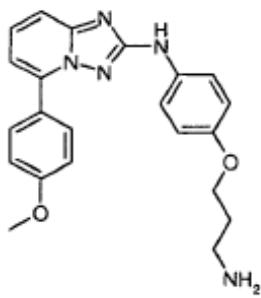
XX-033



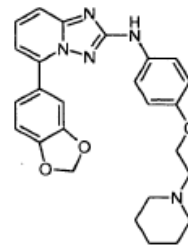
XX-038



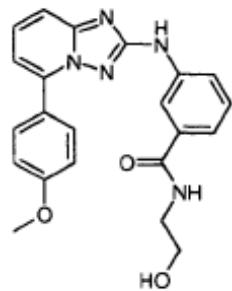
XX-040



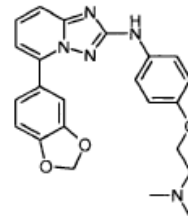
XX-041



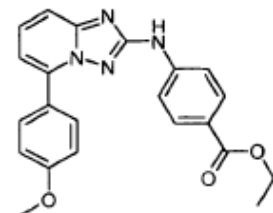
XX-047



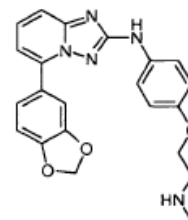
XX-042



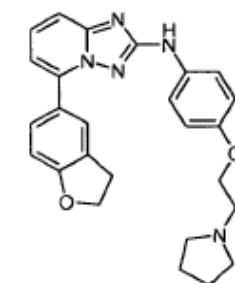
XX-048



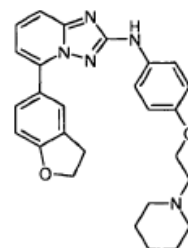
XX-043



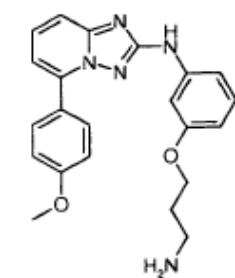
XX-049



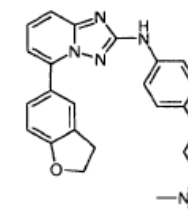
XX-044



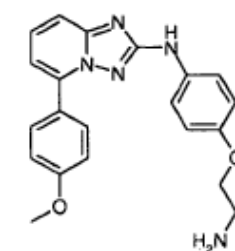
XX-052



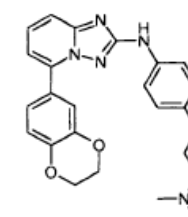
XX-045



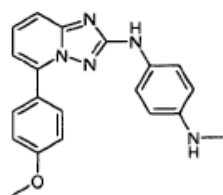
XX-053



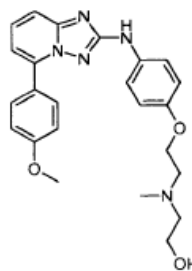
XX-046



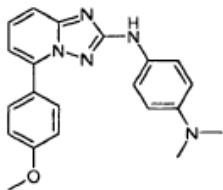
XX-055



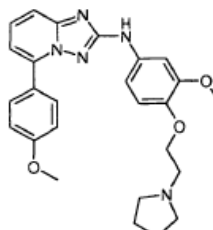
XX-056



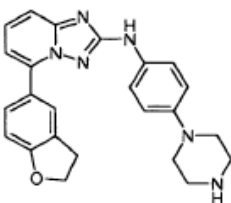
XX-065



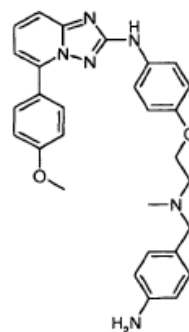
XX-057



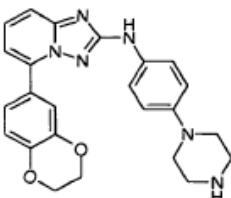
XX-066



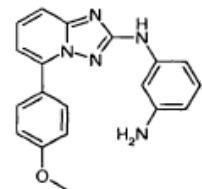
XX-059



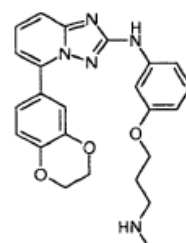
XX-067



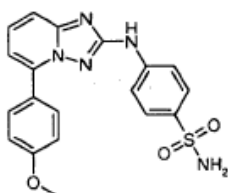
XX-060



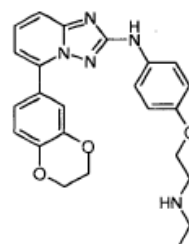
XX-061



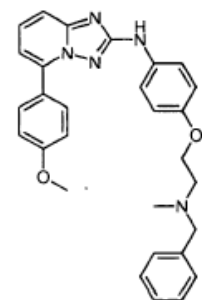
XX-069



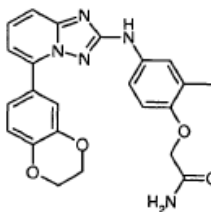
XX-063



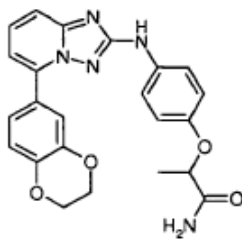
XX-070



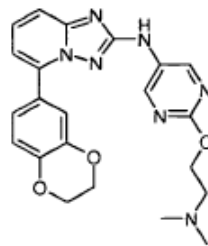
XX-064



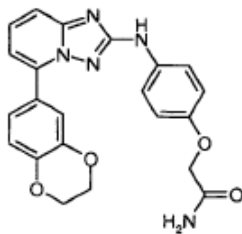
XX-071



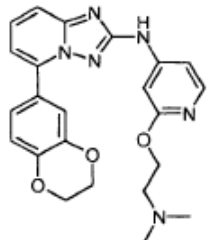
XX-072



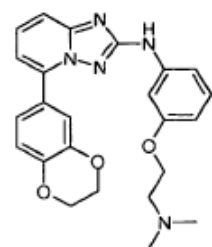
XX-078



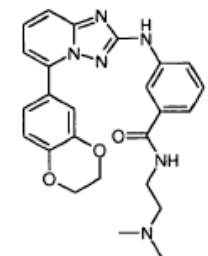
XX-073



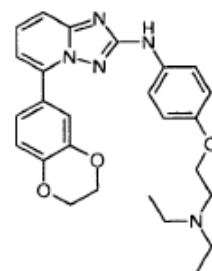
XX-079



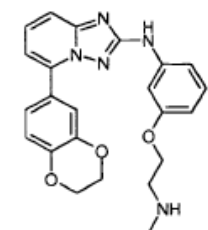
XX-074



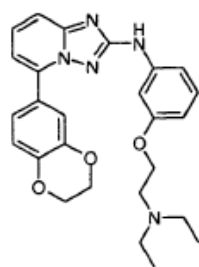
XX-080



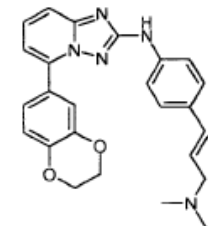
XX-075



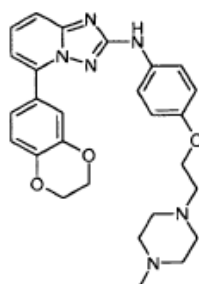
XX-081



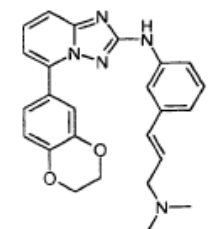
XX-076



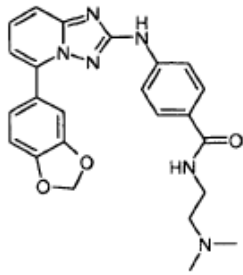
XX-082



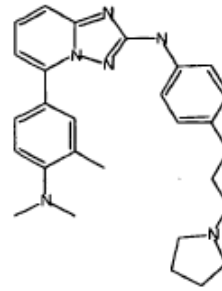
XX-077



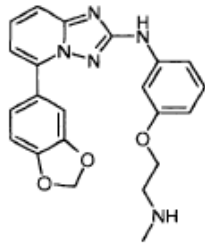
XX-083



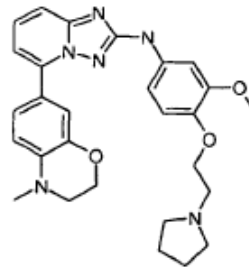
XX-087



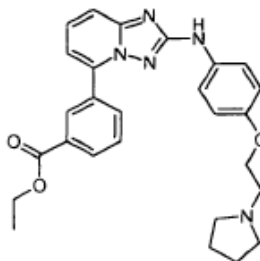
XX-094



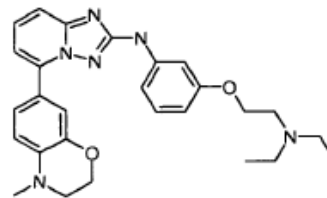
XX-088



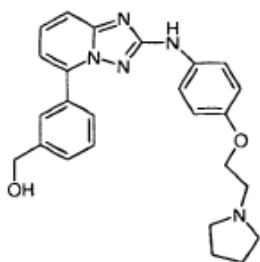
XX-095



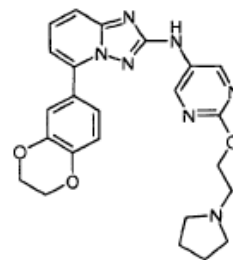
XX-089



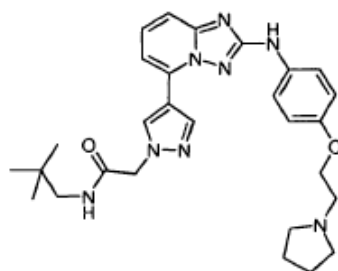
XX-096



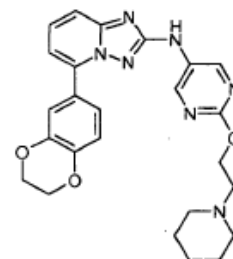
XX-090



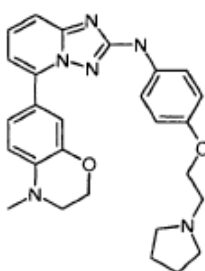
XX-097



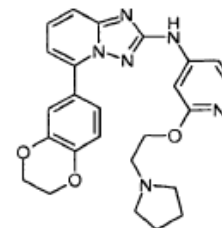
XX-092



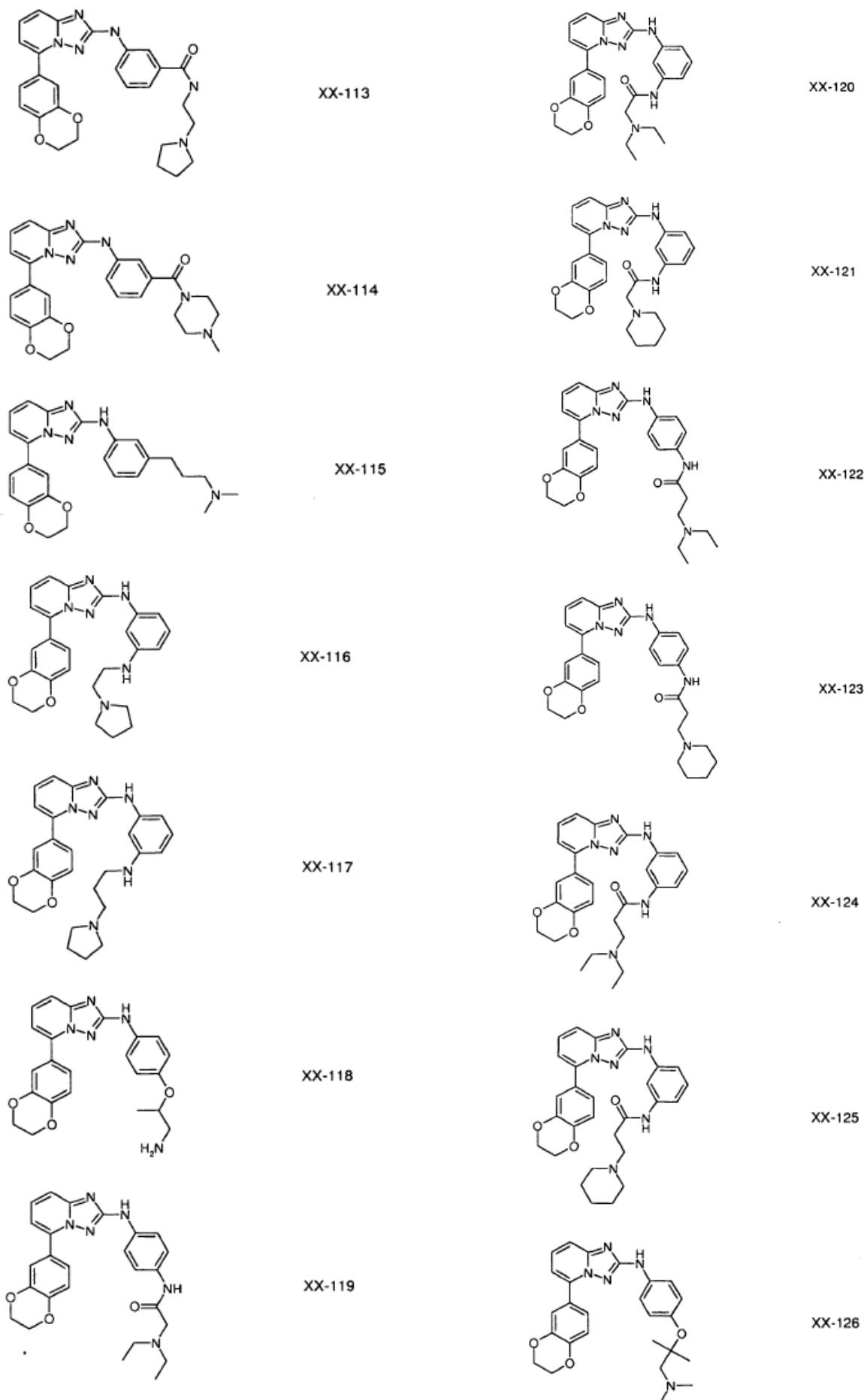
XX-098

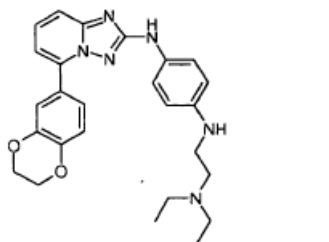


XX-093

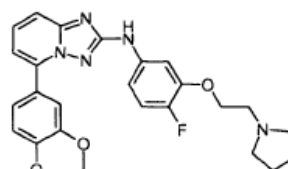


XX-099

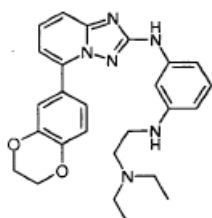




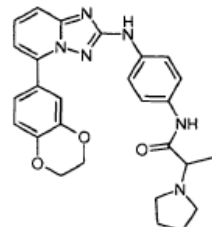
XX-127



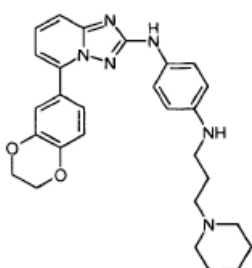
XX-134



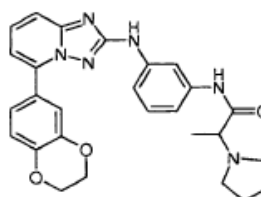
XX-128



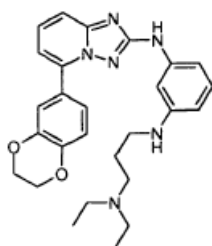
XX-135



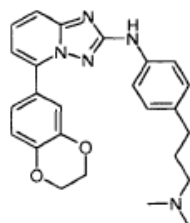
XX-129



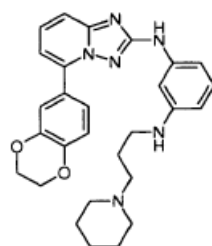
XX-136



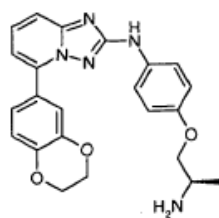
XX-130



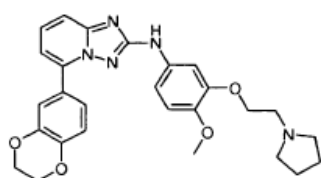
XX-137



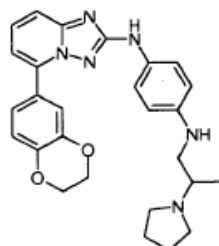
XX-131



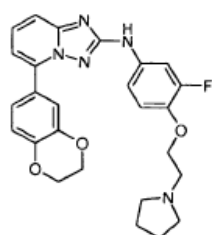
XX-138



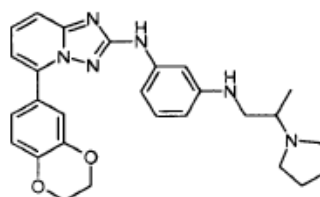
XX-132



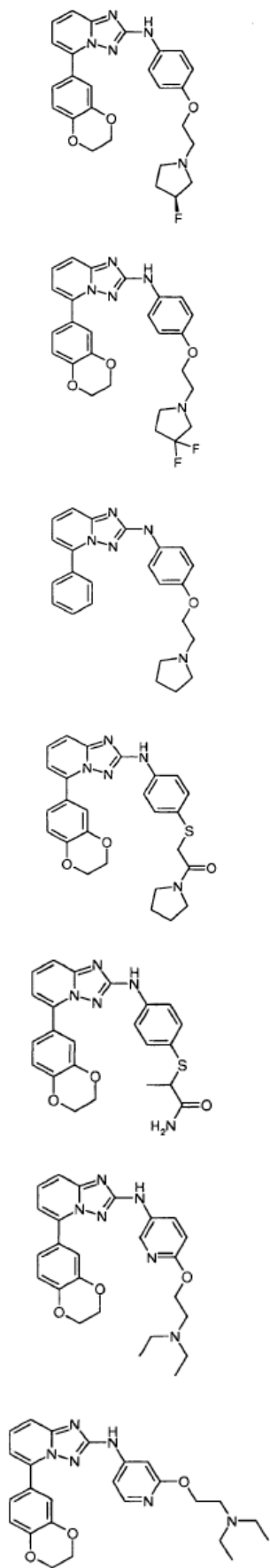
XX-139



XX-133



XX-140



XX-157

XX-158

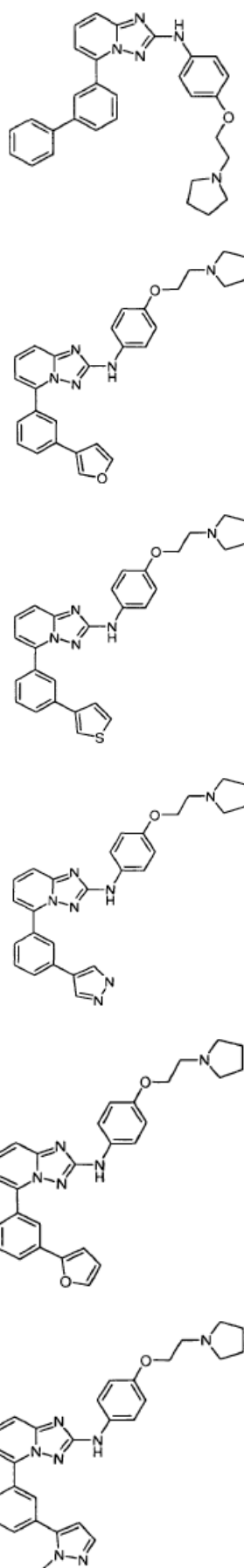
XX-159

XX-160

XX-161

XX-162

XX-163



XX-164

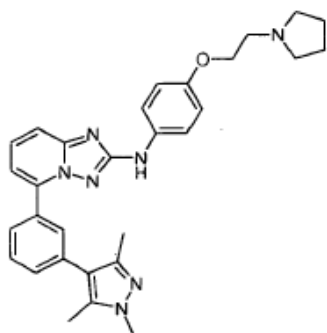
XX-165

XX-166

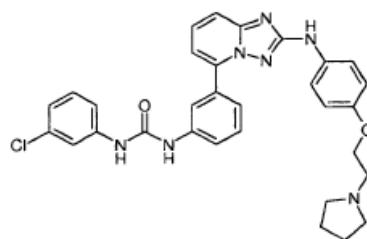
XX-167

XX-168

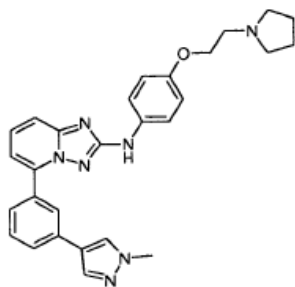
XX-169



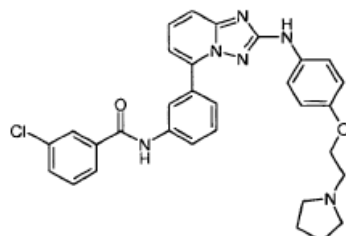
XX-170



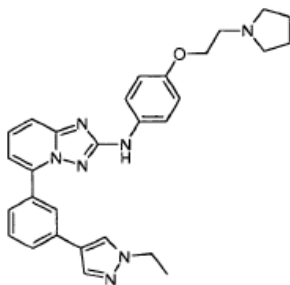
XX-176



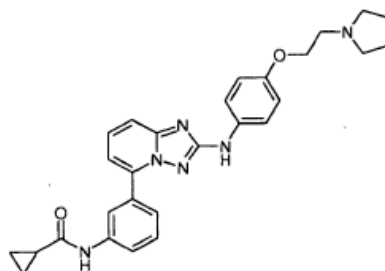
XX-171



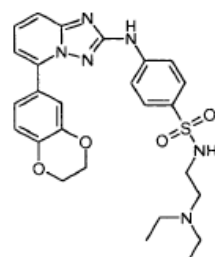
XX-177



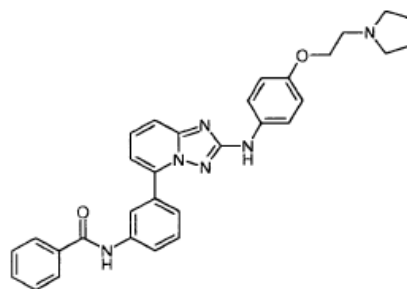
XX-172



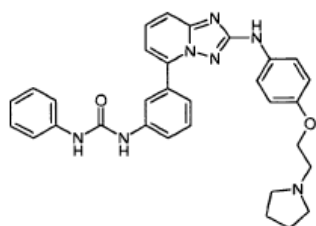
XX-178



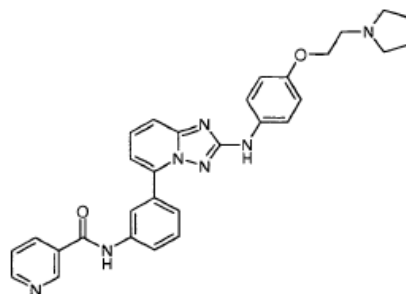
XX-173



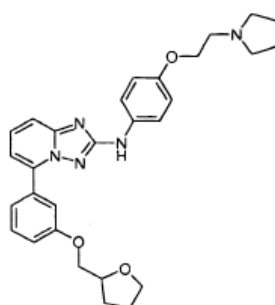
XX-179



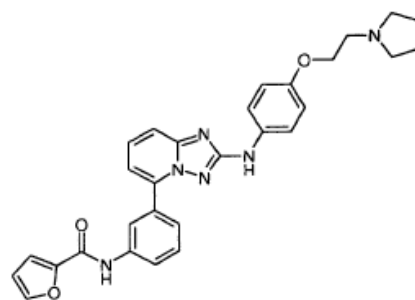
XX-174



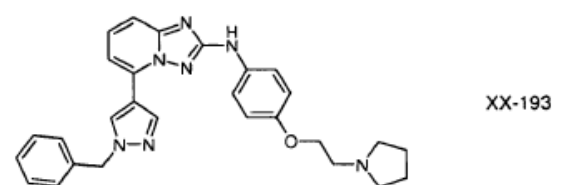
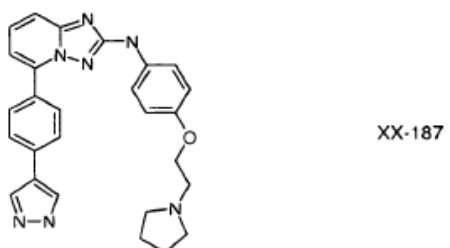
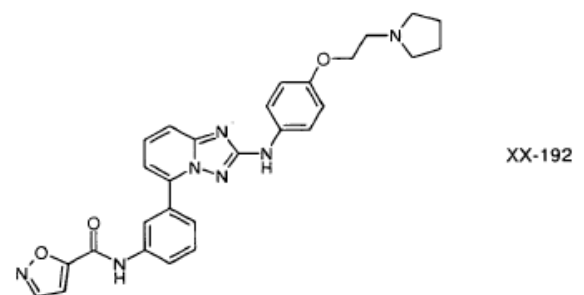
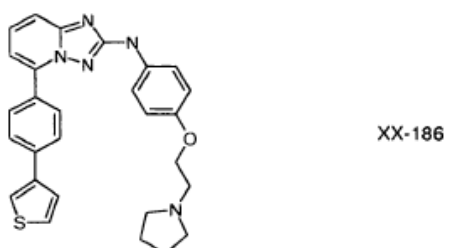
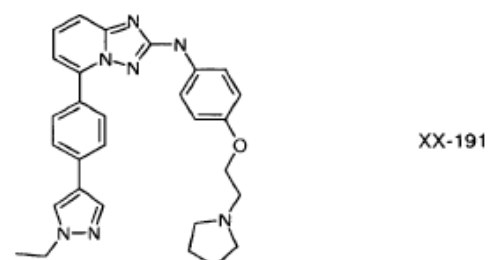
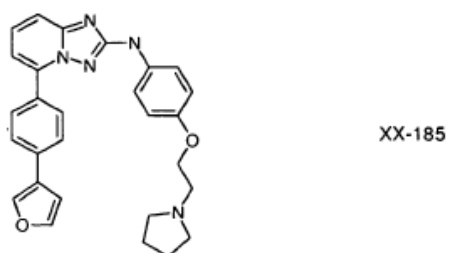
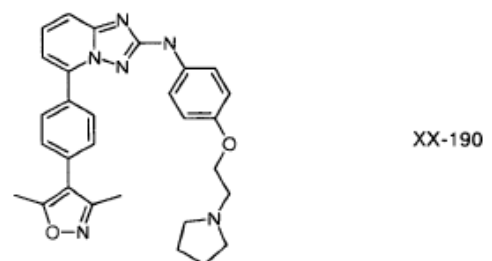
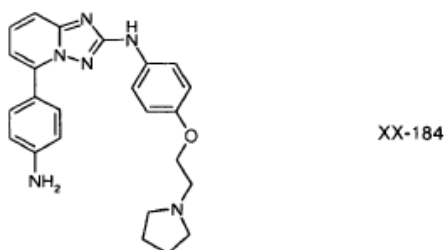
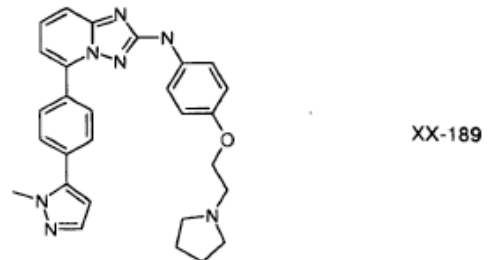
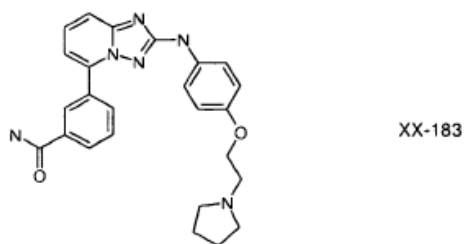
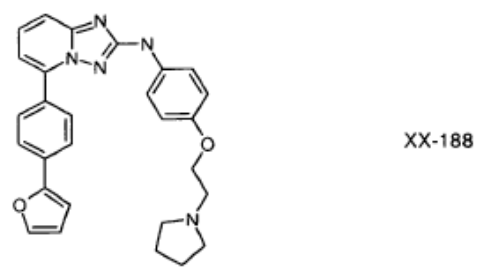
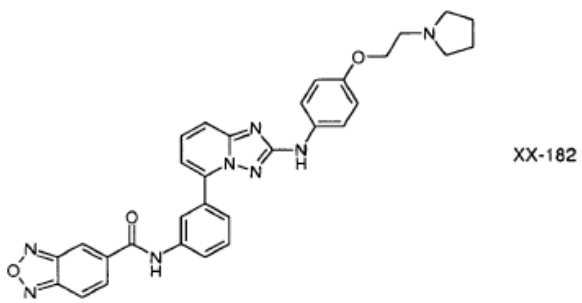
XX-180

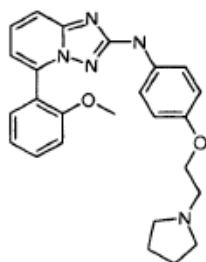


XX-175

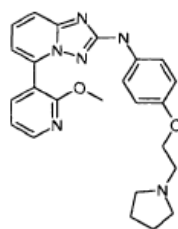


XX-181

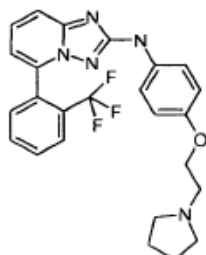




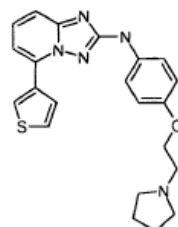
XX-194



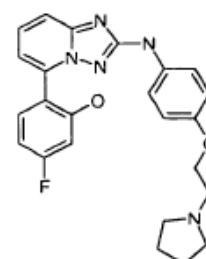
XX-200



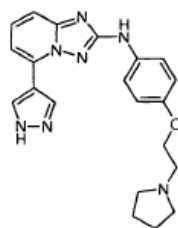
XX-195



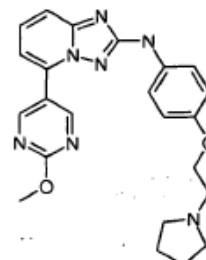
XX-201



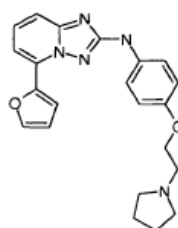
XX-196



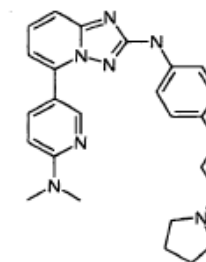
XX-202



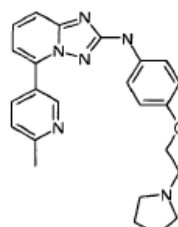
XX-197



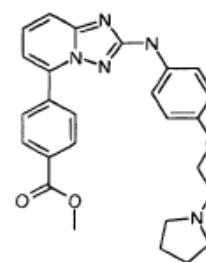
XX-203



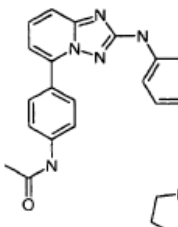
XX-198



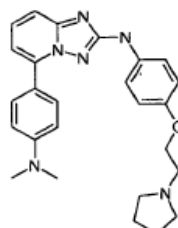
XX-204



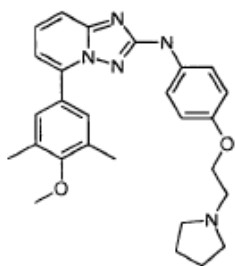
XX-199



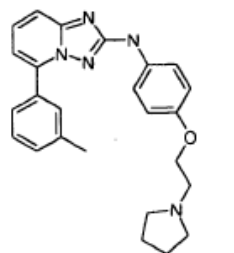
XX-205



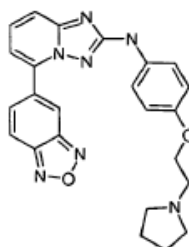
XX-206



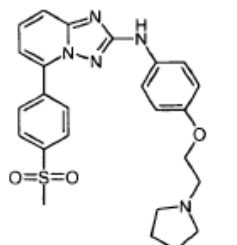
XX-207



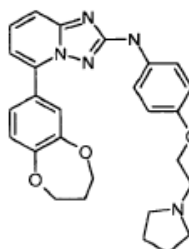
XX-213



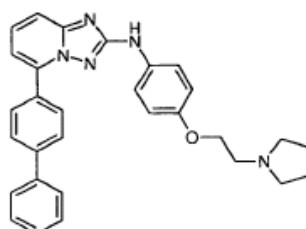
XX-208



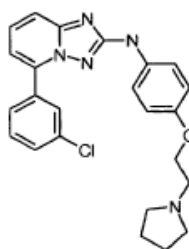
XX-215



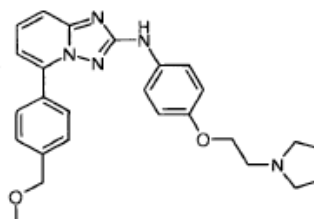
XX-209



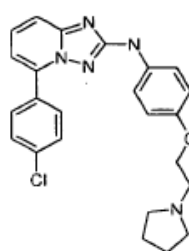
XX-216



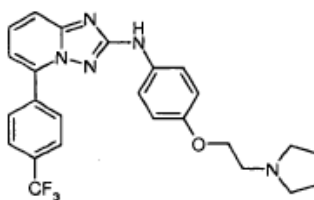
XX-210



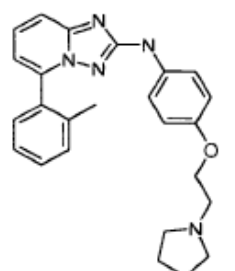
XX-217



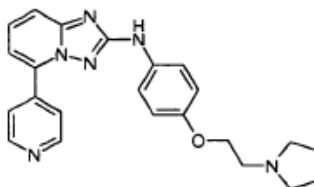
XX-211



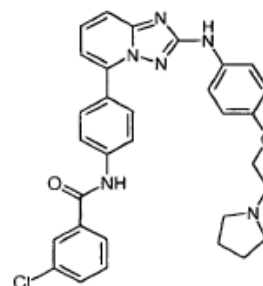
XX-218



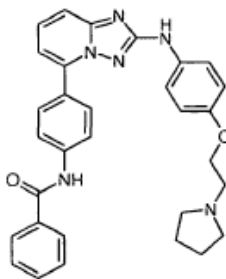
XX-212



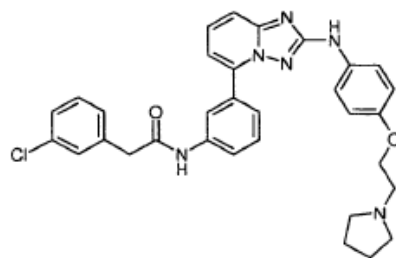
XX-219



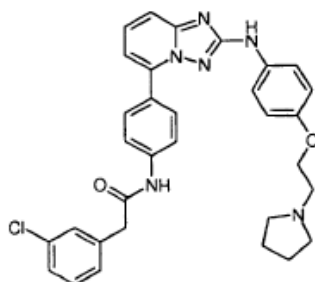
XX-220



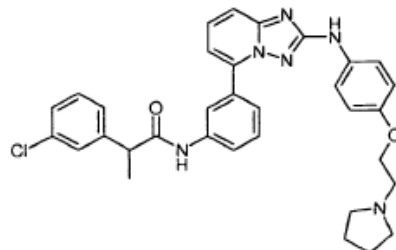
XX-221



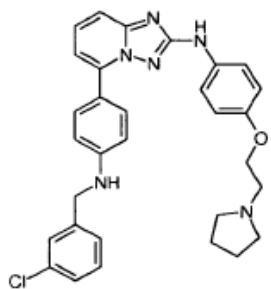
XX-227



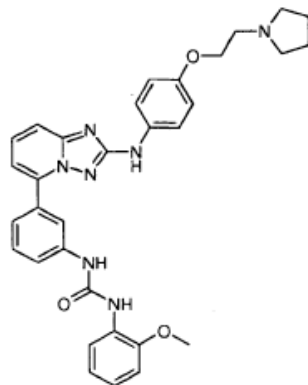
XX-222



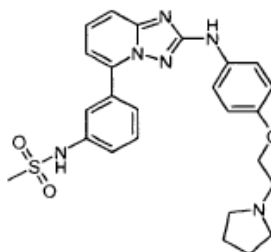
XX-228



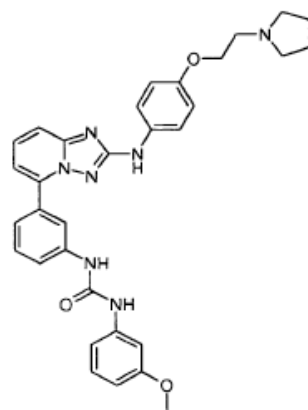
XX-223



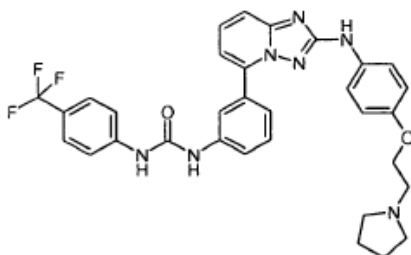
XX-229



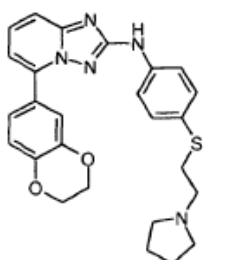
XX-224



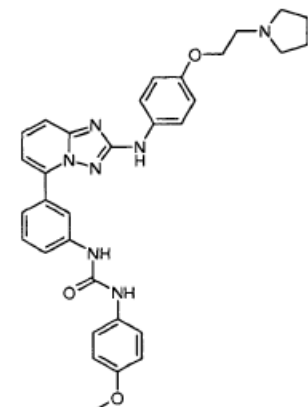
XX-230



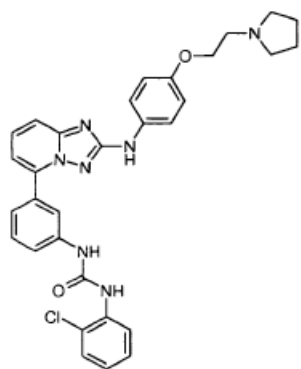
XX-225



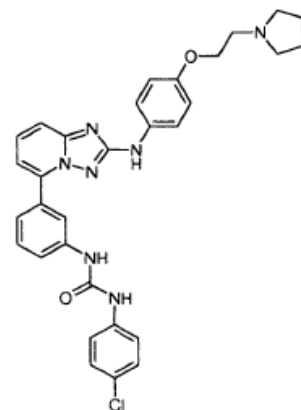
XX-226



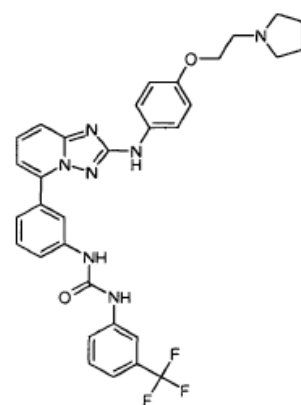
XX-231



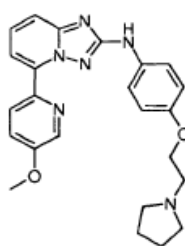
XX-232



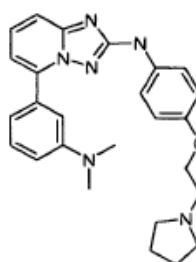
XX-233



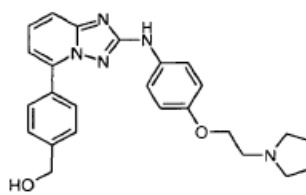
XX-234



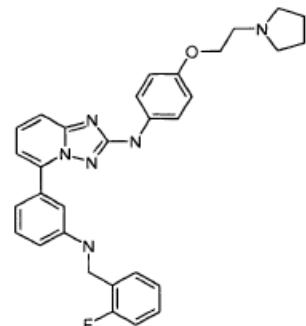
XX-235



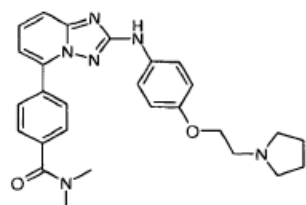
XX-236



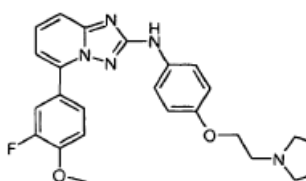
XX-237



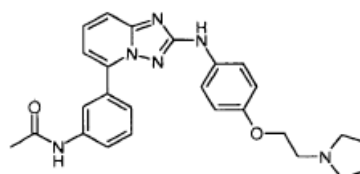
XX-238



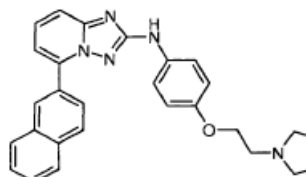
XX-239



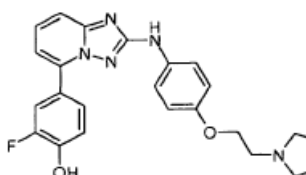
XX-240



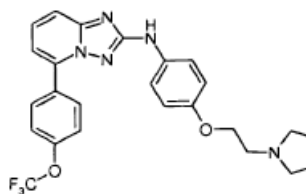
XX-241



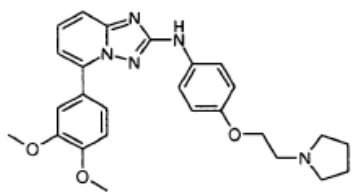
XX-242



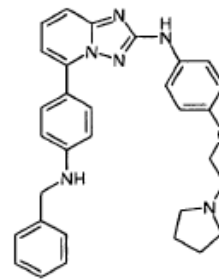
XX-243



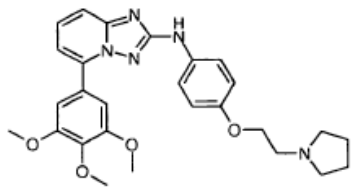
XX-244



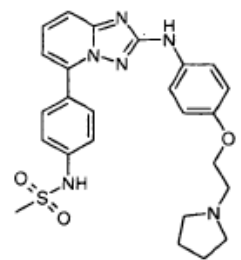
XX-245



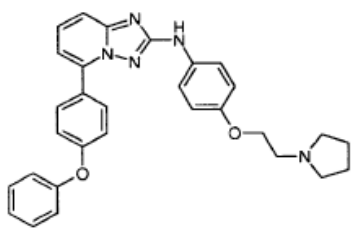
XX-252



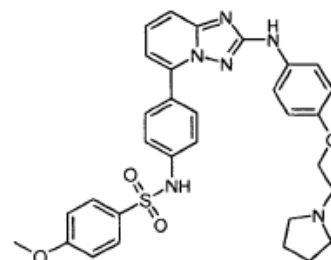
XX-246



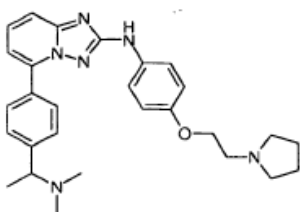
XX-253



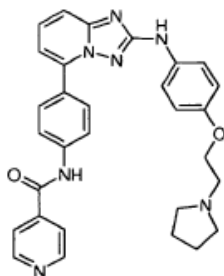
XX-247



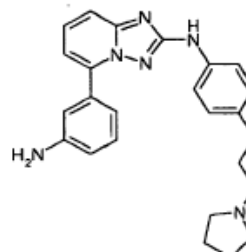
XX-254



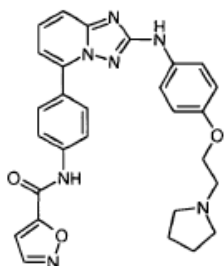
XX-248



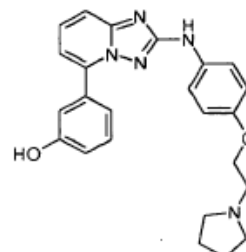
XX-249



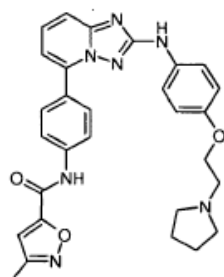
XX-255



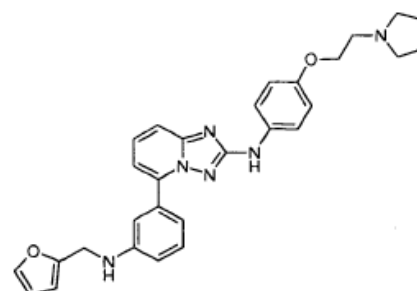
XX-250



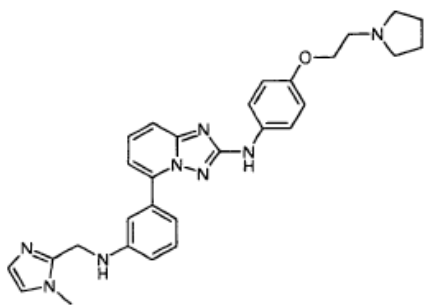
XX-256



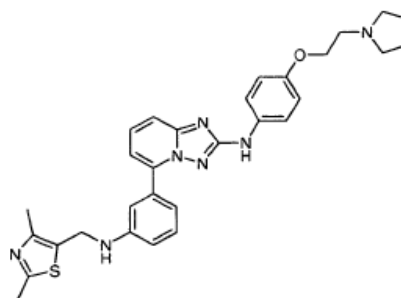
XX-251



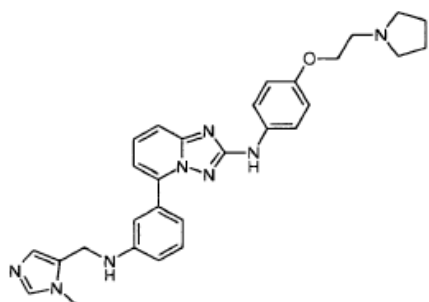
XX-257



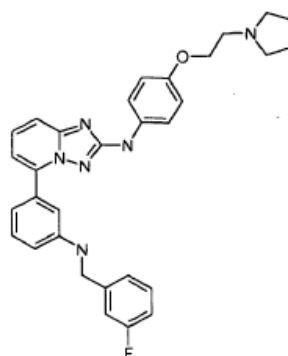
XX-258



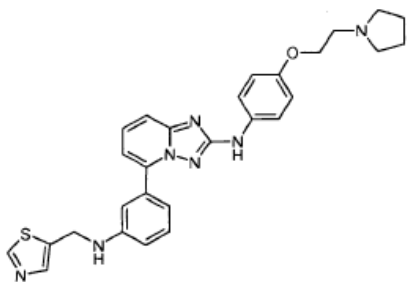
XX-263



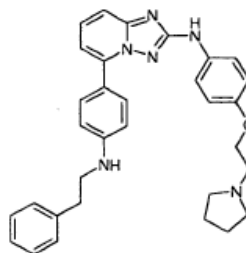
XX-259



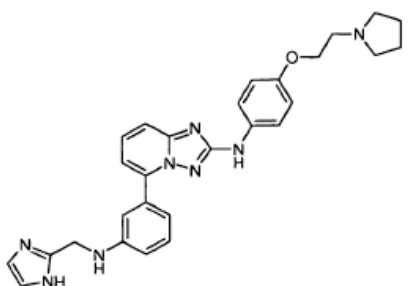
XX-264



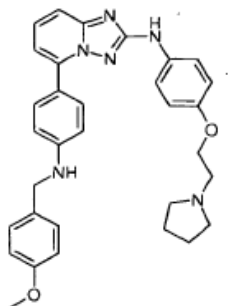
XX-260



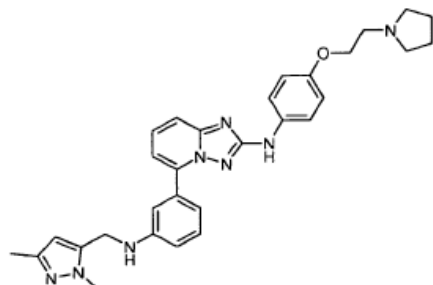
XX-265



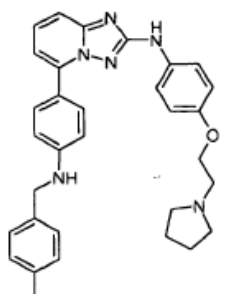
XX-261



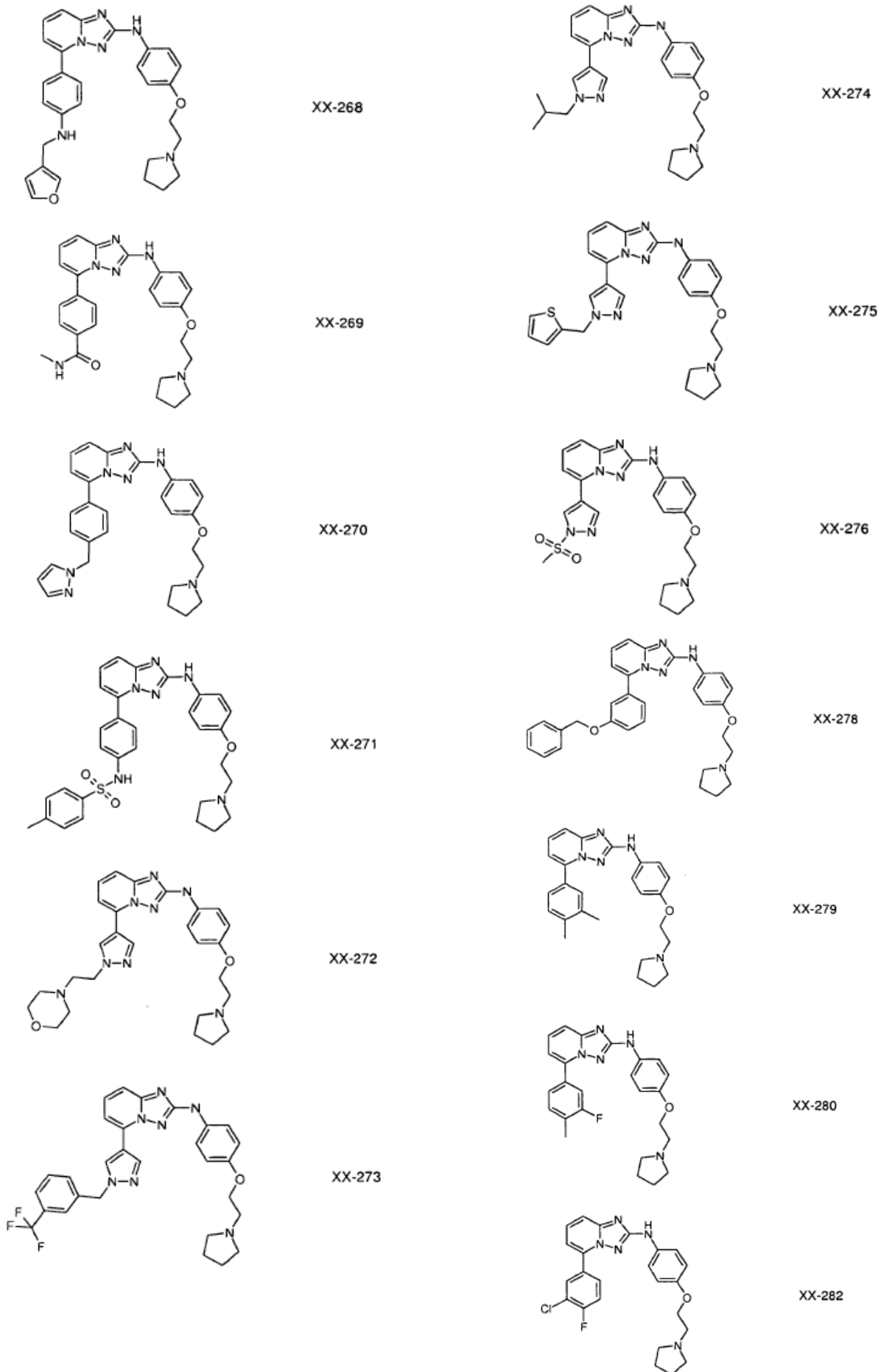
XX-266

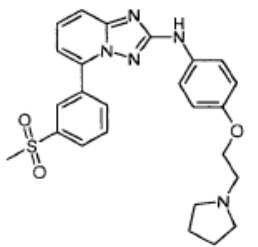


XX-262

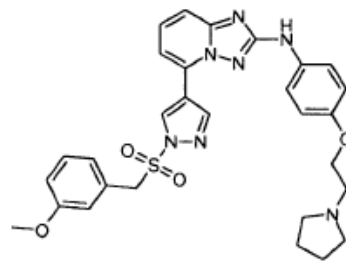


XX-267

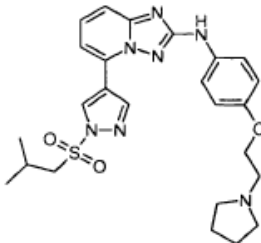




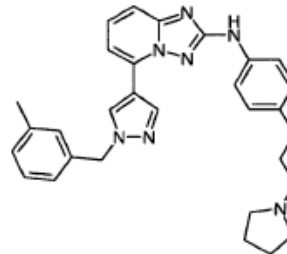
XX-283



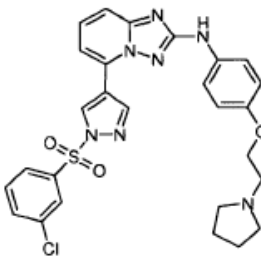
XX-289



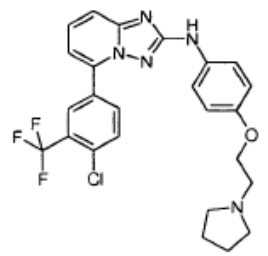
XX-284



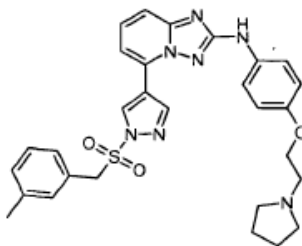
XX-290



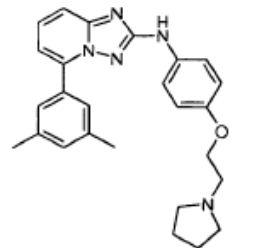
XX-285



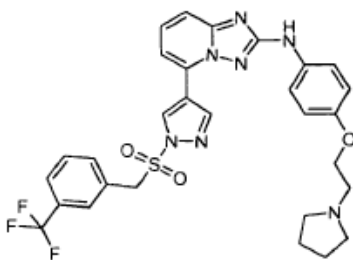
XX-291



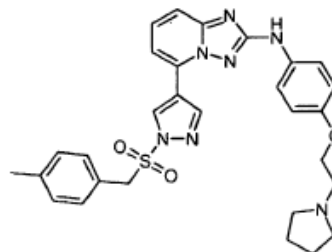
XX-286



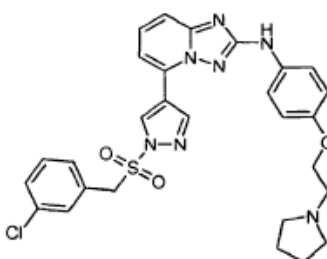
XX-292



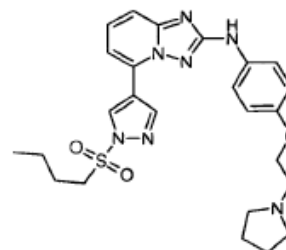
XX-287



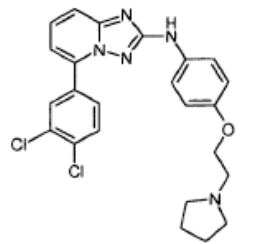
XX-295



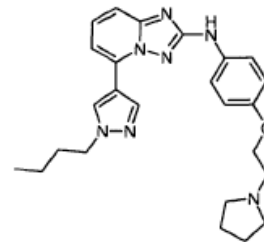
XX-288



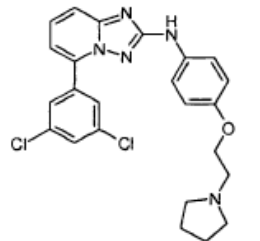
XX-296



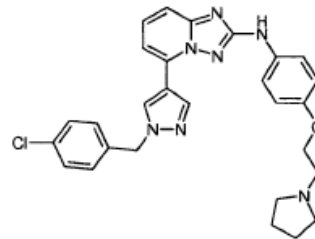
XX-297



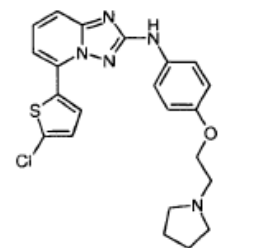
XX-303



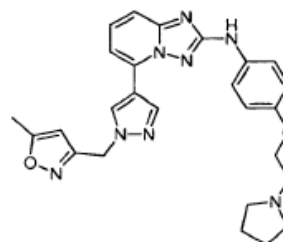
XX-298



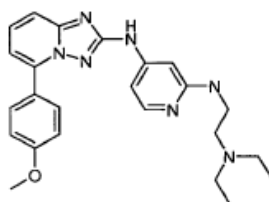
XX-304



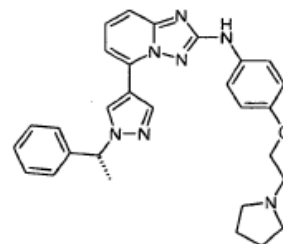
XX-299



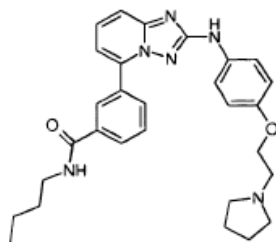
XX-305



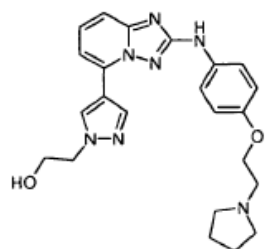
XX-300



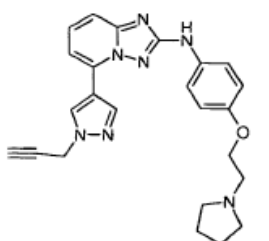
XX-306



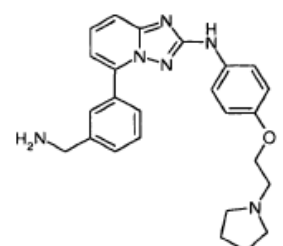
XX-301



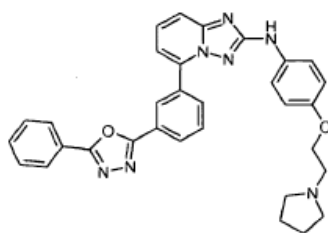
XX-307



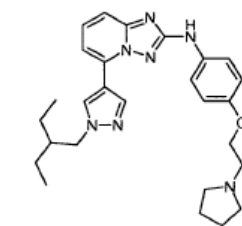
XX-302



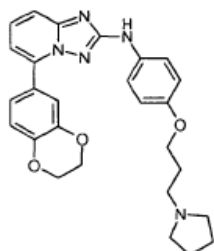
XX-308



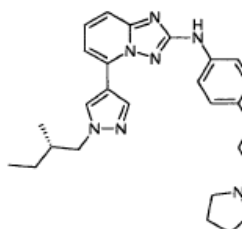
XX-309



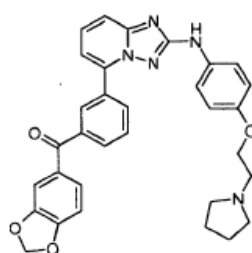
XX-319



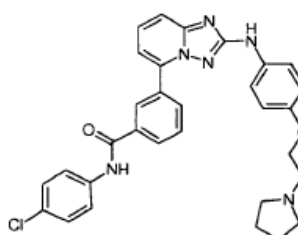
XX-312



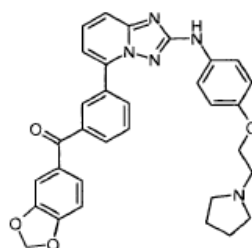
XX-320



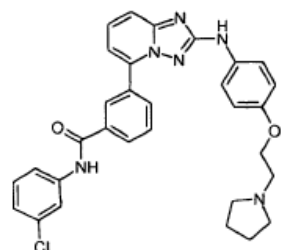
XX-313



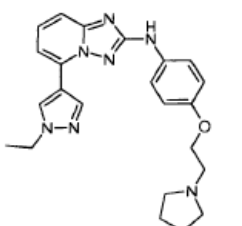
XX-321



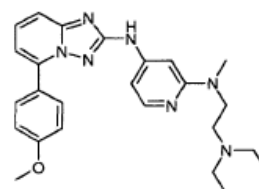
XX-314



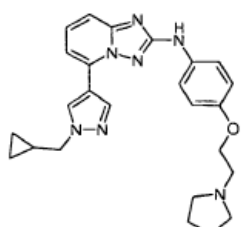
XX-322



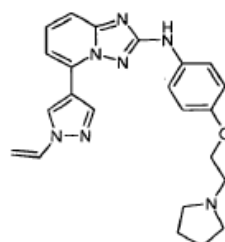
XX-315



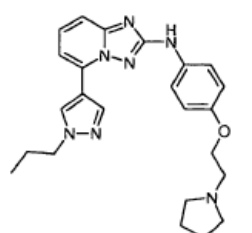
XX-326



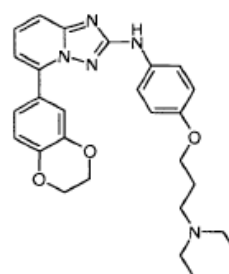
XX-316



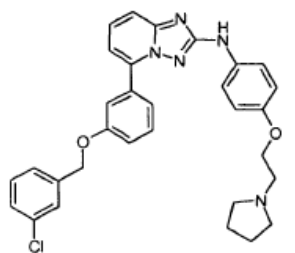
XX-328



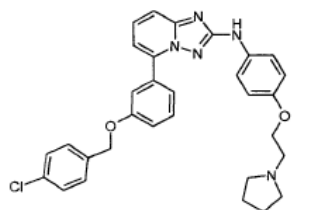
XX-318



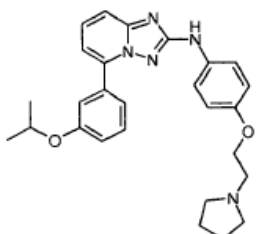
XX-329



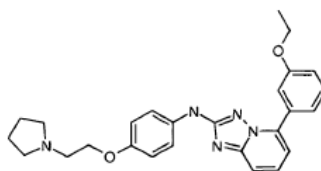
XX-330



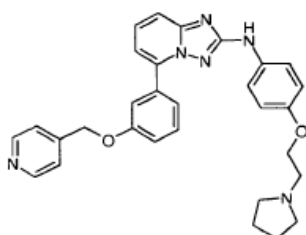
XX-336



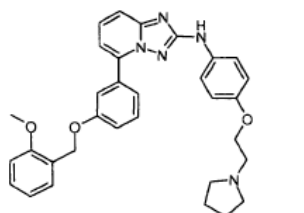
XX-331



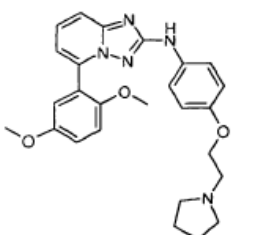
XX-337



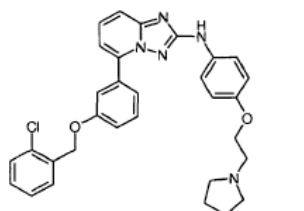
XX-332



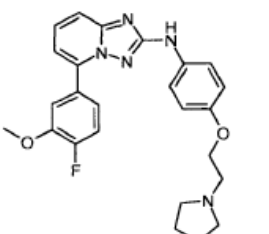
XX-338



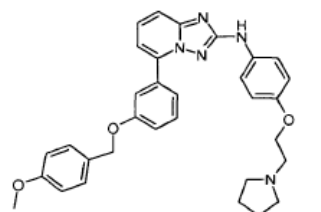
XX-333



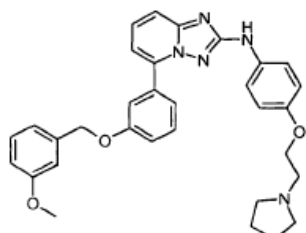
XX-339



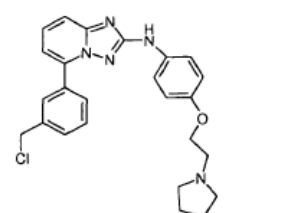
XX-334



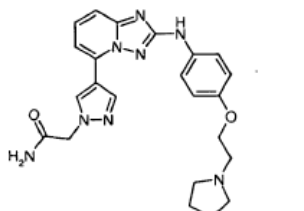
XX-340



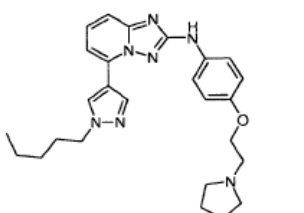
XX-335



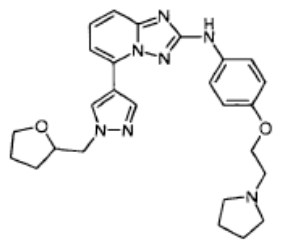
XX-341



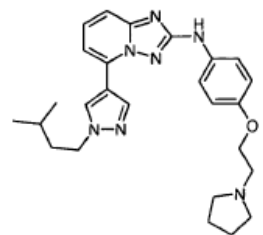
XX-342



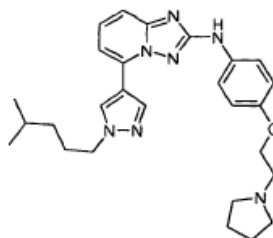
XX-343



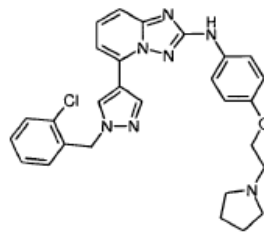
XX-344



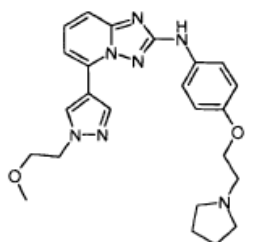
XX-353



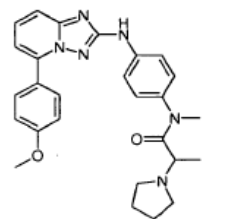
XX-345



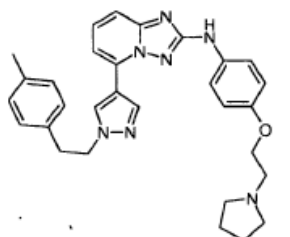
XX-354



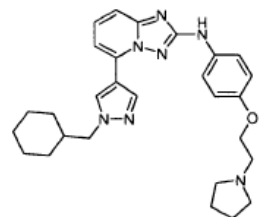
XX-349



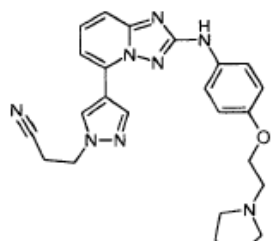
XX-355



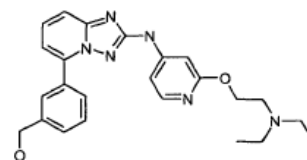
XX-350



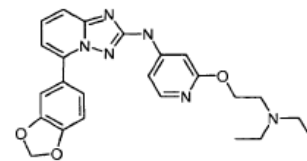
XX-356



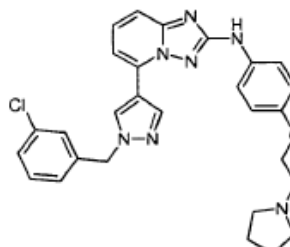
XX-351



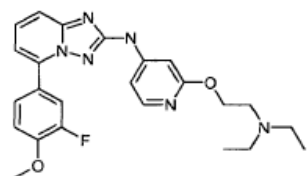
XX-357



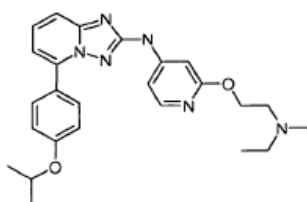
XX-358



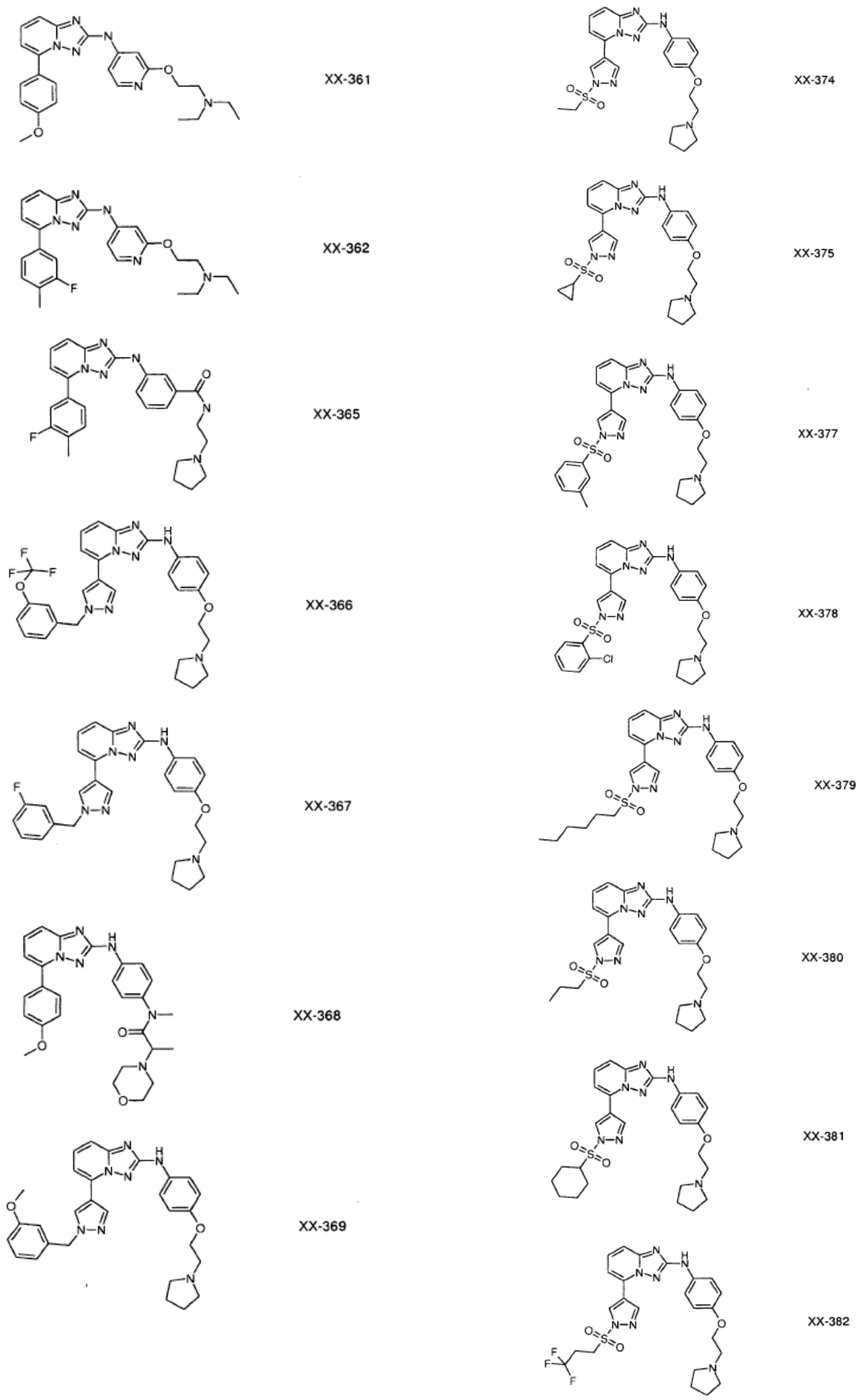
XX-352

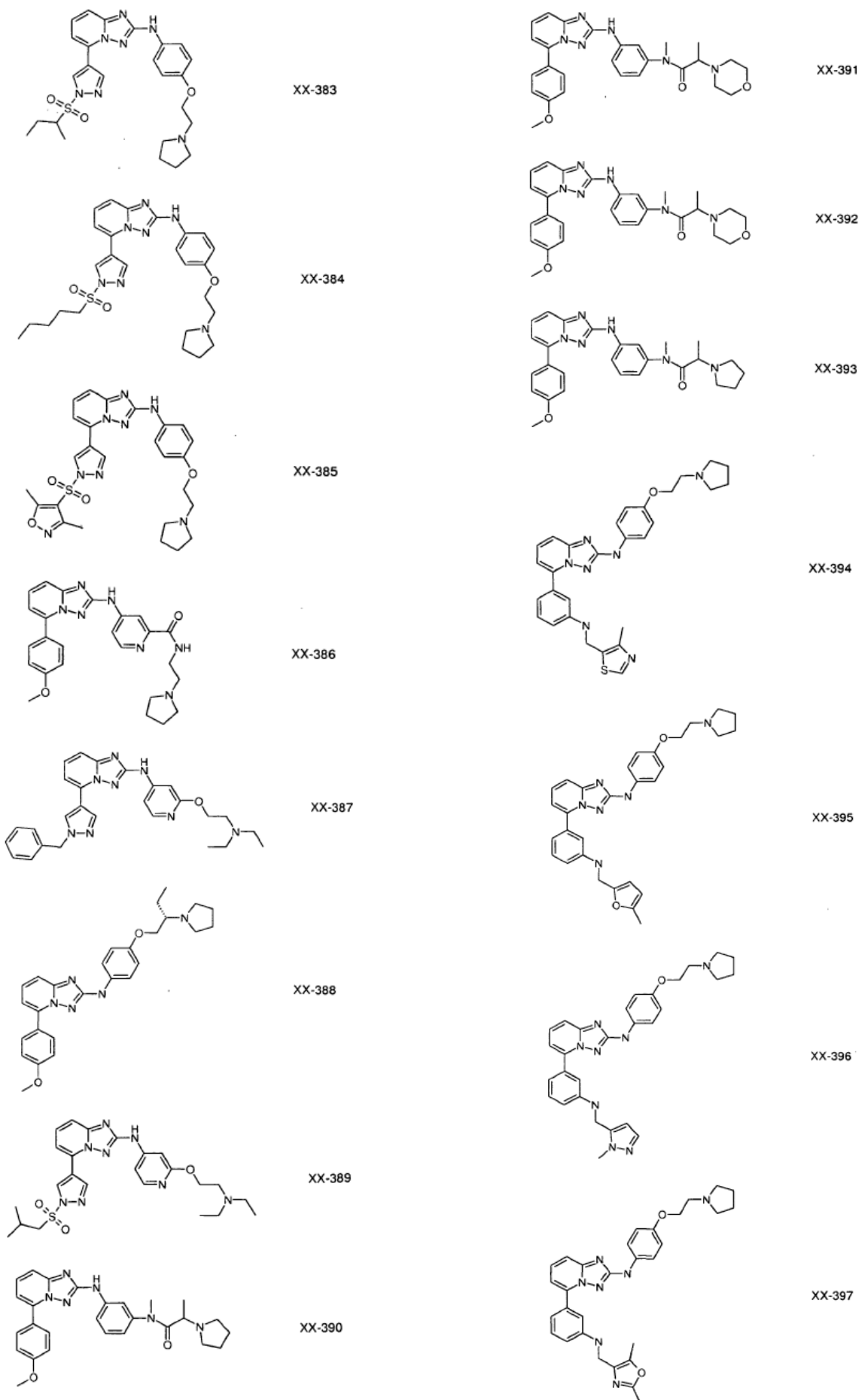


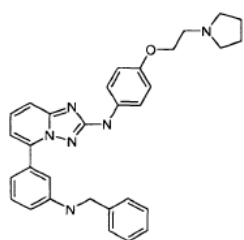
XX-359



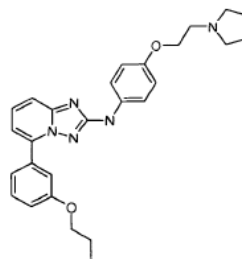
XX-360



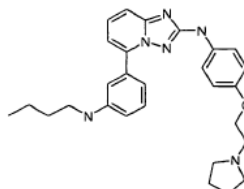




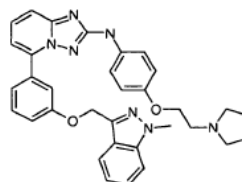
XX-398



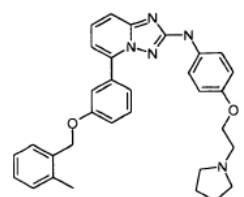
XX-405



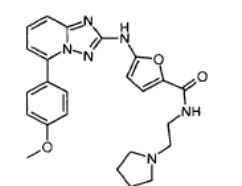
XX-399



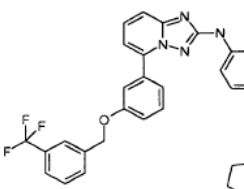
XX-407



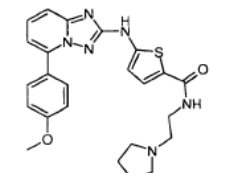
XX-400



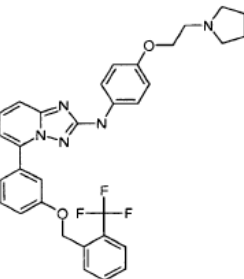
XX-408



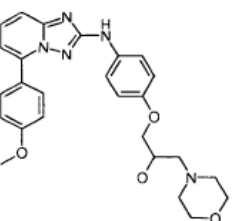
XX-401



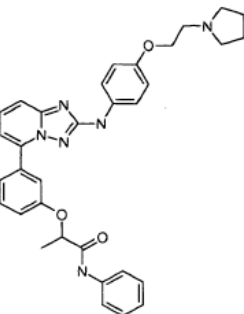
XX-409



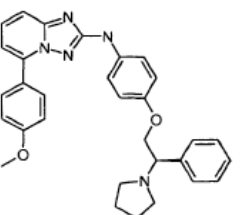
XX-402



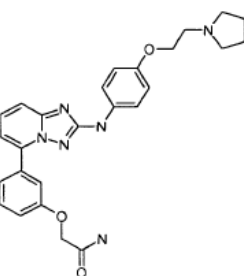
XX-410



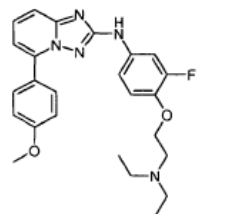
XX-403



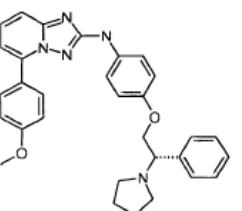
XX-411



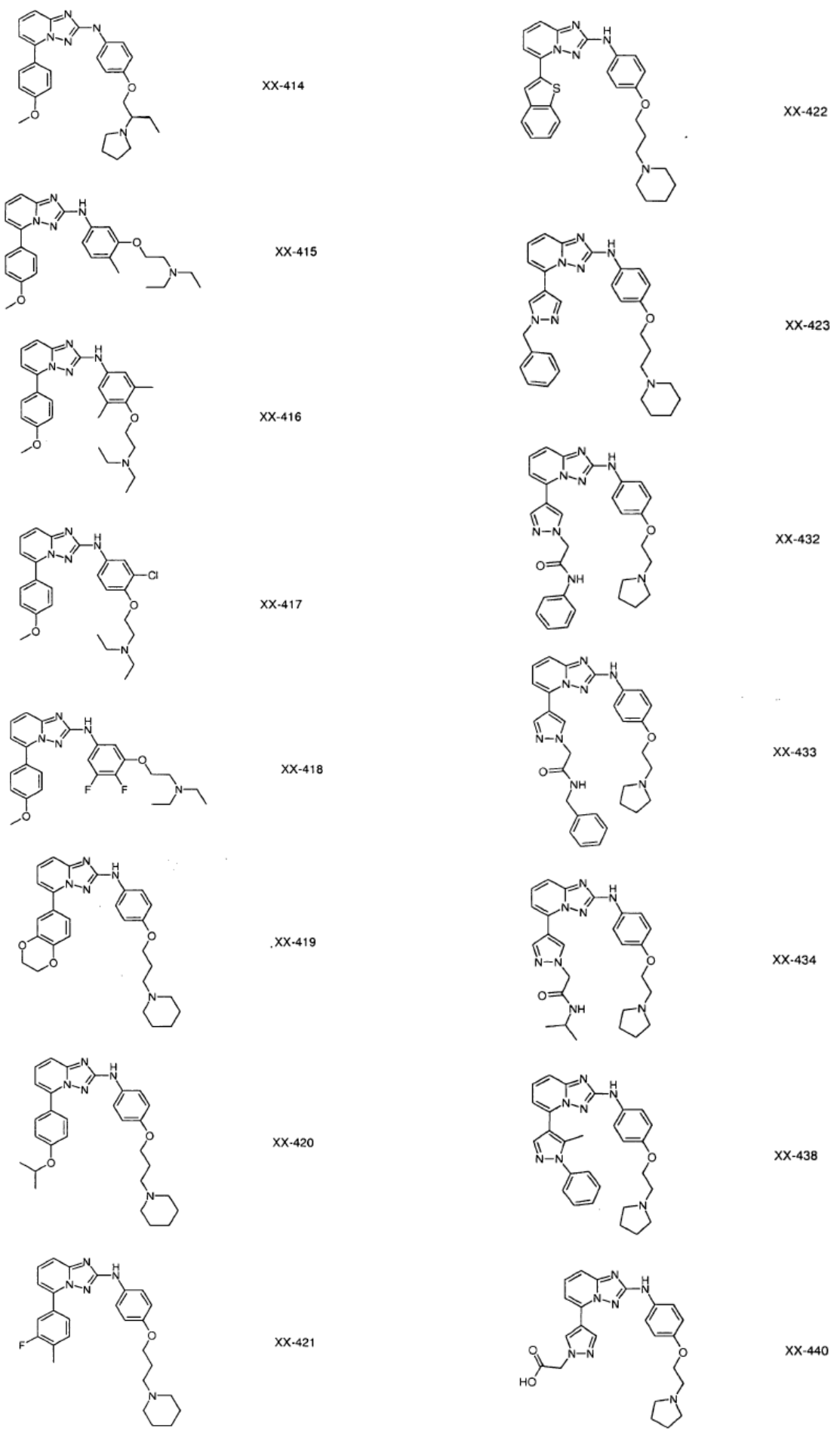
XX-404

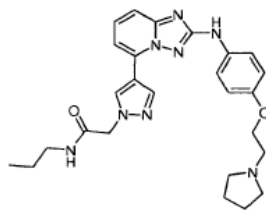


XX-412

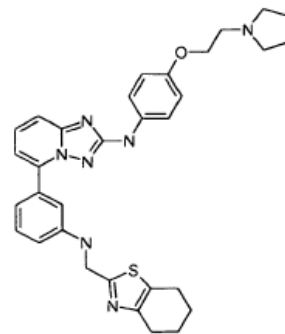


XX-413

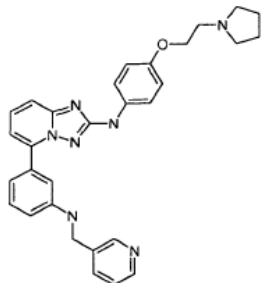




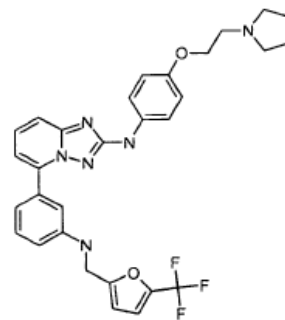
XX-441



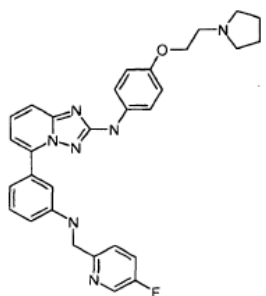
XX-447



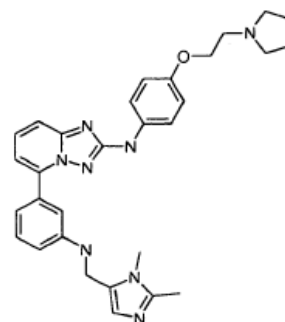
XX-442



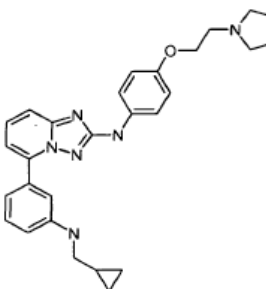
XX-448



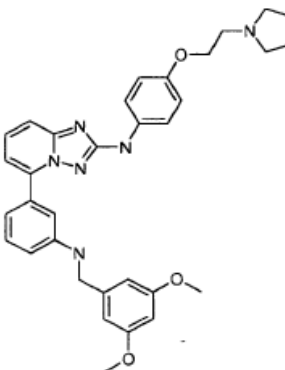
XX-443



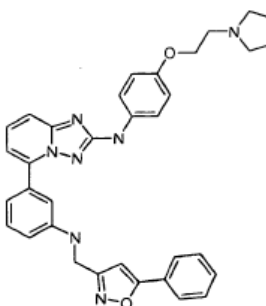
XX-449



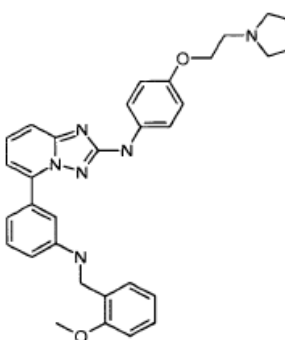
XX-444



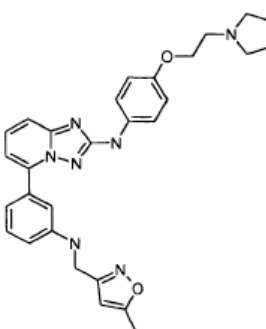
XX-450



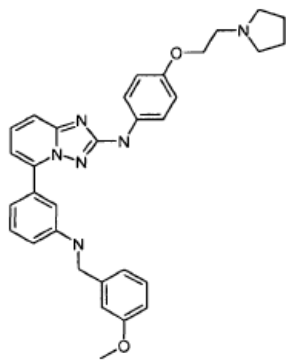
XX-445



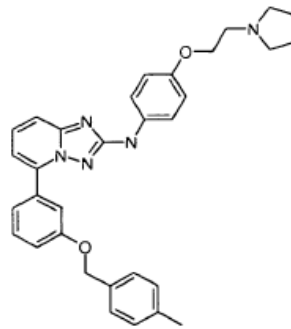
XX-451



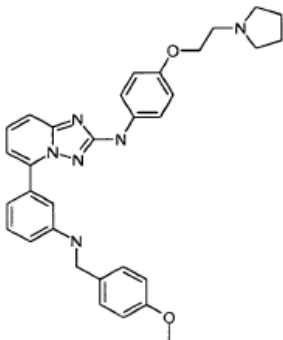
XX-446



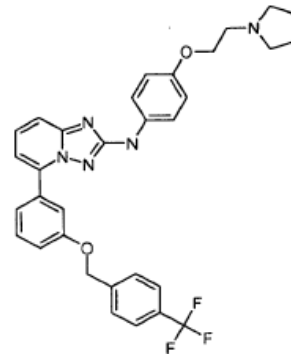
XX-452



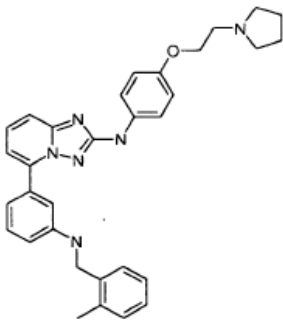
XX-457



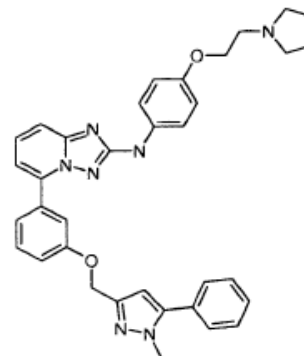
XX-453



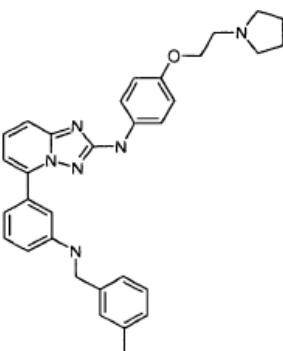
XX-458



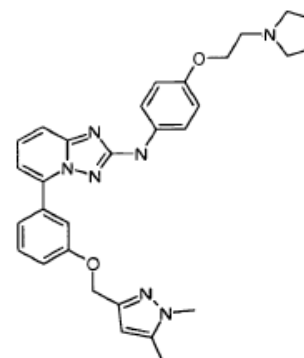
XX-454



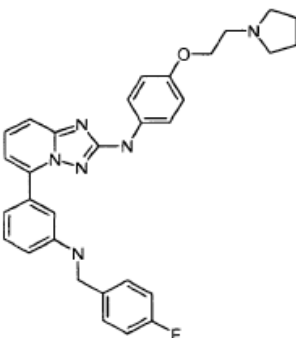
XX-459



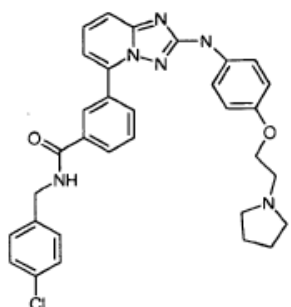
XX-455



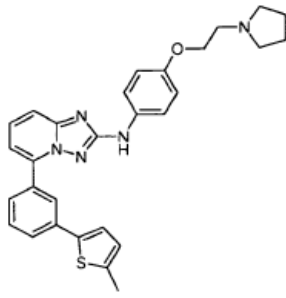
XX-460



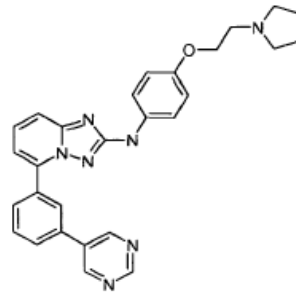
XX-456



XX-462

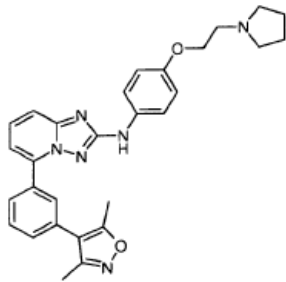


XX-463

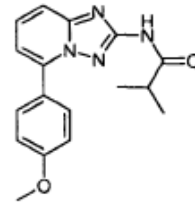


XX-469

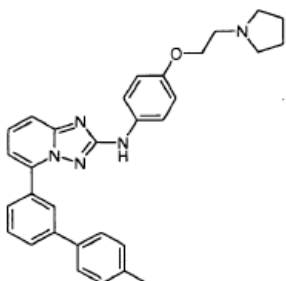
25. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, izvēlēts no sekojošiem savienojumiem, un tā farmaceutiski pieņemami sāļi, hidrāti un solvāti:



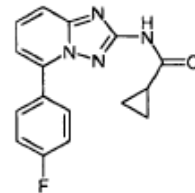
XX-464



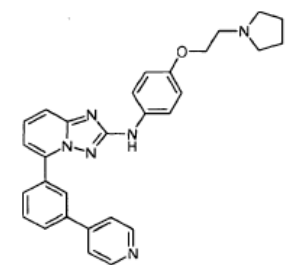
WW-012



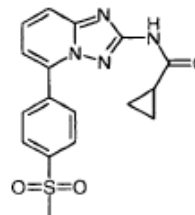
XX-465



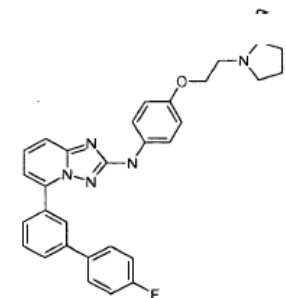
WW-013



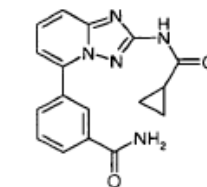
XX-466



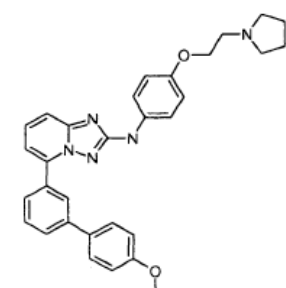
WW-014



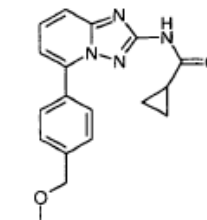
XX-467



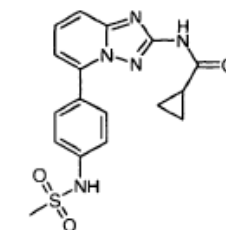
WW-015



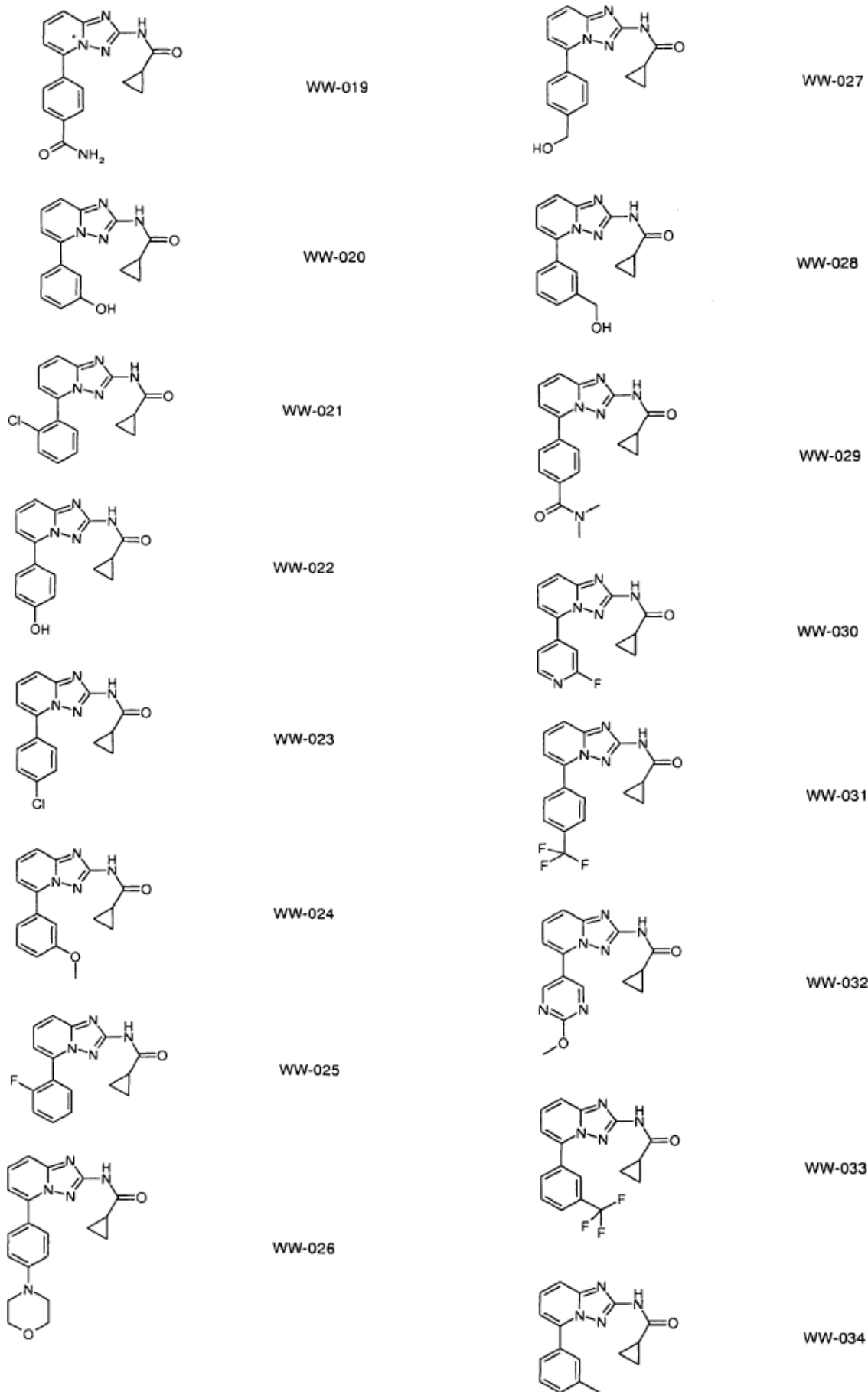
XX-468

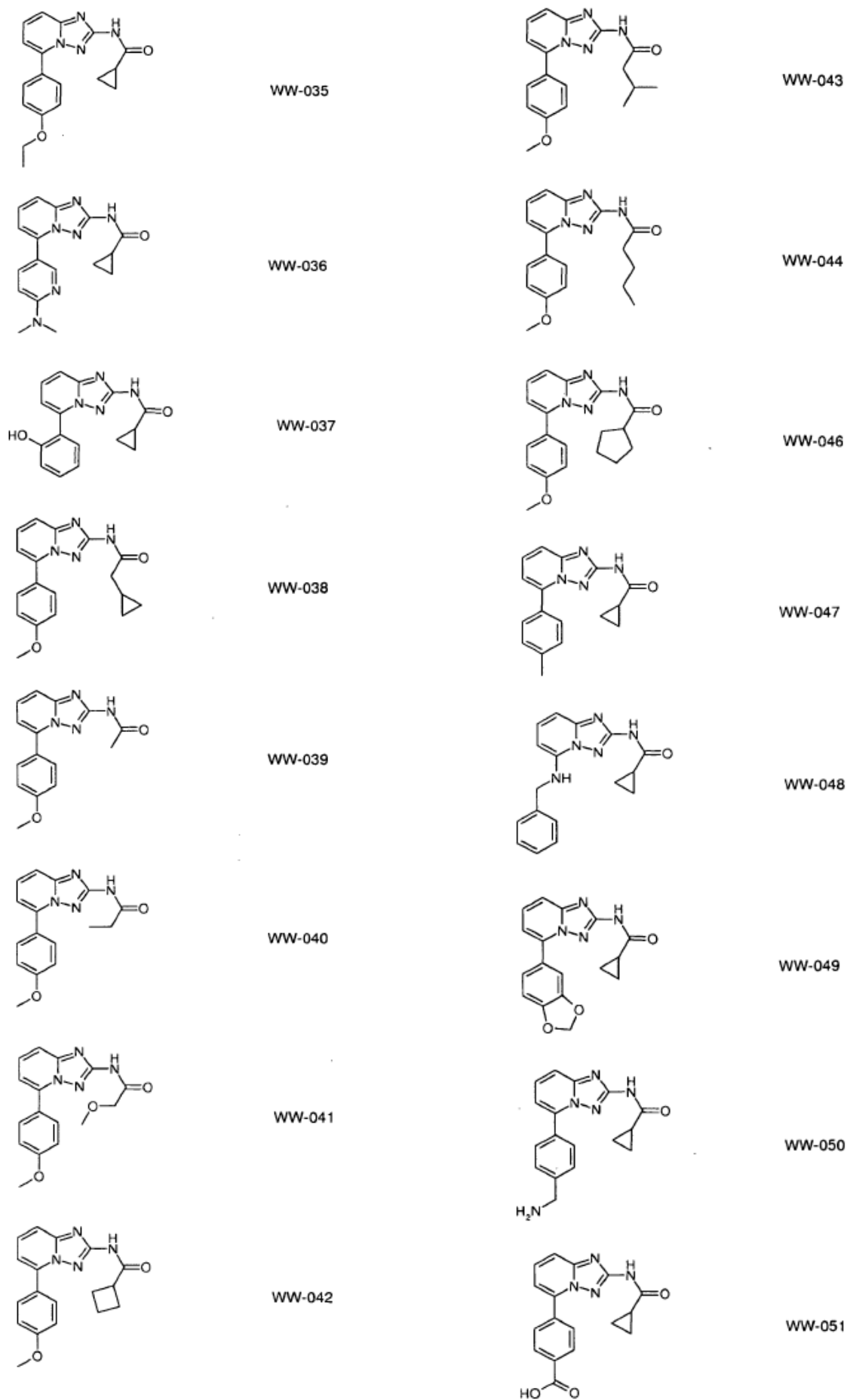


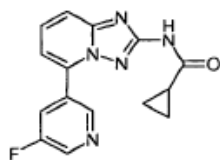
WW-016



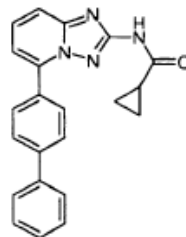
WW-017



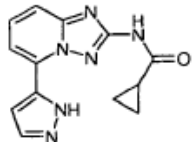




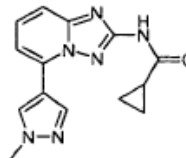
WW-052



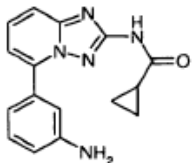
WW-063



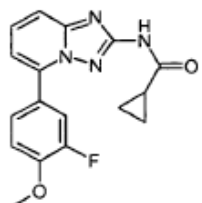
WW-053



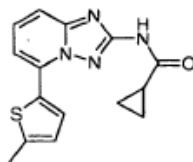
WW-064



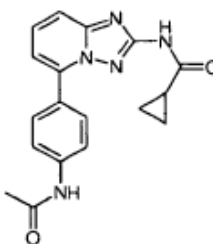
WW-054



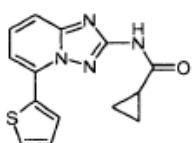
WW-067



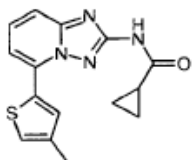
WW-055



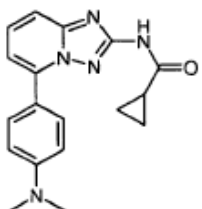
WW-068



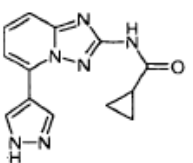
WW-057



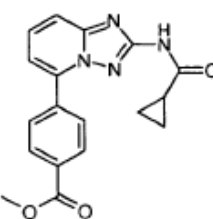
WW-058



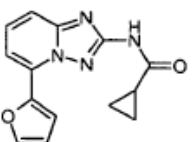
WW-069



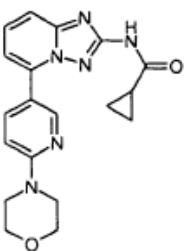
WW-060



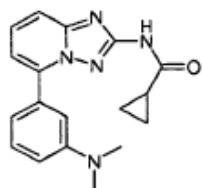
WW-070



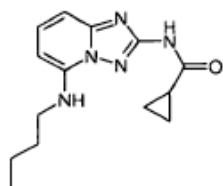
WW-061



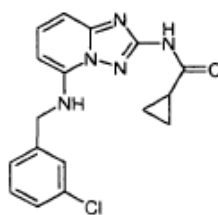
WW-062



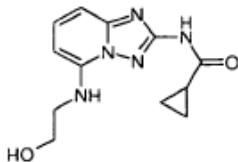
WW-071



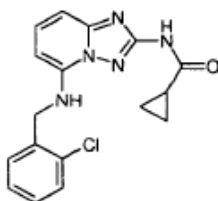
WW-073



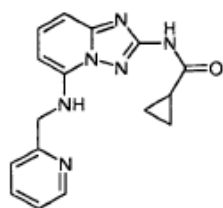
WW-081



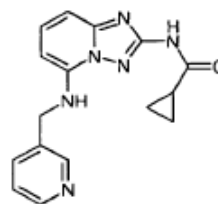
WW-074



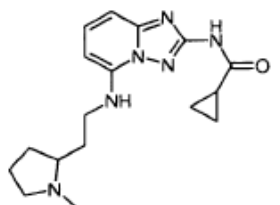
WW-082



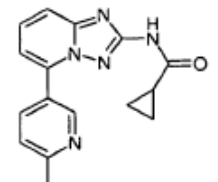
WW-075



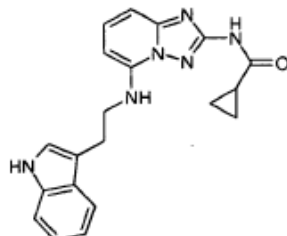
WW-083



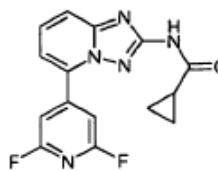
WW-076



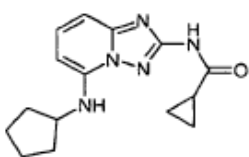
WW-084



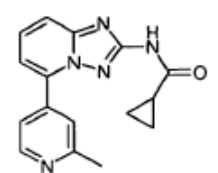
WW-077



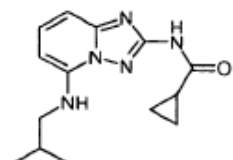
WW-086



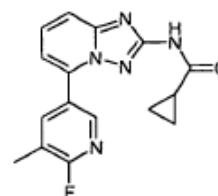
WW-078



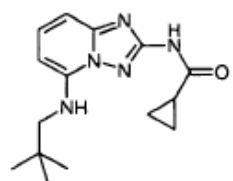
WW-087



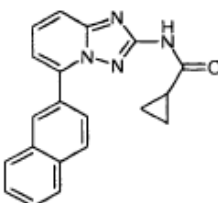
WW-079



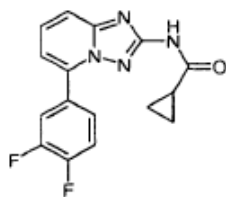
WW-088



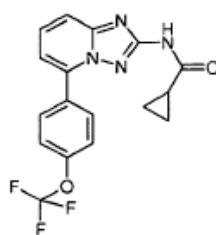
WW-080



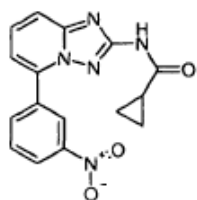
WW-089



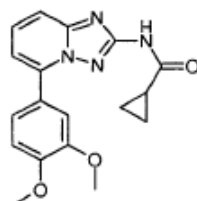
WW-090



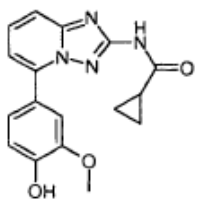
WW-099



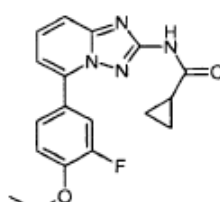
WW-091



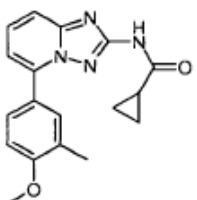
WW-100



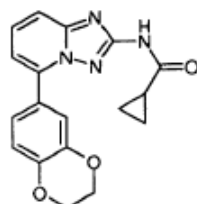
WW-093



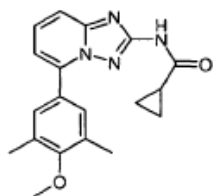
WW-101



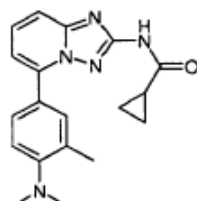
WW-094



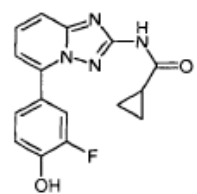
WW-102



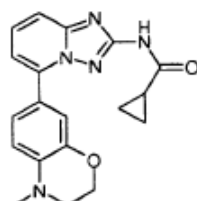
WW-095



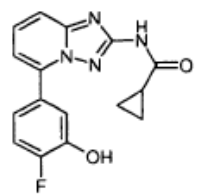
WW-103



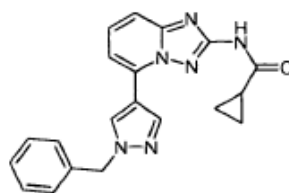
WW-096



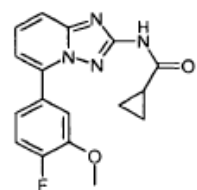
WW-104



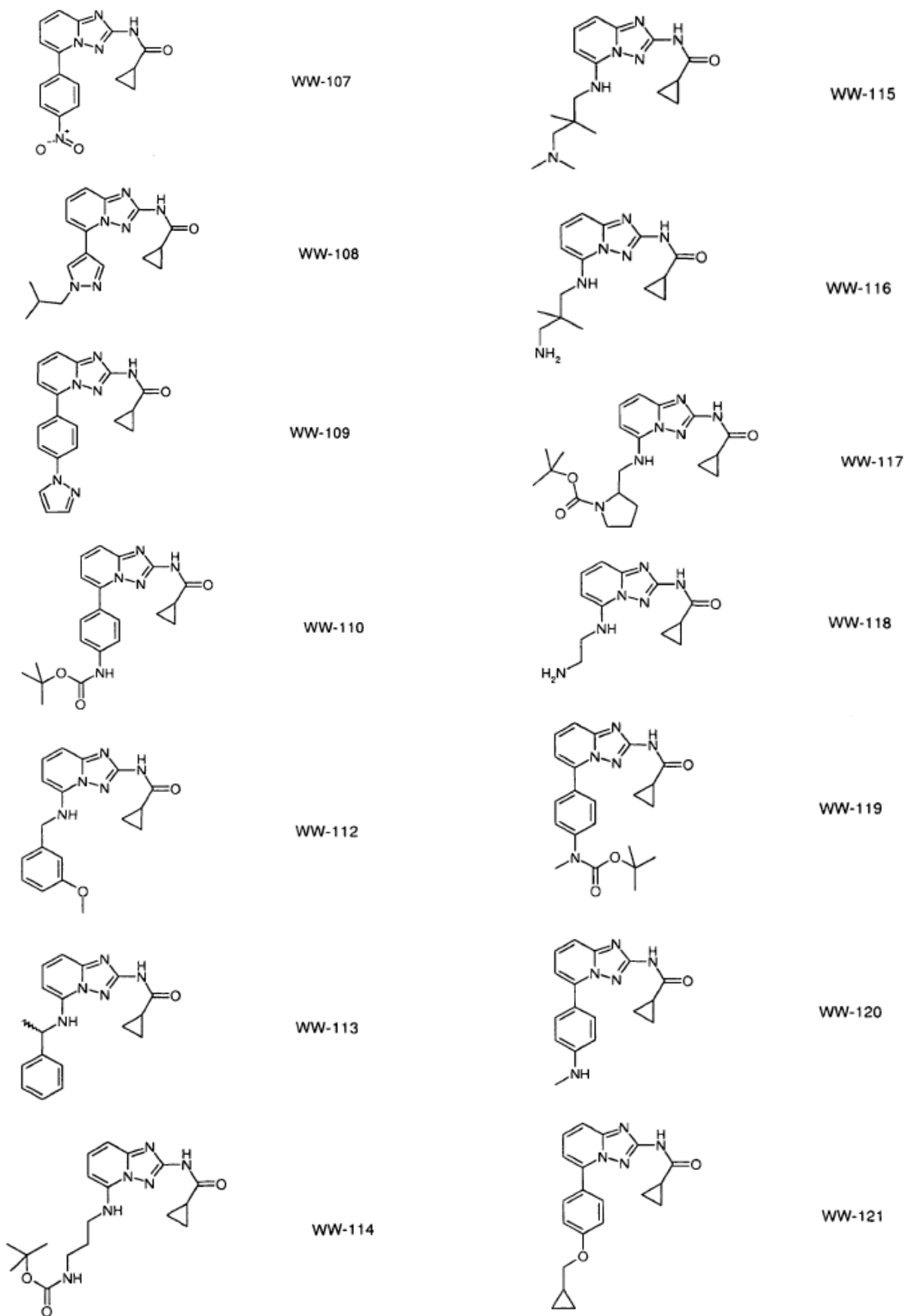
WW-097

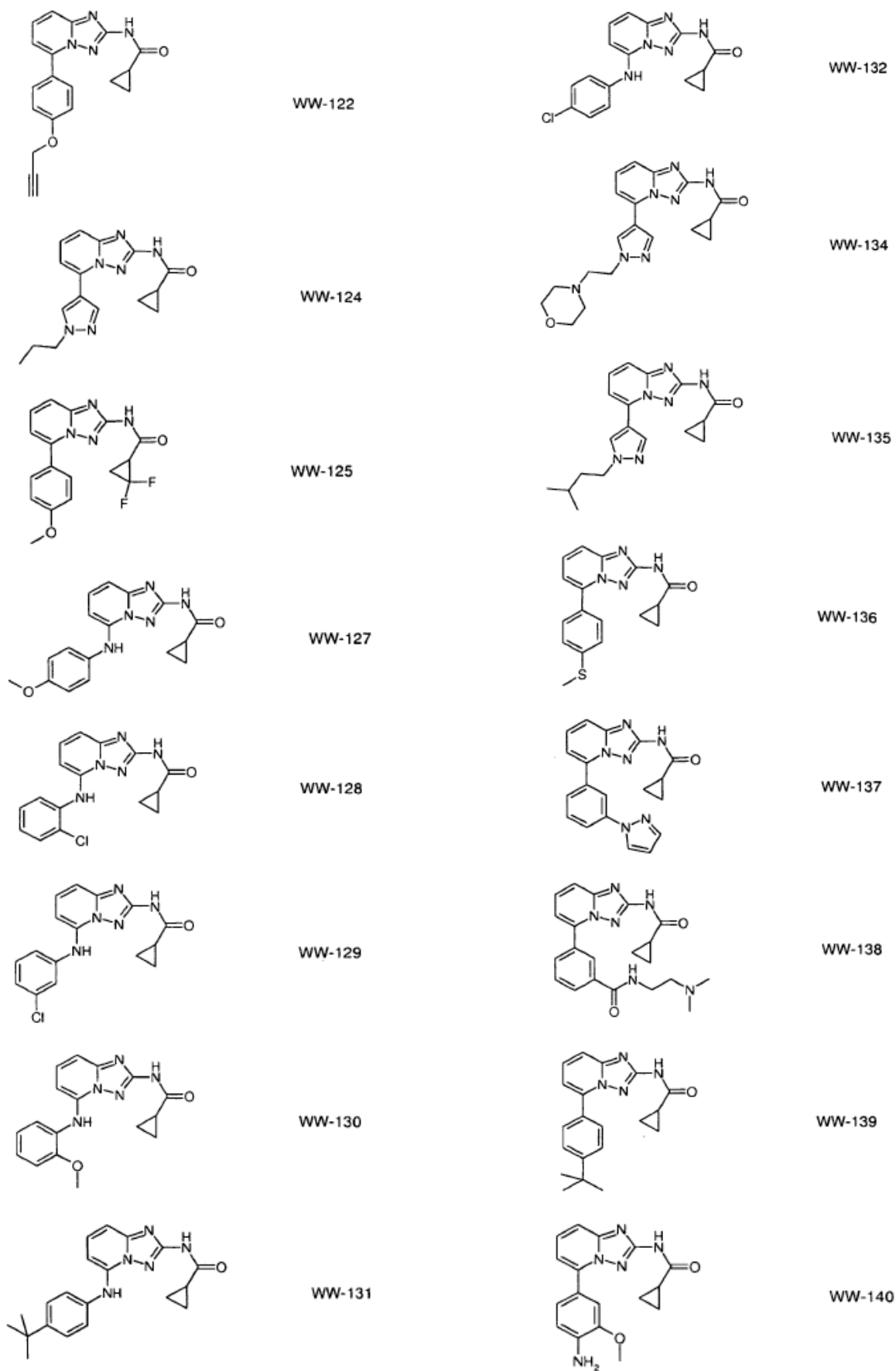


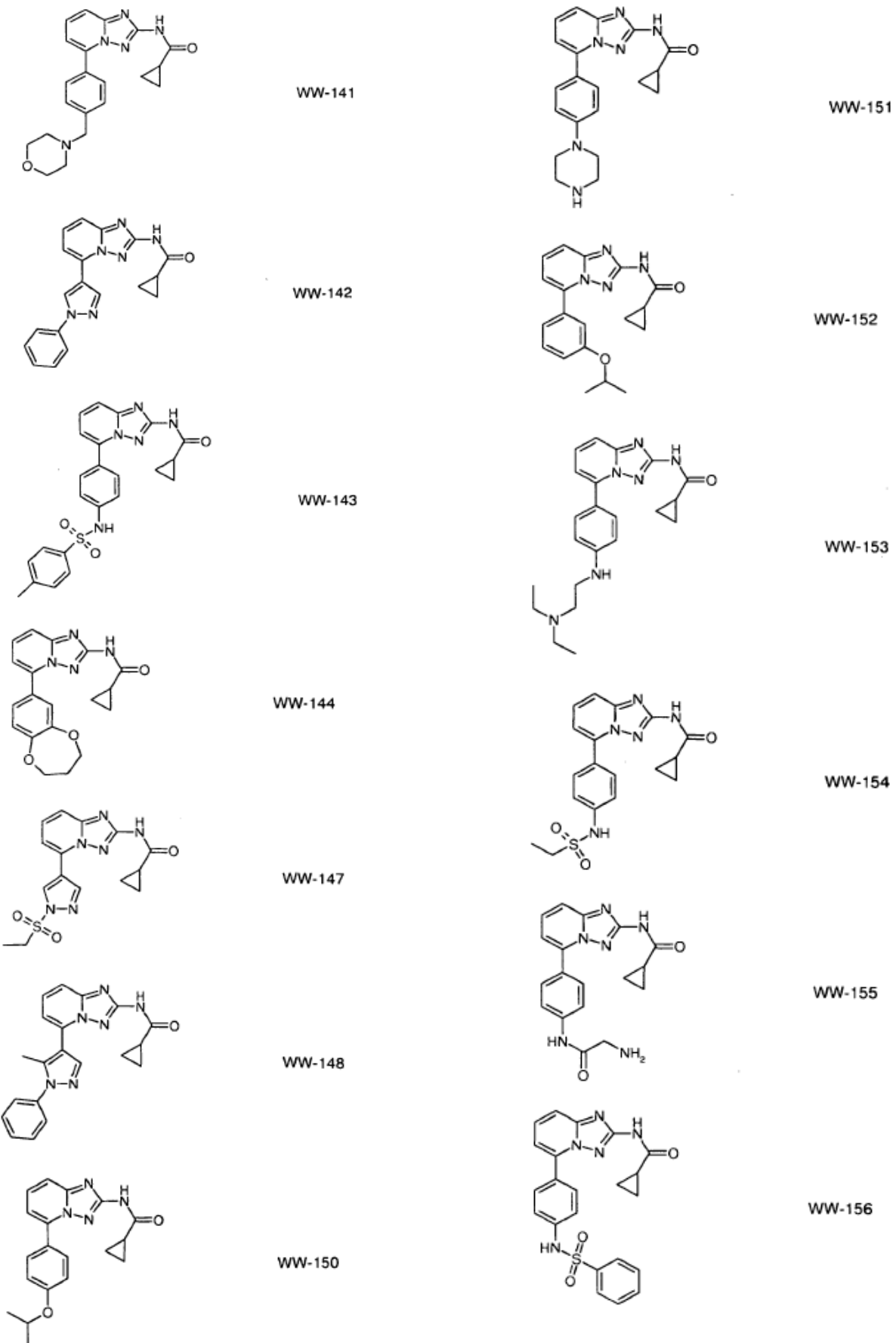
WW-105

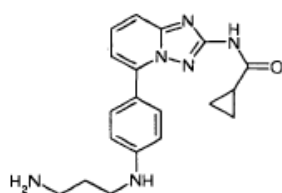


WW-098

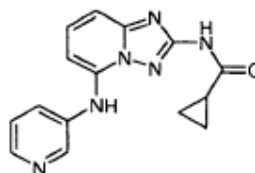




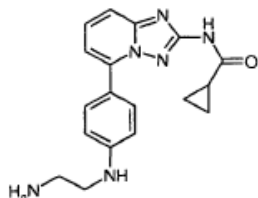




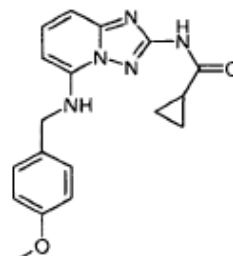
WW-157



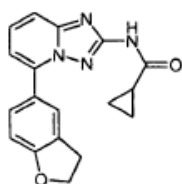
WW-166



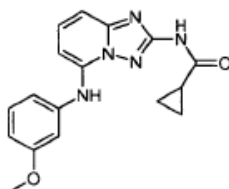
WW-158



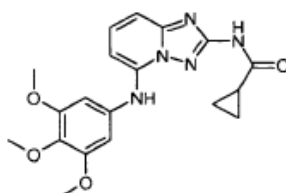
WW-167



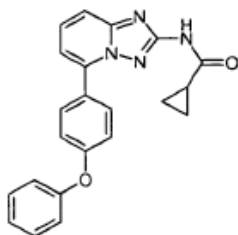
WW-159



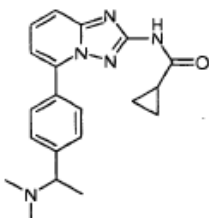
WW-160



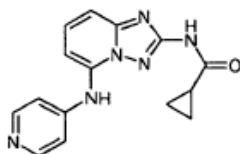
WW-161



WW-162



WW-163



WW-165

26. Farmaceutiska kompozīcija, kas ietver savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 25. pretenzijai, un farmaceitiski pieejamu nesēju vai atšķaidītāju.

27. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 25. pretenzijai izmantošanai cilvēka vai dzīvnieka ķermeņa ārstēšanai.

28. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 25. pretenzijai izmantošanai ārstēšanas paņēmienā, lai ārstētu:

proliferatīvo stāvokli vai

vēzi vai

cieto audzēja vēzi vai

šķidro audzēja vēzi vai

hematoloģisko vēzi vai

resnās zarnas vēzi, kuņģa vēzi, krūts vēzi, plaušu vēzi, akūto mieloīdo leikēmiju, vairogdziedzera vēzi, acs vēzi, prostatas vēzi, melanomas acs vēzi, olnīcu vēzi, nieru vēzi, ādas vēzi vai zviņņveida šūnu karcinomu.

29. Savienojuma saskaņā ar 1. līdz 25. pretenziju izmantošana zāļu ražošanai, lai ārstētu:

proliferatīvo stāvokli vai

vēzi vai

cieto audzēja vēzi vai

šķidro audzēja vēzi vai

hematoloģisko vēzi vai

resnās zarnas vēzi, kuņģa vēzi, krūts vēzi, plaušu vēzi, akūto mieloīdo leikēmiju, vairogdziedzera vēzi, acs vēzi, prostatas vēzi, melanomas acs vēzi, olnīcu vēzi, nieru vēzi, ādas vēzi vai zviņņveida šūnu karcinomu.

(51) **C07C 17/10**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(11) **2231565**

C07C 17/25⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07C 17/275⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07C 17/38⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07C 19/01⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07C 21/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07C 17/383⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(21) 08867081.5

(22) 17.12.2008

(43) 29.09.2010

(45) 05.03.2014

(31) 14981 P

(32) 19.12.2007

(33) US

(86) PCT/US2008/087246

17.12.2008

(87) WO2009/085862

09.07.2009

(73) OCCIDENTAL CHEMICAL CORPORATION, 5005 LBJ Freeway, Suite 2200, Dallas, TX 75244, US

(72) WILSON, Richard L., US

KLAUSMEYER, Rodney L., US

DAWKINS, John Lee, US

ROHRBACK, Daniel D., US

STRATHE, James S., US

BRANAM, Lloyd B., US

(74) Albrecht, Thomas, Kraus & Weisert Patent- und Rechtsanwältte, Thomas-Wimmer-Ring 15, 80539 München, DE
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV

**(54) METODES HLORĒTU OĢĻĒDENRAŽU IEGŪŠANAI
METHODS OF MAKING CHLORINATED HYDROCARBONS**

(57) 1. Process 1,1,1,2,3-tetrahlorpropēna ražošanai, kurā: tiek iegūts 1,1,1,2,3-pentahlorpropāns, uzslidot reakcijas maisījumu, kas satur 1,1,1,3-tetrahlorpropānu, dzelzs (III) hlorīdu un hloru, iegūstot 1,1,1,2,3-pentahlorpropānu, reakcijas maisījums neobligāti satur arī oglekļa tetrahlorīdu, kura daudzums veido līdz 50 masas procentus no reakcijas maisījuma; un 1,1,1,2,3-pentahlorpropāns tiek dehidrohlorēšanas reakcijas zonā dzelzs (III) hlorīda klātbūtnē, iegūstot 1,1,2,3-tetrahlorpropēnu un hlorūdeņradi, un 1,1,2,3-tetrahlorpropēns un hlorūdeņradis tiek izvadīts no dehidrohlorēšanas reakcijas zonas, veicot reaktīvo destilāciju.

2. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurā dzelzs (III) hlorīda daudzums reakcijas maisījumā ir no 10 līdz 1000 ppm.

3. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurā vismaz daļa no procesa 1,1,1,2,3-pentahlorpropāna iegūšanai norisinās iekārtā, kas satur reakcijas zonu atdalīšanas zonu, neobligāti satur destilācijas zonu, un kondensācijas zonu.

4. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurā process 1,1,1,2,3-pentahlorpropāna iegūšanai satur arī būtiski nepārtrauktu 1,1,1,3-tetrahlorpropāna un hloru padevi uz reakcijas zonu, kas satur dzelzs (III) hlorīdu.

5. Process saskaņā ar 4. pretenziju, kurā 1,1,1,3-tetrahlorpropāns un hloru tiek ievadīti padeves proporcijā no 0,9 līdz 1,1 moliem hloru uz tetrahlorpropāna molu.

6. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurā hlorūdeņradis ir procesa blakusprodukts un tiek izvadīts no reakcijas zonas caur atdalīšanas zonu un kondensācijas zonu, kā arī kurā reakcijas zonā esošais hlorūdeņradis satur 1,1,3-trihlorpropēnu vai oglekļa tetrahlorīdu, vai gan 1,1,3-trihlorpropēnu, gan oglekļa tetrahlorīdu, un 1,1,3-trihlorpropēns vai oglekļa tetrahlorīds, vai gan 1,1,3-trihlorpropēns, gan oglekļa tetrahlorīds tiek ievadīti atpakaļ reakcijas zonā caur kondensācijas zonu.

7. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur arī posmu, kurā vismaz daļa no iegūtā 1,1,2,3-tetrahlorpropēna tiek pakļauta vienam vai vairākiem attīrīšanas posmiem.

8. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurā no 10 līdz 20000 miljonās daļas pēc masas dzelzs (III) hlorīda tiek uzturētas dehidrohlorēšanas reakcijas zonā.

9. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurā dehidrohlorēšanas process tiek veikts, izmantojot reaktīvās destilācijas iekārtu, kas satur reakcijas zonu, atdalīšanas zonu un kondensācijas zonu, kur 1,1,2,3-tetrahlorpropēns un hlorūdeņradis tiek izvadīti no dehidrohlorēšanas reakcijas zonas caur atdalīšanas zonu un kondensācijas zonu.

10. Process saskaņā ar 9. pretenziju, kurā temperatūra dehidrohlorēšanas reakcijas zonā ir no 120 līdz 180 °C, spiediens atdalīšanas zonā ir diapazonā no 13 līdz 80 kPa (100 līdz 600 torr), un temperatūra kondensācijas zonā ir tāda, lai nodrošinātu no reakcijas zonas destilētā 1,1,2,3-tetrahlorpropēna kondensāciju šķidrumā.

11. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurā 1,1,1,2,3-pentahlorpropāns atrodas neapstrādātā 1,1,1,2,3-pentahlorpropānā un neapstrādātais 1,1,1,2,3-pentahlorpropāns satur 1,1,1,2,3-pentahlorpropānu un vismaz vienu no dzelzs (III) hlorīda, oglekļa tetrahlorīda, 1,1,3-trihlorpropēna, 1,1,1,3-tetrahlorpropāna un 1,1,2,3-tetrahlorpropēna, process satur: neapstrādātā 1,1,1,2,3-pentahlorpropēna padevi uz dehidrohlorēšanas reakcijas zonu, neapstrādāto 1,1,1,2,3-pentahlorpropānu pārvēršot 1,1,2,3-tetrahlorpropēnā un hlorūdeņradī dehidrohlorēšanas reakcijā, kurā 1,1,2,3-tetrahlorpropēns un hlorūdeņradis tiek izvadīti no reakcijas zonas dehidrohlorēšanas reakcijas laikā; un 1,1,2,3-tetrahlorpropēna savākšanu.

12. Process saskaņā ar 11. pretenziju, kurā neapstrādātais 1,1,1,2,3-pentahlorpropāns reaktīvajā destilācijā tiek pārvērsts 1,1,2,3-tetrahlorpropēnā, kur reaktīvā destilācija norisinās iekārtā, kas satur reakcijas zonu, atdalīšanas zonu un kondensācijas zonu, kur 1,1,2,3-tetrahlorpropēns un hlorūdeņradis tiek izvadīti no reakcijas zonas caur atdalīšanas zonu un kondensācijas zonu, un vismaz daļa no 1,1,2,3-tetrahlorpropēna tiek atdalīta šķidrā kondensāta veidā no hlorūdeņraža tvaika, iegūstot attīrītu hlorūdeņraža tvaiku un neapstrādātu 1,1,2,3-tetrahlorpropēnu.

13. Process saskaņā ar 11. pretenziju, kurā vismaz daļa no neapstrādātā 1,1,2,3-tetrahlorpropēna tiek pakļauta vienam vai vairākiem attīrīšanas posmiem.

14. Process saskaņā ar 11. pretenziju, kurā no 10 līdz 20000 ppm pēc masas dzelzs (III) hlorīda tiek uzturētas reakcijas zonā.

15. Process saskaņā ar 11. pretenziju, kurā šķidrā reakcijas maisījums, kas satur neizreaģējušo 1,1,1,2,3-pentahlorpropānu, dzelzs (III) hlorīdu, negaistošu materiālu un augstā temperatūrā virstošus blakusproduktus, periodiski vai nepārtraukti tiek izvadīts no reakcijas zonas, un vismaz daļa no neizreaģējušā 1,1,1,2,3-pentahlorpropāna, kas ir klāt izvadītajā reakcijas maisījumā, tiek atdalīta no vismaz dažiem citiem reakcijas maisījuma komponentiem un pēc tam padota atpakaļ uz reakcijas zonu.

16. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurā:
(i) oglekļa tetrahlorīda reakcija ar etilēnu dzelzs hlorīdu, dzelzs metāla un trialkilfosfāta klātbūtnē, veidojot neapstrādātu produktu, kas satur 1,1,1,3-tetrahlorpropānu;

(ii) minētais neapstrādātais produkts tiek destilēts, veidojot augšējo plūsmu un apakšējo plūsmu, un augšējā plūsma satur 1,1,1,3-tetrahlorpropānu un neizreaģējušo oglekļa tetrahlorīdu, un apakšējā plūsma satur 1,1,1,3-tetrahlorpropānu;

(iii) augšējā plūsma reaģē ar hloru dzelzs (III) hlorīda klātbūtnē, veidojot neapstrādātu 1,1,1,2,3-pentahlorpropānu;

(iv) (iii) posmā iegūtais neapstrādātais 1,1,1,2,3-pentahlorpropāns tiek ievadīts reakcijas zonā, kura ir daļa no reaktīvās destilācijas procesa iekārtas, kas satur reakcijas zonu, atdalīšanas zonu un kondensācijas zonu, un neapstrādātais 1,1,1,2,3-pentahlorpropāns tiek dehidrohlorēts, veidojot hlorūdeņradī un 1,1,2,3-tetrahlorpropēnu, un hlorūdeņradis un 1,1,2,3-tetrahlorpropēns tiek izvadīti no reakcijas zonas dehidrohlorēšanas laikā, veicot destilāciju, un

(v) tiek savākts produkts 1,1,2,3-tetrahlorpropēns.

17. Process saskaņā ar 16. pretenziju, kurā (iii) posmā iegūtā neapstrādātā 1,1,1,2,3-pentahlorpropāna šķidrā produkts tiek ievadīts tieši (iv) posma reakcijas zonā, neveicot attīrīšanu.

18. Process saskaņā ar 16. pretenziju, kurā vismaz daļa no neapstrādātā šķidrā 1,1,2,3-tetrahlorpropēna tiek pakļauta vienam vai vairākiem attīrīšanas posmiem.

19. Process saskaņā ar 16. pretenziju, kurā 10 līdz 1000 ppm pēc masas dzelzs (III) hlorīda tiek uzturētas (iii) posma reakcijas zonā vai 10 līdz 20000 ppm pēc masas dzelzs (III) hlorīda tiek uzturētas (iv) posma reakcijas zonā.

20. Process saskaņā ar 16. pretenziju, kurā šķidrā reakcijas maisījums (iv) posma reakcijas zonā satur neizreaģējušo 1,1,1,2,3-pentahlorpropānu un dzelzs (III) hlorīdu, un vismaz daļa no šī šķidrā maisījuma tiek izvadīta no reakcijas zonas periodiski vai nepārtraukti, un vismaz daļa no neizreaģējušā 1,1,1,2,3-pentahlorpropāna, kas ir klāt izvadītajā reakcijas maisījumā, tiek atdalīta no vismaz dažiem citiem reakcijas maisījuma komponentiem un pēc tam padota uz reakcijas zonu.

(51) **A61K 9/16**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 9/20⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 31/438⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 31/4704⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 209/34⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 209/42⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 471/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(21) 08864658.3

(43) 06.10.2010

(45) 13.11.2013

(31) 8698

(86) PCT/US2008/013890

(87) WO2009/082471

(73) TEVA PHARMACEUTICAL INDUSTRIES, LTD., 5 Basel Street, P.O. Box 3190, 49131 Petach-Tikva, IL

(72) SAFADI, Muhammad, IL

LICHT, Daniela, IL

LOVINGER, Ioana, IL

EYAL, Aharon, M., IL

FRISTEDT, Tomas, SE

JANSSON, Karl, SE

(11) **2234485**

(22) 19.12.2008

(32) 20.12.2007 (33) US

19.12.2008

02.07.2009

(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) **STABIĻI LAKVINIMODA PREPARĀTI**
STABLE LAQUINIMOD PREPARATIONS

(57) 1. Derīguma apstiprināšanas process farmaceitisku produktu partijai, kas satur N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīdu vai tā sāli un farmaceitiski pieņemamu nesēju, izplatīšanai, kas ietver

a) partijas parauga pakļaušanu stabilitātes pārbaudei;
b) sadalīšanās produkta, kam cēlonis ir oksidācija, kopējā daudzuma noteikšanu partijas paraugā pēc stabilitātes testa veikšanas; un

c) partijas apstiprināšanu izplatīšanai tikai tad, ja partijas paraugs pēc stabilitātes testa veikšanas kopā satur ne vairāk par 0,5 % masa/masa attiecībā pret N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīdu no N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīda oksidācijas sadalīšanās produktiem.

2. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kur oksidācijas sadalīšanās produkts ir 2-hlor-6-(1-etil-N-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamido)benzoscābe, 5-hlor-N-etil-3-hidroksi-1-metil-2,4-dioksi-N-fenil-1,2,3,4-tetrahidro-hinolīna-3-karboksamīds vai 1H,3H-spiro[5-hlor-1-metilhinolīn-2,4-dion-3,3'-[1]etilindolīn-[2]-ons] vai to maisījums.

3. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kur darbībā (b) apjomu nosaka, izmantojot masas mērījumu, ultravioleto absorbciju, refrakcijas indeksu, jonizāciju vai polarogrammu.

4. Apstiprināšanas process partijai, kas satur N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīdu vai tā sāli izplatīšanai, kas ietver

a) partijas parauga pakļaušanu stabilitātes pārbaudei;
b) oksidācijas sadalīšanās produkta kopējās summas noteikšanu partijas paraugā pēc stabilitātes testa veikšanas; un

c) partijas apstiprināšanu izplatīšanai tikai tad, ja partijas paraugs pēc stabilitātes testa veikšanas kopā satur ne vairāk par 0,1 % masa/masa attiecībā pret N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīdu no N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīda oksidācijas sadalīšanās produktiem.

5. Process saskaņā ar 4. pretenziju, kur oksidācijas sadalīšanās produkts ir 2-hlor-6-(1-etil-N-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamido)benzoscābe, 5-hlor-N-etil-3-hidroksi-1-metil-2,4-dioksi-N-fenil-1,2,3,4-tetrahidro-hinolīna-3-karboksamīds vai 1H,3H-spiro[5-hlor-1-metilhinolīn-2,4-dions-3,3'-[1]etilindolīn-[2]-ons] vai to attiecīgs maisījums.

6. Process saskaņā ar 4. pretenziju, kur darbībā (b) apjomu nosaka, izmantojot masas mērījumu, ultravioleto absorbciju, refrakcijas indeksu, jonizāciju vai polarogrammu.

7. Farmaceutiska produkta, kas ietver N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīdu vai tā sāli un farmaceitiski pieņemamu nesēju, sagatavošanas process izplatīšanai, kur farmaceitiskais produkts satur N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīdu kopā ne vairāk par 0,5 % masa/masa attiecībā pret N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīdu, kas rodas no oksidācijas sadalīšanās produktiem 2-hlor-6-(1-etil-N-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīd)benzoscābes, 1H,3H-spiro[5-hlor-1-metilhinolīn-2,4-dion-3,3'-[1]etilindolīn-[2]-ona] un 5-hlor-N-etil-3-hidroksi-1-metil-2,4-dioksi-N-fenil-1,2,3,4-tetrahidro-hinolīna-3-karboksamīda, kas ietver

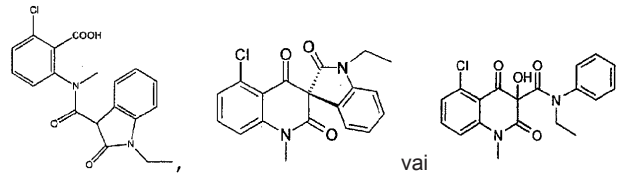
a) N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīda partijas iegūšanu vai tā sāls iegūšanu;

b) oksidācijas sadalīšanās produktu 2-hlor-6-(1-etil-N-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīd)benzoscābes, 1H,3H-spiro[5-hlor-1-metilhinolīn-2,4-dion-3,3'-[1]etilindolīn-[2]-ona] un 5-hlor-N-etil-3-hidroksi-1-metil-2,4-dioksi-N-fenil-1,2,3,4-tetrahidro-hinolīn-3-karboksamīda klātbūtnes kopējā daudzuma noteikšanu partijā; un

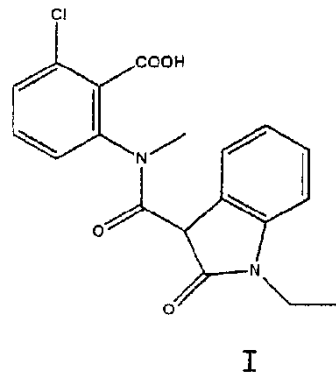
c) farmaceitiska produkta sagatavošanu no partijas tikai tad, ja partijā ir konstatēts kopā ne vairāk par 0,5 % masas/masa attiecībā pret N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīdu, kas rodas no oksidācijas sadalīšanās produktiem 2-hlor-6-(1-etil-N-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamido)benzoscābes, 1H,3H-spiro[5-hlor-1-metilhinolīn-2,4-dion-3,3'-[1]etilindolīn-[2]-

ona] un 5-hlor-N-etil-3-hidroksi-1-metil-2,4-dioksi-N-fenil-1,2,3,4-tetrahidro-hinolīn-3-karboksamīda.

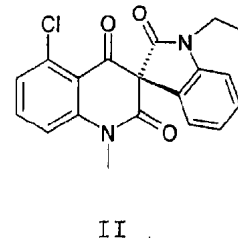
8. Testēšanas process, lai noteiktu, vai paraugs satur nevēlamus N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīda oksidācijas sadalīšanās produktus, kas ietver noteikšanu, vai paraugs satur kādu savienojumu, kuram ir sekojoša struktūra:



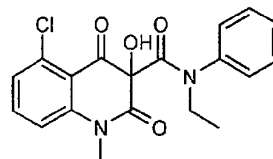
9. Atsevišķs savienojums ar šādu struktūru:



10. Atsevišķs savienojums ar šādu struktūru:



11. Process saskaņā ar 8. pretenziju, kas ietver noteikšanu, vai paraugs satur savienojumu ar šādu struktūru:



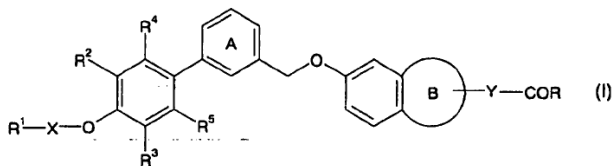
12. Farmaceutiska produkta, kas ietver N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīdu vai sāli un farmaceitiski pieņemamu nesēju, sagatavošanas process izplatīšanai, kur farmaceitiskais produkts kopā satur ne vairāk par 0,5 % masas/masa attiecībā pret N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīdu no 5-hlor-N-etil-3-hidroksi-1-metil-2,4-dioksi-N-fenil-1,2,3,4-tetrahidro-hinolīna-3-karboksamīda oksidācijas sadalīšanās produkta, kas ietver

a) N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīda partijas iegūšanu vai tā sāls iegūšanu;

b) 5-hlor-N-etil-3-hidroksi-1-metil-2,4-dioksi-N-fenil-1,2,3,4-tetrahidro-hinolīna-3-karboksamīda kopējā apjoma noteikšanu partijā; un

c) farmaceitiska produkta sagatavošanu no partijas tikai tad, ja partijā ir konstatēts kopā ne vairāk par 0,5 % masas/masa attiecībā pret N-etil-N-fenil-1,2-dihidro-4-hidroksi-5-hlor-1-metil-2-oksohinolīn-3-karboksamīdu no 5-hlor-N-etil-3-hidroksi-1-metil-2,4-dioksi-N-fenil-1,2,3,4-tetrahidro-hinolīna-3-karboksamīda.

- (51) **C07D 409/12**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2248812**
A61K 31/192⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 3/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 10172951.5 (22) 26.06.2007
(43) 10.11.2010
(45) 25.12.2013
(31) 2006177099 (32) 27.06.2006 (33) JP
(62) EP07767983.5 / EP2041123
(73) Takeda Pharmaceutical Company Limited, 1-1, Doshomachi 4-chome Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-0045, JP
(72) YASUMA, Tsuneo, JP
NEGORO, Nobuyuki, JP
YAMASHITA, Masayuki, JP
ITOU, Masahiro, JP
(74) von Kreisler Selting Werner, Deichmannhaus am Dom, Bahnhofsvorplatz 1, 50667 Köln, DE
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV
(54) **KONDENSĒTI CIKLISKI SAVIENOJUMI KĀ GPR40 RECEPTORA MODULATORI**
FUSED CYCLIC COMPOUNDS AS GPR40 RECEPTOR MODULATORS
(57) 1. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu, attēlotu ar formulu (I):

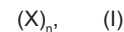


- kur
R¹ ir R⁵-SO₂- (kur R⁵ ir C₁₋₆alkilgrupa),
X ir saite vai divvērtīga ogļūdeņraža grupa;
R² un R³ ir vienādi vai atšķirīgi un katrs ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms, neobligāti aizvietota ogļūdeņraža grupa vai neobligāti aizvietota hidroksilgrupa;
R⁴ un R⁵ ir vienādi vai atšķirīgi un katrs ir C₁₋₆alkilgrupa, neobligāti aizvietota ar hidroksilgrupu(-ām);
gredzens A ir benzola gredzens, neobligāti ar papildu aizvietotāju(-iem), kas izvēlēti no halogēna atoma, neobligāti aizvietotas ogļūdeņraža grupas, neobligāti aizvietotas hidroksilgrupas un neobligāti aizvietotas aminogrupas;
gredzens B ir 5- līdz 7-locekļu gredzens;
Y ir saite vai CH₂; un
R ir neobligāti aizvietota hidroksilgrupa, vai tā sāls kombinācijā ar dipeptidilpeptidāzes IV inhibitoru, insulīna preparātu, PPAR funkcijas modulatoru, α-glikozidāzes inhibitoru, biguanīdu, sulfonilurīnvielu, mitiglinīdu vai tā kalcija sāls hidrātu vai nateglinīdu.
2. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur X ir C₁₋₆alkilēngrupa.
3. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur R² un R³ ir vienādi vai atšķirīgi un katrs ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms vai C₁₋₆alkilgrupa.
4. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur R⁴ un R⁵ ir vienādi vai atšķirīgi un katrs ir C₁₋₆alkilgrupa.
5. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur gredzens A ir neaizvietots benzola gredzens.
6. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur gredzens B ir tetrahidrofurāns.
7. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur Y ir CH₂.
8. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur R ir hidroksilgrupa.
9. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur savienojums, kas attēlots ar formulu (I), ir izvēlēts no [(3S)-6-((2',6'-dimetil-4'-[3-(metilsulfonyl)propoksi]bifenil-3-il)metoksi)-2,3-dihidro-1-benzofuran-3-il]etiķskābes; [(3S)-6-((3'-fluor-2',6'-dimetil-4'-[3-(metilsulfonyl)propoksi]bifenil-3-il)metoksi)-2,3-dihidro-1-benzofuran-3-il]etiķskābes; [(3S)-6-((3'-hlor-2',6'-dimetil-4'-[3-(metilsulfonyl)propoksi]bifenil-3-il)metoksi)-2,3-dihidro-1-benzofuran-3-il]etiķskābes;

- [(3S)-6-((3',5'-dihlor-2',6'-dimetil-4'-[3-(metilsulfonyl)propoksi]bifenil-3-il)metoksi)-2,3-dihidro-1-benzofuran-3-il]etiķskābes; un [(3S)-6-((2',6'-diethyl-4'-[3-(metilsulfonyl)propoksi]bifenil-3-il)metoksi)-2,3-dihidro-1-benzofuran-3-il]etiķskābes.
10. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kura ir [(3S)-6-((2',6'-dimetil-4'-[3-(metilsulfonyl)propoksi]bifenil-3-il)metoksi)-2,3-dihidro-1-benzofuran-3-il]etiķskābe kombinācijā ar pioglitazonu vai tā hidrohlorīdu.
11. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kura ir [(3S)-6-((2',6'-dimetil-4'-[3-(metilsulfonyl)propoksi]bifenil-3-il)metoksi)-2,3-dihidro-1-benzofuran-3-il]etiķskābe kombinācijā ar metformīnu vai tā hidrohlorīdu.
12. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kura ir [(3S)-6-((2',6'-dimetil-4'-[3-(metilsulfonyl)propoksi]bifenil-3-il)metoksi)-2,3-dihidro-1-benzofuran-3-il]etiķskābe kombinācijā ar alogliptīnu vai tā benzoātu.
13. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kura ir [(3S)-6-((2',6'-dimetil-4'-[3-(metilsulfonyl)propoksi]bifenil-3-il)metoksi)-2,3-dihidro-1-benzofuran-3-il]etiķskābe kombinācijā ar 2-[[6-[(3R)-3-amino-1-piperidinil]-3,4-dihidro-3-metil-2,4-diokso-1(2H)-pirimidin-5-il]metil]-4-fluorbenzonitrilu vai tā sukcinātu.
14. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai izmantošanai diabēta profilaksē vai ārstēšanā.

- (51) **A61K 38/10**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2251348**
A61K 38/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 38/08⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 10009304.6 (22) 28.01.2008
(43) 17.11.2010
(45) 15.01.2014
(31) 0702020 (32) 02.02.2007 (33) GB
899283 P 02.02.2007 US
(62) EP08701955.0 / EP2114988
(73) Novabiotics Limited, The Cruickshank Building, Craibstone, Aberdeen AB21 9TR, GB
(72) O'NEIL, Deborah, GB
(74) O'Neill, Michelle, Harrison IP, 1st Floor, Box Tree House, Northminster Business Park, Northfield Lane, York, YO26 6QU, GB
Svetlana MAKEJEVA, Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV
(54) **PEPTĪDI UN TO IZMANTOŠANA**
PEPTIDES AND THEIR USE

- (57) 1. Lineārs peptīds izmantošanai sēnīšu infekcijas ārstēšanā, pie kam peptīds sastāv no 9 līdz 15 aminoskābju sekvences, un visas aminoskābes minētajā sekvencē ir arginīns ar 0, 1 vai 2 aizvietojumiem aminoskābju sekvencē.
2. Peptīds izmantošanai sēnīšu infekcijas ārstēšanā saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam peptīds sastāv no aminoskābju sekvences saskaņā ar formulu (I)



- kurā X ir arginīns un n ir vesels skaitlis no 9 līdz 15.
3. Peptīds izmantošanai sēnīšu infekcijas ārstēšanā saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam n ir no 11 līdz 14.
4. Peptīds izmantošanai sēnīšu infekcijas ārstēšanā saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam n ir no 12 līdz 14.
5. Peptīds izmantošanai sēnīšu infekcijas ārstēšanā saskaņā ar 4. pretenziju, pie kam n ir izvēlēts no 13 un 14.
6. Peptīds izmantošanai sēnīšu infekcijas ārstēšanā saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam n ir no 9 līdz 13.
7. Peptīds izmantošanai sēnīšu infekcijas ārstēšanā saskaņā ar 6. pretenziju, pie kam n ir no 9 līdz 11.
8. Peptīds izmantošanai sēnīšu infekcijas ārstēšanā saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam n ir 13.
9. Peptīds izmantošanai sēnīšu infekcijas ārstēšanā saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam ārstējamā infekcija ir dermatofītu infekcija.

10. Peptīds izmantošanai sēnīšu infekcijas ārstēšanā saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, pie kam ārstējamā infekcija nav dermatofītu infekcija.

- (51) **C07K 16/22**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2252632**
A61K 39/395⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 35/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07K 19/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07K 14/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 09711869.9 (22) 20.02.2009
(43) 24.11.2010
(45) 15.01.2014
- (31) 66632 P (32) 20.02.2008 (33) US
61943 P 16.06.2008 US
139361 P 19.12.2008 US
- (86) PCT/US2009/001122 20.02.2009
(87) WO2009/105269 27.08.2009
- (73) AMGEN INC., One Amgen Center Drive, Thousand Oaks, CA 91320, US
(72) BOONE, Thomas, C., US
OLINER, Jonathan, D., US
LEE, Eunkyung, US
(74) Grünecker, Kinkeldey, Stockmair & Schwanhäusser Anwaltssozietāt, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **PRET ANGIOPOETĪNU-1 UN ANGIOPOETĪNU-2 VĒRSTAS ANTIVIELAS UN TO IZMANTOŠANA ANTIBODIES DIRECTED TO ANGIOPOETIN-1 AND ANGIOPOETIN-2 AND USE THEREOF**

(57) 1. Izolēta antiēviela vai tās antiēģēnu saistošs fragments, kas satur smagās ķēdes variāblo domēnu un vieglās ķēdes variāblo domēnu ar sekvencēm, kas izvēlētas no grupas, kas sastāv no:

- (a) SEQ ID NO: 4 un SEQ ID NO: 12,
(b) SEQ ID NO: 7 un SEQ ID NO: 12,
(c) SEQ ID NO: 3 un SEQ ID NO: 17,
(d) SEQ ID NO: 6 un SEQ ID NO: 12,
(e) SEQ ID NO: 5 un SEQ ID NO: 12,
(f) SEQ ID NO: 3 un SEQ ID NO: 12,
(g) SEQ ID NO: 7 un SEQ ID NO: 11,
(h) SEQ ID NO: 1 un SEQ ID NO: 12,
(i) SEQ ID NO: 7 un SEQ ID NO: 13,
(j) SEQ ID NO: 4 un SEQ ID NO: 13,
(k) SEQ ID NO: 2 un SEQ ID NO: 12,
(l) SEQ ID NO: 7 un SEQ ID NO: 10,
(m) SEQ ID NO: 3 un SEQ ID NO: 16,
(n) SEQ ID NO: 4 un SEQ ID NO: 11,
(o) SEQ ID NO: 3 un SEQ ID NO: 9,
(p) SEQ ID NO: 3 un SEQ ID NO: 11,
(q) SEQ ID NO: 3 un SEQ ID NO: 10,
(r) SEQ ID NO: 7 un SEQ ID NO: 15,
(s) SEQ ID NO: 7 un SEQ ID NO: 8,
(t) SEQ ID NO: 3 un SEQ ID NO: 15,
(u) SEQ ID NO: 7 un SEQ ID NO: 16 un
(v) SEQ ID NO: 7 un SEQ ID NO: 14,

turklāt minētā antiēviela vai tās antiēģēnu saistošais fragments specifiski saistās ar vismaz vienu no Tie 2 receptora ligāndiem Ang1 un Ang2.

2. Izolēta nukleīnskābes molekula, kura kodē antiēvielu vai tās antiēģēnu saistošo fragmentu saskaņā ar 1. pretenziju.

3. Vektors, kas satur nukleīnskābes molekulu saskaņā ar 2. pretenziju.

4. Saimniekšūna, kas satur vektoru saskaņā ar 3. pretenziju.

5. Metode antiēvielas vai tās antiēģēnu saistošā fragmenta saskaņā ar 1. pretenziju ražošanai, kas ietver minētās antiēvielas eksprēsēšanu saimniekšūnā.

6. Saimniekšūna saskaņā ar 4. pretenziju vai metode saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt minētā saimniekšūna ir CHO šūna.

7. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur antiēvielu vai tās antiēģēnu saistošo fragmentu saskaņā ar 1. pretenziju maisījumā ar farmaceutiski pieņemamu nesēju.

8. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 7. pretenziju, kas papildus satur molekulu, kas ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no

reportiera molekulas, ūdenī šķīstoša polimēra, antiēvielas Fc apgabala un citotoksiska līdzekļa.

9. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 8. pretenziju, turklāt minētais farmaceutiski pieņemamais nesējs ir farmaceutisks zaļu formas gatavošanas līdzeklis.

10. Antiēviela vai tās antiēģēnu saistošais fragments saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur cilvēka IgG konstanto apgabalu.

11. Antiēviela vai tās antiēģēnu saistošais fragments saskaņā ar 10. pretenziju, turklāt IgG konstantā apgabala izotips ir IgG1, IgG2, IgG3 vai IgG4.

12. Antiēviela vai tās antiēģēnu saistošais fragments saskaņā ar 11. pretenziju, kas papildus satur vieglās ķēdes konstanto domēnu.

13. Antiēviela vai tās antiēģēnu saistošais fragments saskaņā ar 12. pretenziju, turklāt vieglās ķēdes konstantais domēns ir kapa konstantais domēns.

14. Antiēviela vai tās antiēģēnu saistošais fragments saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur cilvēka imunoglobulīna konstanto apgabalu.

15. Antiēviela vai tās antiēģēnu saistošais fragments saskaņā ar 14. pretenziju, turklāt konstantā apgabala aminoskābju sekvences ir izvēlētas no cilvēka IgG1, IgG2, IgG3 un IgG4 sekvencēm un konstantā apgabala vieglās ķēdes aminoskābju sekvences ir izvēlētas no SEQ ID NO: 44 un 46.

16. Antiēģēnu saistošais fragments saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt fragments ir Fab, F(ab')₂, Fv fragments, vienķēdes antiēviela vai scFv fragments.

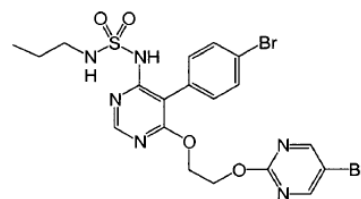
17. Antiēviela vai tās antiēģēnu saistošais fragments saskaņā ar jebkuru no 1. un no 10. līdz 16. pretenzijai, kas papildus satur detektējamu iezīmi.

18. Antiēviela vai tās antiēģēnu saistošais fragments saskaņā ar jebkuru no 1. un no 10. līdz 16. pretenzijai nevēlamas angioģēnēzes nomākšanai indivīdam, kam tas nepieciešams.

19. Antiēviela vai tās antiēģēnu saistošais fragments saskaņā ar 18. pretenziju, turklāt minētā nevēlamā angioģēnēze ir vēzis.

- (51) **A61K 31/216**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2254570**
A61K 31/513⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 45/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 35/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 09712334.3 (22) 19.02.2009
(43) 01.12.2010
(45) 18.12.2013
- (31) PCT/IB2008/050607 (32) 20.02.2008 (33) WO
(86) PCT/IB2009/050677 19.02.2009
(87) WO2009/104149 27.08.2009
- (73) Actelion Pharmaceuticals Ltd., Gewerbestrasse 16, 4123 Allschwil, CH
(72) CLOZEL, Martine, CH
REGENASS, Urs, CH
(74) Ruhlmann, Eric, Actelion Pharmaceuticals Ltd, Gewerbestrasse 16, CH-4123 Allschwil, CH
Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **KOMBINĀCIJA, KAS IETVER PAKLITAKSELU, OLNĪCU VĒŽA ĀRSTĒŠANAI COMBINATION COMPRISING PACLITAXEL FOR TREATING OVARIAN CANCER**

(57) 1. Produkts, kas satur savienojumu ar zemāk attēloto formulu (I)



(I)

vai šī savienojuma farmaceutiski pieņemamu sāli, kombinācijā ar paklitakselu vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli.

2. Produkts saskaņā ar 1. pretenziju terapeitiskai lietošanai vienlaicīgi, atsevišķi vai pēc laika perioda, olnīcu vēža ārstēšanai.
3. Produkts saskaņā ar 2. pretenziju, raksturīgs ar to, ka savienojums ar formulu (I) vai tā farmaceutiski pieņemamais sāls paredzēts ievadīšanai intravenozā vai intraperitoneālā ceļā.
4. Produkts saskaņā ar 2. pretenziju, raksturīgs ar to, ka savienojums ar formulu (I) vai tā farmaceutiski pieņemamais sāls paredzēts ievadīšanai orālā ceļā.
5. Produkts saskaņā ar 2. līdz 4. pretenziju, raksturīgs ar to, ka paklitaksels vai tā farmaceutiski pieņemamais sāls paredzēts ievadīšanai intravenozā vai intraperitoneālā ceļā.
6. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur produktu saskaņā ar 1. pretenziju kā aktīvo komponentu un vismaz vienu netoksisku pildvielu.
7. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 6. pretenziju, kura ir šķidrā veidā, piemērotā intravenozai vai intraperitoneālai ievadīšanai.
8. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 7. pretenziju, kas satur savienojumu ar formulu (I) vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli, un paklitakselu, vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli, šķīduma maisījumā ar polioksietilētu ricīnēļu un etanolu.
9. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 6. pretenziju, raksturīga ar to, ka polioksietilētās ricīnēļas un etanola maisījums satur 40 līdz 60 % (pēc tilpuma) polioksietilēto ricīnēļu etanolā.
10. Produkts saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai zāļu ražošanai, kas paredzētas olnīcu vēža ārstēšanai.

- | | | | |
|------|---|------|----------------|
| (51) | A61K 38/00 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 29/00 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | (11) | 2269622 |
| (21) | 10162989.7 | (22) | 29.06.2006 |
| (43) | 05.01.2011 | | |
| (45) | 25.12.2013 | | |
| (31) | 696173 P | (32) | 01.07.2005 |
| (62) | EP06748068.1 / EP1901759 | (33) | US |
| (73) | Index Pharmaceuticals AB, Scheeles väg 2, 171 77 Stockholm, SE | | |
| (72) | LÖFBERG, Robert, SE
von STEIN, Oliver, SE
ZARGARI, Arezou, SE | | |
| (74) | Holmberg, Martin Tor, Bergensträhle & Lindvall AB, P.O. Box 17704, 118 93 Stockholm, SE
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV | | |
| (54) | CpG OLIGONUKLEOTĪDI, KAS IZMANTOJAMI STEROĪDU AKTIVITĀTES PALIELINĀŠANAI NO STEROĪDIEM ATKARĪGĀ PACIENTĀ
CpG OLIGONUCLEOTIDES USED FOR ENHANCING STEROID ACTIVITY IN A STEROID DEPENDENT PATIENT | | |
| (57) | 1. Oligonukleotīds, kuram ir secība

5'-Xm-CG-Yn-3', | | |

kurā: X ir A, T, C vai G; Y ir A, T, C vai G; m=1-100, n=1-100 un vismaz viens CG dinukleotīds ir nemetilēts, kas ir izmantojams steroīdu efektivitātes palielināšanai no steroīdiem atkarīgā pacientā, kuru nevar atradināt no sistēmiskās vai lokālās steroīdu ievadīšanas, pie kam minētais pacients cieš no iekaisuma stāvokļa.

2. Oligonukleotīds izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam minēto iekaisuma stāvokli izvēlas no rindas, kas sastāv no čūlainā kolīta, Krona slimības, reimatoīdā artrīta, psoriāzes, emfizēmas, astmas un hroniskās obstruktīvās plaušu slimības.

3. Oligonukleotīds izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam attiecīgā laika brīdī pacients ir pakļauts pretiekaisuma ārstēšanai.

4. Oligonukleotīds izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam oligonukleotīds satur vismaz vienu nukleotīdu ar skeleta modifikāciju.

5. Oligonukleotīds izmantošanai saskaņā ar 4. pretenziju, pie kam skeleta modifikācija ir skeleta fosfātu modifikācija.

6. Oligonukleotīds izmantošanai saskaņā ar 5. pretenziju, pie kam skeleta fosfātu modifikācija ir fosfortioātu vai fosforditioātu modifikācija.

7. Oligonukleotīds izmantošanai saskaņā ar 5. pretenziju, pie kam skeleta fosfātu modifikācijā ir ietvertas 5' starpnukleotīdu saites vai 3' starpnukleotīdu saites.

8. Oligonukleotīds izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam minētais oligonukleotīds ir oligonukleotīds, kas sastāv no DNS vai DNS analoga, vai mīmiķa, izvēlēta no rindas, kas sastāv no metilfosfonāta, N3'->P5'-fosforamidāta, morfolīna, peptīdu nukleīnskābes (PNS), aizslēgtās nukleīnskābes (ASNS), arabinozilnukleīnskābes (ANS), fluorarabinozilnukleīnskābes (FANS) un metoksietilnukleīnskābes (MOE).

9. Oligonukleotīds izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam minētais oligonukleotīds satur vismaz vienu modificēta cukura fragmenta nukleobāzi.

10. Oligonukleotīds izmantošanai saskaņā ar 9. pretenziju, pie kam modificētais cukura fragments ir 2'-O-metoksietilcukura fragments.

11. Oligonukleotīds izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam oligonukleotīdu ievada kombinācijā ar steroīdiem.

12. Oligonukleotīds izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam oligonukleotīda daudzums, ko ievada pacientam, ir aptuveni no 0,01 µg līdz aptuveni 100 mg uz ķermeņa svara kg.

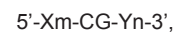
13. Oligonukleotīds izmantošanai saskaņā ar 12. pretenziju, pie kam oligonukleotīda daudzums, ko ievada pacientam, ir aptuveni no 0,1 µg līdz aptuveni 10 mg uz ķermeņa svara kg.

14. Oligonukleotīds izmantošanai saskaņā ar 12. pretenziju, pie kam oligonukleotīda daudzums, ko ievada pacientam, ir aptuveni no 1 µg līdz aptuveni 5 mg uz ķermeņa svara kg.

15. Oligonukleotīds izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam oligonukleotīdu ievada vienu reizi.

16. Oligonukleotīds izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam oligonukleotīdu ievada vairāk kā vienu reizi.

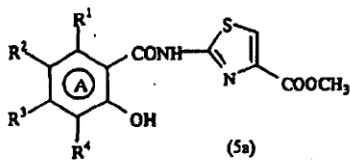
17. Oligonukleotīda, kuram ir šāda secība



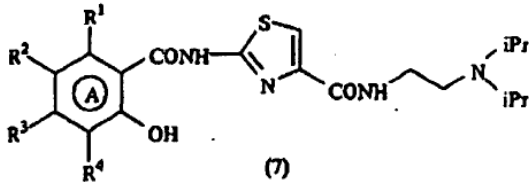
izmantošana, ražojot medikamentu steroīdu efektivitātes palielināšanai no steroīdiem atkarīgā pacientā, kuru nevar atradināt no sistēmiskās vai lokālās steroīdu ievadīšanas, kurā: X ir A, T, C vai G; Y ir A, T, C vai G; m=1-100, n=1-100 un vismaz viens CG nukleotīds ir nemetilēts, pie kam minētais pacients cieš no iekaisuma stāvokļa.

18. Izmantošana saskaņā ar 17. pretenziju, pie kam minēto iekaisuma stāvokli izvēlas no rindas, kas sastāv no čūlainā kolīta, Krona slimības, reimatoīdā artrīta, psoriāzes, emfizēmas, astmas un hroniskās obstruktīvās plaušu slimības.

- | | | | |
|------|--|------|----------------|
| (51) | C07D 277/56 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07C 51/377 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | (11) | 2269997 |
| (21) | 10010896.8 | (22) | 23.08.2005 |
| (43) | 05.01.2011 | | |
| (45) | 26.02.2014 | | |
| (31) | 2004242759 | (32) | 23.08.2004 |
| (62) | EP05774659.6 / EP1792888 | (33) | JP |
| (73) | ZERIA PHARMACEUTICAL CO., LTD., 10-11, Nihonbashi Kobuna-cho, Chuo-ku, Tokyo 103-8351, JP | | |
| (72) | NAGASAWA, Masaaki, JP
ASAMI, Kazuyasu, JP
NAKAO, Ryu, JP
TANAKA, Nobuyuki, JP
AIDA, Yoshiyuki, JP | | |
| (74) | Blodig, Wolfgang, et al, Wächtershäuser & Hartz Patent-anwaltspartnerschaft, Ottostrasse 4, 80333 München, DE
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV | | |
| (54) | PAŅĒMIENS AMINOTIAZOLA ATVASINĀJUMA RAŽOŠANAI UN RAŽOŠANAS STARPPRODUKTS METHOD FOR PRODUCING AMINOTHIAZOLE DERIVATIVE AND PRODUCTION INTERMEDIATE | | |
| (57) | 1. Savienojuma, kas attēlots ar formulu (5a): | | |



izmantošana par starpproduktu savienojuma, kas attēlots ar formulu (7)



(kur gredzens A attēlo benzola gredzenu vai 6-locekļu aromātisku heterociklu; R¹ attēlo ūdeņraža atomu, C₁₋₆ alkilgrupu, halogēna atomu, nitrogrupu, aminogrupu, mono-C₁₋₆ alkilaminogrupu vai di-C₁₋₆ alkilaminogrupu; un vismaz viens no R², R³ un R⁴ attēlo metoksigrupu un pārējie katrs attēlo ūdeņraža atomu, C₁₋₆ alkilgrupu, halogēna atomu, nitrogrupu, aminogrupu, mono-C₁₋₆ alkilaminogrupu vai di-C₁₋₆ alkilaminogrupu), iegūšanai.

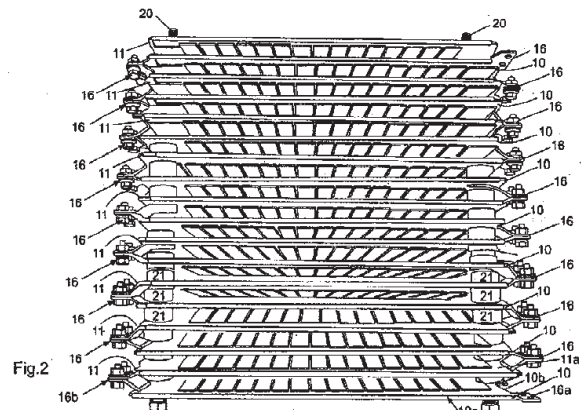
2. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, kur R¹ ir ūdeņraža atoms; R² un R³ katrs ir metoksigrupa; un R⁴ ir ūdeņraža atoms.

gadījumā, ja vēja energoiekārtas elektroģenerators ģenerētā jauda nevar tikt piegādāta vai nav jāpiegādā tīklam, šī elektriskā jauda tiek pilnībā vai daļēji izkliedēta ar lielas jaudas rezistora palīdzību.

3. Vēja energoiekārta atbilstoši 2. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka elektriskās jaudas izkliedēšana ar lielas jaudas rezistora palīdzību nodrošina tādu elektrisko regulēšanu, kas padara nevajadzīgu vēja energoiekārtas rotora lāpstu slīpuma leņķa koriģēšanu.

4. Vēja energoiekārta atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka kā slodzes rezistors tiek lietots vismaz viens lielas jaudas rezistors.

5. Vēja energoiekārta atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka vairāki lielas jaudas rezistori ir izvietoti skapjos vai citos piemērotos statīvos.



- (51) **H01C 3/10**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2270821**
- F03D 7/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- H01C 1/16**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 10185934.6 (22) 08.07.2005
- (43) 05.01.2011
- (45) 27.11.2013
- (31) 102004033680 (32) 09.07.2004 (33) DE
- (62) EP05770177.3 / EP1769514
- (73) Wobben Properties GmbH, Dreekamp 5, 26605 Aurich, DE
- (72) WOB BEN, Aloys, DE
- (74) Eisenführ, Speiser & Partner, Postfach 10 60 78, 28060 Bremen, DE
- Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV

(54) **VĒJA ENERGOIEKĀRTA AR PĀRVEIDOTĀJU UN VISMAZ VIENU LIELAS JAUDAS REZISTORU WIND ENERGY SYSTEM WITH A CONVERTER AND AT LEAST ONE HIGH PERFORMANCE RESISTOR**

(57) 1. Vēja energoiekārta ar pārveidotāju un vismaz vienu lielas jaudas rezistoru, kurš satur vairākus rezistoru elementus (10, 11), kuri elektriski ir savienoti virknē un katram no kuriem ir pirmā un otrā puse (10a, 10b; 11a, 11b) un pirmais un otrais gals (10c, 10d; 11c, 11d), turklāt pirmajā galā (10c, 11c) ir izveidots pirmais savienojums (16a) un otrajā galā (10d; 11d) ir izveidots otrs savienojums (16b) rezistoru elementu (10, 11) pievienošanai,

kas raksturīga ar to, ka pirmajam un otrajam savienojumam (16a, 16b) katram ir iekšējais posms un ārējais posms, turklāt:

pirmā savienojuma (16a) iekšējais posms ir noliekts iepriekš noteiktā leņķī pret rezistoru elementa (10, 11) pirmo pusi (10a, 11a), un pirmā savienojuma (16a) ārējais posms atrodas plaknē, kas būtībā ir paralēla rezistoru elementa (10, 11) plaknei,

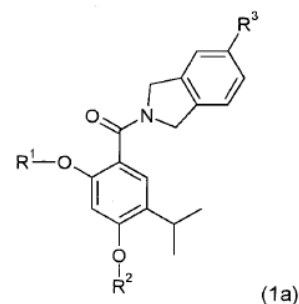
otrā savienojuma (16b) iekšējais posms ir noliekts iepriekš noteiktā leņķī pret rezistora elementa (10, 11) otru pusi (10b, 11b), un otrā savienojuma (16b) ārējais posms atrodas plaknē, kas ir būtībā paralēla rezistoru elementa (10, 11) plaknei, turklāt lielas jaudas rezistors ir novietots pārveidotāja tuvumā,

pirmais savienojums (16a) ir nobīdīts pirmajā iepriekš noteiktajā attālumā (d1) no rezistoru elementa (10, 11) gareniskās ass (25), un otrais savienojums (16a) ir nobīdīts otrajā iepriekš noteiktajā attālumā (d2) no rezistora elementa (10, 11) gareniskās ass (25),

pirmais attālums (d1) atbilst otrajam attālumam (d2) un pirmais un otrais savienojumi ir nobīdīti no gareniskās ass pretējos virzienos.

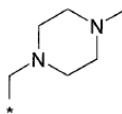
2. Vēja energoiekārta atbilstoši 1. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka vēja energoiekārtai ir elektroģenerators, un ar to, ka

- (51) **C07D 209/44**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2271618**
- A61K 31/4035**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- A61P 35/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 09731468.6 (22) 09.04.2009
- (43) 12.01.2011
- (45) 21.05.2014
- (31) 0806527 (32) 11.04.2008 (33) GB
- 44256 11.04.2008 US
- (86) PCT/GB2009/050358 09.04.2009
- (87) WO2009/125230 15.10.2009
- (73) Astex Therapeutics Limited, 436 Cambridge Science Park, Milton Park, Cambridge, Cambridgeshire CB4 0QA, GB
- (72) FREDERICKSON, Martyn, GB
- (74) Cooke, Richard Spencer, Elkington and Fife LLP, Prospect House, 8 Pembroke Road, Sevenoaks, Kent TN13 1XR, GB
- Svetlana MAKEJEVA, Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV
- (54) **FARMACEITISKI SAVIENOJUMI PHARMACEUTICAL COMPOUNDS**
- (57) 1. Savienojums ar formulu (1a):



vai tā sāls, solvāts, N-oksīds vai tautomērs; kur R¹ ir R^{1a} un R² ir R^{2a}; vai R¹ ir R^{1b} un R² ir R^{2b}; ar nosacījumu, ka katrā gadījumā vismaz viens no R¹ un R² nav ūdeņradis; R^{1a} un R^{2a} ir vienādi vai atšķirīgi, un katrs no tiem tiek atlasīts no ūdeņraža, C₁₋₄ alkilgrupas, C₂₋₄ alkenilgrupas un C₂₋₄ alkinilgrupas, kur C₁₋₄ alkilgrupa ir aizvietota ar C₁₋₂ alkoksigrupu; R^{1b} un R^{2b} ir vienādi vai atšķirīgi un tiek atlasīti no ūdeņraža, C(O)NR⁴R⁵, C(O)R⁶ un C(O)OR⁶, kur R⁶ ir C₁₋₄ alkilgrupa, R⁴ un

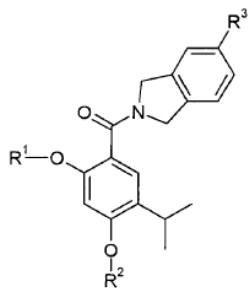
R⁵ abi ir C₁₋₄alkilgrupas, vai NR⁴R⁵ veido 4 līdz 7 locekļu piesātinātu heterociklisku gredzenu, kas neobligāti satur otru heteroatomu gredzenā, kas atlasīts no O, N vai S un N un S oksidētām formām, heterocikliskais gredzens pēc izvēles tiek aizvietots ar vienu vai divām C₁₋₄alkilgrupām un/vai vienu vai divām oksogrupām; un R³ ir D grupa:



D ,

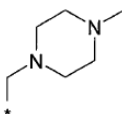
kur zvaigznīte apzīmē vietu, kur tā pievienojas izoindolīna gredzenam; taču, izņemot tādu savienojumu kā etiķskābes 5-acetoksi-4-izopropil-2-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-karbonil]-fenilesteris.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, ar formulu (1b):



(1b)

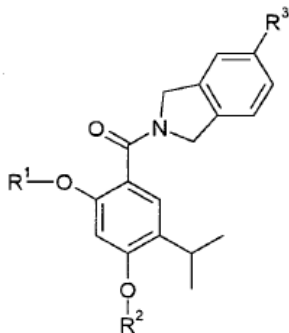
vai tā sāls, solvāts, N-oksīds vai tautomērs; kur R¹ ir R^{1a} un R² ir R^{2a}; vai R¹ ir R^{1b} un R² ir R^{2b}; ar nosacījumu, ka katrā gadījumā vismaz viens no R¹ un R² nav ūdeņradis; R^{1a} un R^{2a} ir vienādi vai atšķirīgi, un katrs no tiem tiek atlasīts no ūdeņraža, C₁₋₂alkilgrupas, C₂₋₃alkenilgrupas un C₂₋₃alkinilgrupas, kur C₁₋₂alkilgrupa ir aizvietota ar metoksigrupu; R^{1b} un R^{2b} ir vienādi vai atšķirīgi un tiek atlasīti no ūdeņraža un C(O)NR⁴R⁵, kur R⁴ un R⁵ abi ir C₁₋₄alkilgrupas; vai NR⁴R⁵ veido 4 līdz 7 locekļu piesātinātu heterociklisku gredzenu, kas neobligāti satur otru heteroatomu gredzenā, kas atlasīts no O, N vai S un N un S oksidētām formām, heterocikliskais gredzens neobligāti tiek aizvietots ar vienu vai divām C₁₋₄alkilgrupām un/vai vienu vai divām oksogrupām; vai R^{1b} un R^{2b} ir vienādi vai atšķirīgi un tiek atlasīti no ūdeņraža un C(O)R^{6a}, kurā R^{6a} ir C₂₋₄alkilgrupa; vai R^{1b} un R^{2b} ir vienādi vai atšķirīgi un tiek atlasīti no ūdeņraža un C(O)R⁶, kurā R⁶ tiek atlasīts no metilgrupas, etilgrupas, propilgrupas, izopropilgrupas, butilgrupas, 1-metilpropilgrupas, 2-metilpropilgrupas un *tert*-butilgrupas; vai viens no R^{1b} un R^{2b} ir C(O)NR^{4a}R^{5a}, kurā R^{4a} un R^{5a} abi ir C₁₋₄alkilgrupas, un otrs no R^{1b} un R^{2b} tiek atlasīts no C(O)R⁶ un C(O)OR⁶; un R³ ir D grupa:



D ,

kurā zvaigznīte apzīmē vietu, kurā tā pievienojas izoindolīna gredzenam.

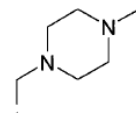
3. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, ar formulu (1c):



(1c)

vai tā sāls, solvāts, N-oksīds vai tautomērs; kurā R¹ ir R^{1b} un R² ir R^{2b}; ar nosacījumu, ka vismaz viens no R¹ un R² nav ūdeņradis;

R^{1b} un R^{2b} ir vienādi vai atšķirīgi un tiek atlasīti no ūdeņraža un C(O)NR⁴R⁵, kurā R⁴ un R⁵ abi ir C₁₋₄alkilgrupas; vai NR⁴R⁵ veido 4 līdz 7 locekļu piesātinātu heterociklisku gredzenu, kas neobligāti satur otru heteroatomu gredzenā, kas atlasīts no O, N vai S un N un S oksidētām formām, heterocikliskais gredzens neobligāti tiek aizvietots ar vienu vai divām C₁₋₄alkilgrupām un/vai vienu vai divām oksogrupām; un R³ ir D grupa:



D ,

kurā zvaigznīte apzīmē vietu, kurā tā pievienojas izoindolīna gredzenam.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R¹ ir R^{1a} un R² ir R^{2a}, un katrs no R^{1a} un R^{2a} tiek atlasīts no ūdeņraža, metilgrupas, metoksimetilgrupas un allilgrupas.

5. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā R¹ ir R^{1b} un R² ir R^{2b}, un R^{1b} un R^{2b} ir vienādi vai atšķirīgi un tiek atlasīti no ūdeņraža, C(O)NR⁴R⁵, C(O)R⁶ un C(O)OR⁶, kurā R⁶ ir C₁₋₄alkilgrupa, R⁴ un R⁵ abi ir C₁₋₄alkilgrupas.

6. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R⁶ tiek atlasīts no metilgrupas, etilgrupas, propilgrupas, izopropilgrupas, butilgrupas, 1-metilpropilgrupas, 2-metilpropilgrupas un *tert*-butilgrupas.

7. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju, kurā R⁶ ir C₂₋₄alkilgrupa.

8. Savienojums saskaņā ar 5. pretenziju, kurā:

- R^{1b} un R^{2b} ir vienādi vai atšķirīgi un tiek atlasīti no ūdeņraža un C(O)OR⁶; un

- R⁶ ir *tert*-butilgrupa vai izopropilgrupa.

9. Savienojums saskaņā ar 3. vai 5. pretenziju, kurā R^{1b} un R^{2b} ir vienādi vai atšķirīgi un katrs no tiem ir ūdeņradis vai grupa C(O)NR⁴R⁵, kurā NR⁴R⁵ veido 4 līdz 7 locekļu piesātinātu heterociklisku gredzenu, kas neobligāti satur otru heteroatomu gredzenā, kas atlasīts no O, N vai S un N un S oksidētām formām, heterocikliskais gredzens neobligāti tiek aizvietots ar vienu vai divām C₁₋₄alkilgrupām un/vai vienu vai divām oksogrupām.

10. Savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, kurā piesātinātais heterocikliskais gredzens tiek atlasīts no pirolidīna, piperidīna, piperazīna, 4-metilpiperazīna un morfolīna.

11. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas tiek atlasīts no: (2-alliloksi-4-hidroksi-5-izopropilfenil)-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-il]metanona; (4-alliloksi-2-hidroksi-5-izopropilfenil)-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-il]metanona; (2,4-*bis*-alliloksi-5-izopropilfenil)-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-il]metanona; [4-hidroksi-5-izopropil-2-(metoksimetiloksi)fenil]-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-il]metanona; [2-hidroksi-5-izopropil-4-(metoksimetiloksi)fenil]-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-il]metanona; [5-izopropil-2,4-*bis*-(metoksimetiloksi)fenil]-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-il]metanona; dietilkarbamīnskābes 5-dietilkarbamioiloksi-2-izopropil-4-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-karbonil]fenilestera; dimetilkarbamīnskābes 5-dimetilkarbamioiloksi-2-izopropil-4-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-karbonil]fenilestera; 2-[2,4-*bis*-(pirolidīn-1-ilkarboniloksi)-5-izopropilbenzoiil]-5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindola; 2-[2,4-*bis*-(morfolīn-4-ilkarboniloksi)-5-izopropilbenzoiil]-5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindola; dietilkarbamīnskābes 5-hidroksi-4-izopropil-2-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-karbonil]fenilestera; dietilkarbamīnskābes 5-hidroksi-2-izopropil-4-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-karbonil]fenilestera; dimetilkarbamīnskābes 5-hidroksi-4-izopropil-2-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-karbonil]fenilestera; dimetilkarbamīnskābes 5-hidroksi-2-izopropil-4-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-karbonil]fenilestera;

2-[2-(pirolidin-1-ilkarboniloksi)-4-hidroksi-5-izopropilbenzoil]-5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindola;
 2-[4-(pirolidin-1-ilkarboniloksi)-2-hidroksi-5-izopropilbenzoil]-5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindola;
 2-[2-(morfolin-4-ilkarboniloksi)-4-hidroksi-5-izopropilbenzoil]-5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindola;
 2-[4-(morfolin-4-ilkarboniloksi)-2-hidroksi-5-izopropilbenzoil]-5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindola;
 ogļskābes *terc*-butilestera 5-dimetilkarbamoiloksi-4-izopropil-2-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-karbonil]fenilestera;
 ogļskābes 5-*terc*-butoksikarboniloksi-4-izopropil-4-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-karbonil]fenilestera *terc*-butilestera;
 2,2-dimetilpropionskābes 5-(2,2-dimetilpropioniloksi)-2-izopropil-4-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-karbonil]fenilestera;
 izosviestskābes 5-izobutiriloksi-2-izopropil-4-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-karbonil]fenilestera;
 un to sāļiem, solvātiem, tautomēriem un N-oksīdiem.

12. Dimetilkarbamīnskābes 5-hidroksi-2-izopropil-4-[5-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-1,3-dihidroizoindol-2-karbonil]fenilesteris.

13. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

14. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai vai farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 13. pretenziju izmantošanai:

(i) par Hsp90 inhibitoru; vai
 (ii) Hsp90 pastarpinātas slimības vai stāvokļa profilaksē un ārstēšanā; vai

(iii) slimības, vai stāvokļa ārstēšanā, kas ietver vai rodas no anomālas šūnu augšanas zīdītājiem; vai

(iv) vēža ārstēšanā; vai

(v) urīnpūšļa, krūts, resnās zarnas (piem., kolorektālo karcinomu, tādu kā resnās zarnas adenokarcinoma un resnās zarnas adenoma), nieru, epidermas, aknu, plaušu karcinomas, piemēram, adenokarcinomas, sīkšūnu plaušu vēža un nesīkšūnu plaušu karcinomas, barības vada, žultspūšļa, olnīcas, aizkuņģa dziedzera karcinomas, piem., eksokrīnās aizkuņģa dziedzera karcinomas, kuņģa, dzemdes kakla, vairogdziedzera, prostatas, kuņģa un zarnu sistēmas karcinomas, piemēram, gastrointestinālu stromālu audzēju, vai ādas karcinomas, piemēram, skvamozo šūnu karcinomas; limfotādās izcelsmes asinsrades sistēmas audzēja, piemēram, leukēmijas, akūtas limfocītiskās leukēmijas, hroniskas limfocītiskās leukēmijas, B šūnu limfomas (tādas kā difūza lielo B šūnu limfoma), T šūnu limfomas, Hodžkina limfomas, ne-Hodžkina limfomas, mataino šūnu limfomas vai Bērķita limfomas; mielotādās izcelsmes asinsrades sistēmas audzēja, ieskaitot akūtu mieloīdo leukēmiju, hronisku mieloīdo leukēmiju, mielogēnās leukēmijas un pret imatinibu jutīgas un refraktori hroniskas mielogēnas leukēmijas, mielodisplastiskā sindroma, pret borteozomību jutīgu refraktori multiplo mielomu, mieloproliferatīvo slimību vai promielocītisko leukēmiju; folikulu vairogdziedzera vēža; mezenhimālās izcelsmes audzēja, piemēram, fibrosarkomas vai rbdomiosarkomas; centrālās vai perifēriskās nervu sistēmas audzēja, piemēram, astrocitomas, neiroblastomas, gliomas (augstas pakāpes gliomas) vai neirilemmomas; melanomas (piem., ļaundabīgas vai metastātiskas melanomas); seminomas; teratokarcinomas; osteosarkomas; keratoakantomas; folikulu vairogdziedzera vēža vai Kapoši sarkomas ārstēšanā. Nākamais mezenhimālās izcelsmes audzēja piemērs ir Jūinga sarkoma; vai

(vi) urīnpūšļa, krūts, resnās zarnas (piem., kolorektālo karcinomu, tādu kā resnās zarnas adenokarcinoma un resnās zarnas adenoma), nieru, epidermas, aknu, plaušu karcinomas, piemēram, adenokarcinomas, sīkšūnu plaušu vēža un nesīkšūnu plaušu karcinomas, žultspūšļa, olnīcas, aizkuņģa dziedzera karcinomas, piem., eksokrīnās aizkuņģa dziedzera karcinomas, kuņģa, vairogdziedzera, prostatas, kuņģa un zarnu sistēmas karcinomas, piemēram, gastrointestinālu stromālu audzēju, vai ādas karcinomas, piemēram, skvamozo šūnu karcinomas; limfotādās izcelsmes asinsrades sistēmas audzēja, piemēram, leukēmijas, akūtas limfocītiskās leukēmijas, hroniskas limfocītiskās leukēmijas, B šūnu limfomas (tādas kā difūza lielo B šūnu limfoma), T šūnu limfomas, Hodžkina limfomas, ne-Hodžkina limfomas, mataino šūnu limfomas vai Bērķita limfomas; mielotādās izcelsmes asinsrades sistēmas audzēja, ieskaitot akūtu mieloīdo leukēmiju, hronisku mieloīdo leukēmiju, mielogēnās leukē-

mijas un pret imatinibu jutīgas un refraktori hroniskas mielogēnas leukēmijas, mielodisplastiskā sindroma, pret borteozomību jutīgu refraktori multiplo mielomu, mieloproliferatīvo slimību vai promielocītisko leukēmiju; folikulu vairogdziedzera vēža; mezenhimālās izcelsmes audzēja, piemēram, fibrosarkomas vai rbdomiosarkomas; centrālās vai perifēriskās nervu sistēmas audzēja, piemēram, astrocitomas, gliomas (augstas pakāpes gliomas); melanomas (piem., ļaundabīgas vai metastātiskas melanomas); osteosarkomas vai folikulu vairogdziedzera vēža ārstēšanā. Nākamais mezenhimālās izcelsmes audzēja piemērs ir Jūinga sarkoma; vai

(vii) vēža ārstēšanā, kas atlasīts no metastātiska krūts vēža, kas ir HER2 pozitīvs; prostatas adenokarcinomas; metastātiskas melanomas; nesīkšūnu plaušu karcinomas (NSCLC); sīkšūnu plaušu karcinomas (SCLC); augstas pakāpes gliomām; gastrointestināliem stromāliem audzējiem (GIST); kolorektālā vēža; glioblastomas; melanomas; metastātiska vairogdziedzera vēža; prostatas vēža; un taisnās zarnas vēža; vai

(viii) vēža ārstēšanā, kas atlasīts no kolorektālā vēža; glioblastomas; melanomas; metastātiska vairogdziedzera vēža; prostatas vēža; un taisnās zarnas vēža; vai

(ix) medicīnā.

15. Savienojuma izmantošana, kā definēts jebkurā no 1. līdz 12. pretenzijai, vai 13. pretenzijai atbilstošas farmaceutiskas kompozīcijas izmantošana medikamenta vienam vai vairākiem izmantošanas mērķiem, kā definēts 14. pretenzijā, ražošanai.

(51) **A61P 17/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 35/407⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 8/27⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 8/64⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 8/67⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61Q 19/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 8/97⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 8/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 8/11⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 8/19⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 8/92⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(11) **2280684**

(21) 09721645.1

(22) 06.03.2009

(43) 09.02.2011

(45) 04.12.2013

(31) 0804957

(32) 18.03.2008

(33) GB

(86) PCT/GB2009/000621

06.03.2009

(87) WO2009/115769

24.09.2009

(73) Taylor, Robert Peter, 1 Blomfield Road, Little Venice, London W9 1AH, GB

Laivani, Kartar Singh, 1 Apsley Way, London NW2 7HF, GB

(72) TAYLOR, Robert Peter, GB

LALVANI, Kartar Singh, GB

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

(54) **KOMPOZĪCIJA MATU, ĀDAS UN NAGU VESELĪBAS SAGLABĀŠANAI**
COMPOSITION FOR HAIR, SKIN AND NAIL HEALTH MAINTENANCE

(57) 1. Kompozīcija lietošanai matu, ādas un nagu veselības saglabāšanai, kas sastāv no tabletes, kura satur: 5 µg vitamīna D3, 40 mg dabīgas izcelsmes vitamīna E, 60 mg vitamīna C, 8 mg tiamīna (vitamīna B1), 4 mg riboflavīna (vitamīna B2), 18 mg niacīna (vitamīna B3), 10 mg vitamīna B6, 500 µg folskābes, 9 µg vitamīna B12, 45 µg biotīna, 40 mg pantotēnskābes, 12 mg dzelzs, 75 mg magnija, 15 µg cinka, 200 µg joda, 0,5 mg mangāna, 1 mg vara, 50 µg hroma, 100 µg selēna, 10 mg L-cistīna, 2 mg dabīgu karotinoīdu maisījuma un 15 mg vīnogu sēklu ekstrakta (95 % proantociānīna), un papildu kapsulas, kas satur: 300 mg omega-3 zivju eļļas, 6 mg luteīna, 200 mg gurķenes eļļas, 50 mg upeņu sēklu eļļas, 4 mg likopēna 6 % ekstrakta un 5 mg koenzīma Q10.

2. Kompozīcija lietošanai matu, ādas un nagu veselības saglabāšanai, kas ietver gurķenes eļļu un omega-3 zivju eļļu, kuras sastāda kompozīcijas lielāko daļu, kā arī ietver proantociānīdīnus, koenzīmu Q10, likopēna 6 % ekstraktu un upeņu sēklu eļļu.

- (51) **A61K 31/731⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2303287**
A61P 11/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 27/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 37/08⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 09772137.7 (22) 30.06.2009
(43) 06.04.2011
(45) 11.12.2013
(31) 129507 P (32) 01.07.2008 (33) US
(86) PCT/EP2009/004696 30.06.2009
(87) WO2010/000437 07.01.2010
(73) Marinomed Biotechnologie GmbH, Veterinärplatz 1, 1210 Vienna, AT
(72) GRASSAUER, Andreas, AT
PRIESCHL-GRASSAUER, Eva, AT
(74) Bogensberger, Burkhard, et al, Bogensberger Patent- und Markenbüro, Fallsgasse 79492 Eschen, LI
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
- (54) **ANTIALERĢISKI JŪRAS BIOPOLIMĒRI**
ANTIALLERGIC MARINE BIOPOLYMERS
- (57) 1. *Jota*-karagināns antialerģiski efektīvā daudzumā izmantošanai par medikamentu alerģiska rinīta, alerģiska konjunktivīta vai alerģiskas astmas profilaksē, vai terapeitiskā ārstēšanā, turklāt minētais medikaments ir paredzēts lietošanai uz elpceļu vai acu gļotādu virsmām, ar nosacījumu, ka *jota*-karagināns būtībā ir bez *lambda*-karagināna.
2. *Jota*-karagināns izmantošanai par medikamentu saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt minētais medikaments ir paredzēts lietošanai uz deguna gļotādas vai acu gļotādas.
3. *Jota*-karagināns izmantošanai par medikamentu saskaņā ar 1. pretenziju, lai atjaunotu vai vairotu traucētu gļotādas adsorbācijas spēju.
4. *Jota*-karagināns izmantošanai par medikamentu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, turklāt minētais medikaments ir izgatavots kā deguna aerosols.
5. *Jota*-karagināna izmantošana antialerģiski efektīvā daudzumā farmaceitiskās kompozīcijas ražošanā alerģiska rinīta, alerģiska konjunktivīta vai alerģiskas astmas profilaksei, vai terapeitiskai ārstēšanai, turklāt minētā farmaceitiskā kompozīcija ir paredzēta lietošanai uz elpceļu vai acu gļotādu virsmām, ar nosacījumu, ka *jota*-karagināns būtībā ir bez *lambda*-karagināna.
6. *Jota*-karagināna izmantošana saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt minētā farmaceitiskā kompozīcija ir paredzēta lietošanai uz deguna gļotādas vai acu gļotādas.
7. *Jota*-karagināna izmantošana saskaņā ar 5. pretenziju, lai atjaunotu vai vairotu traucētu gļotādas adsorbācijas spēju.
8. *Jota*-karagināna izmantošana saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt minētā farmaceitiskā kompozīcija satur 0,05 līdz 5,0 masas %, parasti 0,1 līdz 2 masas % *jota*-karagināna.
9. *Jota*-karagināna izmantošana saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt minētā farmaceitiskā kompozīcija papildus satur fizioloģiski aktīvu sastāvdaļu, kas nav karagināns.
10. *Jota*-karagināna izmantošana saskaņā ar 9. pretenziju, turklāt sastāvdaļa ir izvēlēta no zāļu vai homeopātiskiem līdzekļiem, kas iegūti no dabiskiem augu vai minerālvielu avotiem.
11. *Jota*-karagināna izmantošana saskaņā ar 8. pretenziju, turklāt minētā farmaceitiskā kompozīcija papildus satur garšvielu, labāk izvēlētu no grupas, kas sastāv no mentola, mētras, zaļās mētras, piparmētras, eikalipta, lavandas, citrusa, citrona, laima vai jebkuras to kombinācijas.
12. *Jota*-karagināna izmantošana saskaņā ar 8. pretenziju, turklāt minētā farmaceitiskā kompozīcija papildus satur vismaz vienu piedevu, izvēlētu no grupas, kas sastāv no kālija dihromāta, biezinātāja, tāda kā sveķi vai ciete, irdinātāja, tāda kā nātrija cietes glikolāts vai šķērsšūts povidons, slīdvielas, tādas kā magnija stearāts, emulgatora, virsmaktīvas vielas, farmaceitiski pieņemamas pildvielas vai nesēja, pretslīpes vielas, granulēšanas līdzekļa, konservanta, krāsvielas.
13. *Jota*-karagināna izmantošana saskaņā ar 5. pretenziju, turklāt minētā farmaceitiskā kompozīcija ir izveidota kā šķidrums ar iepriekš izvēlētu viskozitāti 20 mPa-s vai mazāku, labāk no 1 līdz 10 mPa-s.
14. *Jota*-karagināna izmantošana saskaņā ar jebkuru no 5. līdz 13. pretenzijai, turklāt minētā farmaceitiskā kompozīcija ir izgatavota

kā deguna aerosols.

- (51) **B01D 35/147⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2310106**
B01D 35/153⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 09769357.6 (22) 26.06.2009
(43) 20.04.2011
(45) 05.03.2014
(31) 102008002727 (32) 27.06.2008 (33) DE
(86) PCT/EP2009/058053 26.06.2009
(87) WO2009/156509 30.12.2009
(73) Brita GmbH, Heinrich-Hertz-Strasse 4, 65232 Taunusstein, DE
(72) FREYSTEDT, Bernd, DE
NAMUR, Marc, DE
(74) Mehler Achler, Patentanwälte Bahnhofstraße 67, 65185 Wiesbaden, DE
Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV
- (54) **IERĪCE ŪDENS ATTĪRĪŠANAI, KONKRĒTĀK - FILTRĒŠANAS IERĪCE UN KASETE**
APPARATUS FOR TREATING WATER, PARTICULARLY FILTER APPARATUS, AND CARTRIDGE
- (57) 1. Ierīce ūdens attīrīšanai, kura ietver kaseti (10, 110), kas ietver tvertni (12, 112) apstrādes vielu uzņemšanai un savienojošo galviņu (20, 120), kurai ir vismaz viena ieplūdes atvere (30a, 130a) un vismaz viena izplūdes atvere (30b, 130B), un savienojošo ierīci (40, 140), kas ir aprīkota ar:
- savienojošās galviņas (20, 120) turētāju (42, 142), turklāt turētājam ir vismaz viena ieplūdes atvere (48a, 148a) un vismaz viena izplūdes atvere (48b, 148B),
 - vārsta ierīci (50, 150) ieplūdes atveres (48a, 148a) atvēršanai un aizvēršanai un
 - bloķēšanas ierīci (80, 180) kasetes (10, 110) savienošanai ar savienojošo ierīci (40, 140) veidā, kas ļauj to atvienot, ko raksturo tas, ka:
 - turētājam (42, 142) ir vismaz viena sānu sienīņa (44a, b, 144a, b), kurā ir izvietota ieplūdes atvere un izplūdes atvere (48a, b, 148a, b), un
 - vārsta ierīcei (50, 150) ir vārsta elements (52, 152), kas vismaz daļēji aptver savienojošo galviņu (20, 120) un ir ierīkots turētājā (42) kustīgā veidā,
 - vārsta elementam (52, 152) ir vismaz viens padziļinājums vai atvere (58a, b, 158a, b), kas savienojošās galviņas (20, 120) gala stāvoklī tiek salāgots vienā līmenī ar savienojošās galviņas (20, 120) ieplūdes atveri (30a, 130a) un turētāja (42, 142) izplūdes atveri (48a, 148a).
2. Ierīce saskaņā ar 1. pretenziju, ko raksturo tas, ka vārsta elements (52, 152) ir izvietots starp vismaz vienu turētāja (42, 142) sānu sienīņu (44a, b, 144a, b) un savienojošo galviņu (20, 120).
3. Ierīce saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, ko raksturo tas, ka vārsta elements (52, 152) ir uzstādīts rotējošā un/vai kustīgā veidā turētāja (42, 142) garenvirziena ass (2, 102) virzienā.
4. Ierīce saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, ko raksturo tas, ka vārsta elements (52, 152) mala, kas ir vārsta pret turētāja (42, 142) gala sienīņu (46, 146), ietver apakšdaļu (54, 154), kurā ir caurplūdes kanāls (56, 156).
5. Ierīce saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, ko raksturo tas, ka savienojošās galviņas (20, 120) ieplūdes atvere un izplūdes atvere (30a, b, 130a, b) ir izvietotas pretējās pusēs.
6. Ierīce saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, ko raksturo tas, ka bloķēšanas ierīce (80, 180) satur atsperes ierīci (90, 190), kas ir novietota starp turētāju (42, 142) un vārsta elementu (52, 152).
7. Ierīce saskaņā ar 6. pretenziju, ko raksturo tas, ka atsperes ierīce (90, 190) satur piespiedējatspēri.
8. Ierīce saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, ko raksturo tas, ka bloķēšanas ierīce (80, 180) satur vismaz vienu fiksējošo elementu (81, 181), kas iedarbojas uz savienojošo galviņu (20, 120).
9. Ierīce saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, ko raksturo tas, ka savienojošajā galviņā (20, 120) ir izveidots padziļinājums (132) un/vai izvīzījums (24).

10. Ierīce saskaņā ar 8. vai 9. pretenziju, ko raksturo tas, ka fiksējošais elements (81) ir veidots tā, lai tas tiktu nobloķēts savienojošās galviņas (20) ievirzīšanas kustības laikā un tiktu atbloķēts savienojošās galviņas (20) rotācijas kustības laikā.

11. Ierīce saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 10. pretenzijai, ko raksturo tas, ka fiksējošais elements (81) ir sprūds (82), kas ir izvietots turētāja (42) sānu sienā (44a, b) un stiepijas paralēli turētāja (42) garenvirzienā (2).

12. Ierīce saskaņā ar 8. vai 9. pretenziju, ko raksturo tas, ka fiksējošais elements (181) ir veidots tā, lai to nobloķētu savienojošās galviņas (12) ievirzīšanas kustības laikā un atbloķētu pretējas virzes kustības laikā savienojošās galviņas (120) izņemšanai.

13. Ierīce saskaņā ar 12. pretenziju, ko raksturo tas, ka bloķējošais elements (181) ir atspertienis (182) ar aiztura galvīņu (183a, b).

14. Ierīce saskaņā ar 13. pretenziju, ko raksturo tas, ka atspertienis (182) ir izvietots vārsta elementa (151) ārpusē.

15. Ierīce saskaņā ar 13. vai 14. pretenziju, ko raksturo tas, ka atspertienis (182) kopā ar aiztura galvīņu (183a, b) tiek virzīts savienotājā (143a, b), kas izvietots turētāja (142) sānu sienā (144a, b).

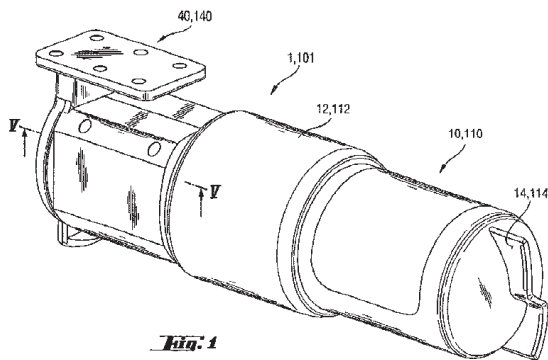
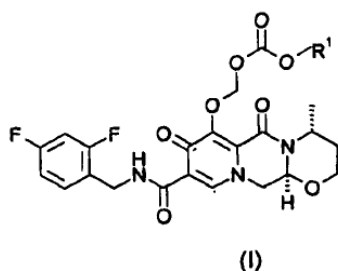


Fig. 1

- | | | | |
|------|--|------|----------------|
| (51) | C07D 498/14 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | (11) | 2320908 |
| | A61K 31/535 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| | A61P 31/18 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| (21) | 09800989.7 | (22) | 23.07.2009 |
| (43) | 18.05.2011 | | |
| (45) | 25.12.2013 | | |
| (31) | 83612 P | (32) | 25.07.2008 |
| (86) | PCT/US2009/051497 | | 23.07.2009 |
| (87) | WO2010/011812 | | 28.01.2010 |
| (73) | VIIV Healthcare Company, Five Moore Drive, Research Triangle Park, NC 27709, US | | |
| | Shionogi & Co., Ltd., 1-8 Doshomachi 3-chome Chuo-ku Osaka-shi, Osaka 541-0045, JP | | |
| (72) | JOHNS, Brian, Alvin, US | | |
| | WEATHERHEAD, Jason, Gordon, US | | |
| | AOYAMA, Yasunori, JP | | |
| | HAKOGI, Toshikazu, JP | | |
| (74) | Keen, Celia Mary, 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) | DOLUTEGRAVIRA PROZĀLES | | |
| | DOLUTEGRAVIR PRODRUGS | | |
| (57) | 1. Savienojums ar formulu (I): | | |



kur:

R¹ ir C₁-C₈alkilgrupa vai LR²;

L ir alkilēngrupa;

R² ir

a) hidroksilgrupa;

b) alkoksigrupa;

c) OR³, kur R³ ir P(O)(OH)₂ vai alkoksigrupa;

d) heterociklilgrupa, ko neobligāti aizvieto ar oksogrupu vai C₁-C₈alkilgrupu;

e) C(O)OR⁴, kur R⁴ ir H, C₁-C₈alkilgrupa vai XR⁵, kur X ir alkilēngrupa, un R⁵ ir C₆-C₁₀arilgrupa, heterociklilgrupa vai NR⁶R⁷, kur R⁶ un R⁷ neatkarīgi izvēlas no rindas, kas sastāv no H un C₁-C₈alkilgrupas; vai

f) C(O)R¹⁰, kur R¹⁰ ir heterociklilgrupa, ko neobligāti aizvieto ar XR¹¹, kur R¹¹ ir heterociklilgrupa;

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

2. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kur R¹ ir C₁₋₈alkilgrupa.

3. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kur R¹ ir LR², kur L ir C₁₋₈alkilēngrupa, un R² ir hidroksilgrupa vai alkoksigrupa.

4. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kur R¹ ir LR², kur L ir C₁₋₈alkilēngrupa, un R² ir -OP(O)(OH)₂, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

5. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kur R¹ ir LR², kur L ir C₁₋₈alkilēngrupa, un R² ir heterociklilgrupa, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

6. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, ko izvēlas no rindas, kas sastāv no:

{{(4R,12aS)-9-(((2,4-difluorfenil)metil)amino)karbonil)-4-metil-6,8-dioakso-3,4,6,8,12,12a-heksahidro-2H-pirid[1',2':4,5]pirazin[2,1-b][1,3]oksazin-7-il]oksi}metilmetilkarbonāta;

{{(4R,12aS)-9-(((2,4-difluorfenil)metil)amino)karbonil)-4-metil-6,8-dioakso-3,4,6,8,12,12a-heksahidro-2H-pirid[1',2':4,5]pirazin[2,1-b][1,3]oksazin-7-il]oksi}metil-2-(metiloksi)etilkarbonāta;

{{(4R,12aS)-9-(((2,4-difluorfenil)metil)amino)karbonil)-4-metil-6,8-dioakso-3,4,6,8,12,12a-heksahidro-2H-pirid[1',2':4,5]pirazin[2,1-b][1,3]oksazin-7-il]oksi}metil-2-hidroksietilkarbonāta;

{{(4R,12aS)-9-(((2,4-difluorfenil)metil)amino)karbonil)-4-metil-6,8-dioakso-3,4,6,8,12,12a-heksahidro-2H-pirid[1',2':4,5]pirazin[2,1-b][1,3]oksazin-7-il]oksi}metil-2-(fosfonoksi)etilkarbonāta;

{{(4R,12aS)-9-(((2,4-difluorfenil)metil)amino)karbonil)-4-metil-6,8-dioakso-3,4,6,8,12,12a-heksahidro-2H-pirid[1',2':4,5]pirazini[2,1-b][1,3]oksazin-7-il]oksi}metil-2-(4-morfolinil)etilkarbonāta; un tā farmaceutiski pieņemams sāls.

7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kur farmaceutiski pieņemams sāls ir hidrohlorīda sāls.

8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai izmantošanai medikamentozā terapijā.

9. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai izmantošanai vīrusu infekcijas ārstēšanai.

10. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 9. pretenziju, kur vīrusu infekcija ir HIV infekcija.

11. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai izmantošana, ražojot medikamentu vīrusu infekcijas ārstēšanai vai profilaksei.

12. Izmantošana saskaņā ar 11. pretenziju, kur vīrusu infekcija ir HIV infekcija.

13. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur efektīvu savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai daudzumu kopā ar farmaceutiski pieņemamu nesēju.

14. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 13. pretenziju tabletes, kapsulas, šķīduma vai suspensijas veidā.

15. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 9. vai 10. pretenziju, kuru ievada kopā ar citu terapeitisku līdzekli, ārstējot HIV infekciju.

(51) **C12Q 1/68**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(11) **2324126**

(21) 09807152.5

(22) 11.08.2009

(43) 25.05.2011

(45) 23.04.2014

(31) 88203 P

(32) 12.08.2008

(33) US

186673 P

12.06.2009

US

224647 P

10.07.2009

US

- (86) PCT/US2009/053373 11.08.2009
- (87) WO2010/019550 18.02.2010
- (73) Zinfandel Pharmaceuticals, Inc., One Science Drive, Durham, NC 27708, US
- (72) ROSES, Allen D., US
- (74) Weiss, Wolfgang, et al, Weickmann & Weickmann Patentanwälte, Postfach 86 08 20, 81635 München, DE
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV
- (54) **ALCHEIMERA SLIMĪBAS RISKA FAKTORU IDENTIFICĒŠANAS PAŅĒMIENS**
METHOD OF IDENTIFYING ALZHEIMER'S DISEASE RISK FACTORS

(57) 1. Paņēmiens Alzheimer slimības attīstīšanās riska noteikšanai pacientam, kurā:

(a) no minētā pacienta iegūtā bioloģiskā paraugā, kas satur DNS, nosaka TOMM40 gēna, kas saistīts ar paaugstinātu vai pazeminātu Alzheimer slimības risku, ģenētiskā varianta klātbūtni vai iztrūkumu, kur minētais variants ir delēcijas/insercijas polimorfisms TOMM40 gēna 6 intronā vai 9 intronā; un

(b) nosaka minētajam pacientam paaugstinātu vai pazeminātu Alzheimer slimības risku, kad minētais ģenētiskais variants ir klātesošs vai iztrūkstošs.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā papildus nosaka, vai minētais pacients ir Apo E2/E2, E2/E3, E2/E4, E3/E3, E3/E4, vai E4/E4 pacients.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā papildus nosaka, vai minētais pacients ir Apo E3/E3 vai E3/E4 pacients.

4. Ārstēšanai efektīva anti-Alzheimer slimības aktīvā līdzekļa daudzums, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no acetilholīn-esterāzes inhibitoriem, NMDA receptora antagonistiem, peroksissomas proliferatora aktivētā receptora (PPAR) agonistiem vai modulatoriem, antivielām, saplūšanas proteīniem, terapeitiskām RNS molekulām un to kombinācijām, izmantošanai Alzheimer slimības ārstēšanas paņēmienā, kas raksturīgs ar to, ka paņēmiens ietver stadiju, kurā nosaka, vai subjektam ir vai nav Alzheimer slimības attīstīšanās risks, kur risks tiek noteikts saskaņā ar paņēmienu atbilstoši jebkurai no 1. līdz 3. pretenzijai.

5. Ārstēšanai efektīva anti-Alzheimer slimības aktīvā līdzekļa daudzums izmantošanai saskaņā ar 4. pretenziju, kur minētais līdzeklis ir peroksissomas proliferatora aktivētā receptora (PPAR) agonists vai modulators.

6. Ārstēšanai efektīva anti-Alzheimer slimības aktīvā līdzekļa daudzums izmantošanai saskaņā ar 5. pretenziju, kur minētais modulators vai agonists ir tiazolidīndions.

7. Ārstēšanai efektīva anti-Alzheimer slimības aktīvā līdzekļa daudzums izmantošanai saskaņā ar 5. pretenziju, kur minētais modulators vai agonists ir tiazolidīndiona zāles.

8. Ārstēšanai efektīva anti-Alzheimer slimības aktīvā līdzekļa daudzums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 7. pretenzijai, kur minētā ārstēšana ir Alzheimer slimības sākuma aizkavēšana.

9. Ārstēšanai efektīva anti-Alzheimer slimības aktīvā līdzekļa daudzums izmantošanai saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, kur minētais TOMM40 gēna ģenētiskais variants ir poli-T insercijas variants NCBI struktūras 36.3 (rs10524523) genoma reģionā 50094889.

10. Ārstēšanai efektīva anti-Alzheimer slimības aktīvā līdzekļa daudzums izmantošanai saskaņā ar 6. vai 7. pretenziju, kur minētais TOMM40 gēna ģenētiskais variants ir poli-T insercijas variants NCBI struktūras 36.3 (rs10524523) genoma reģionā 50094889.

11. Ārstēšanai efektīva anti-Alzheimer slimības aktīvā līdzekļa daudzums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 8. pretenzijai, kur minētais delēcijas/insercijas polimorfisms (DIP) ir poli-T delēcijas/insercijas polimorfisms.

12. Ārstēšanai efektīva anti-Alzheimer slimības aktīvā līdzekļa daudzums izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 8. pretenzijai, kur minētais TOMM40 gēna ģenētiskais variants ir rs10524523.

13. Ārstēšanai efektīva anti-Alzheimer slimības aktīvā līdzekļa daudzums izmantošanai saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, kur minētais DIP ir poli-T delēcijas/insercijas polimorfisms ar poli-T starp 20 un 50 saistītiem bāzu pāriem.

14. Ārstēšanai efektīva anti-Alzheimer slimības aktīvā līdzekļa daudzums izmantošanai saskaņā ar 6. vai 7. pretenziju, kur minētais DIP ir poli-T delēcijas/insercijas polimorfisms ar poli-T starp 20 un 50 saistītiem bāzu pāriem rs10524523.

15. Ārstēšanai efektīva anti-Alzheimer slimības aktīvā līdzekļa daudzums izmantošanai saskaņā ar 10. pretenziju, kur minētā ārstēšana ietver Alzheimer slimības sākuma aizkavēšanu.

16. Paņēmiens Alzheimer slimības attīstīšanās riska prognozes noteikšanai pacientam, kas ietver pacienta profila iegūšanu, kurā minētajā pacienta profila iegūšanā:

nosaka vismaz vienas no ApoE 2, ApoE 3 vai ApoE 4 alēles klātbūtni vai trūkumu minētā pacienta bioloģiskajā paraugā un nosaka vismaz viena TOMM40 delēcijas/insercijas polimorfisma (DIP) klātbūtni vai trūkumu TOMM40 gēna 6 intronā vai 9 intronā, un tad

konvertē minēto pacienta profilu minētajā prognozē, kur minētais ApoE 2, ApoE 3 vai ApoE 4 alēles klātbūtne un minētā vismaz viena TOMM40 DIP polimorfisma klātbūtne identificē minēto pacientu, kā pacientu ar Alzheimer slimības attīstīšanās risku.

17. Paņēmiens saskaņā ar 16. pretenziju, kur minētais DIP ir poli-T delēcijas/insercijas polimorfisms.

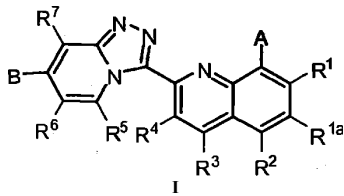
18. Paņēmiens saskaņā ar 16. pretenziju, kur minētais DIP ir rs10524523.

19. Paņēmiens saskaņā ar 16. pretenziju, kur TOMM40 gēna ģenētiskais variants ir delēcijas/insercijas polimorfisms rs10524523 ar poli-T starp 20 un 50 blakusesošiem bāzu pāriem.

20. Paņēmiens saskaņā ar 16. pretenziju, kurā papildus: no minētā pacienta iegūtā bioloģiskā paraugā, kas satur DNS, nosaka TOMM40 gēna, kas saistīts ar paaugstinātu vai pazeminātu Alzheimer slimības risku, ģenētiskā varianta klātbūtni vai trūkumu, kur minētais variants ir delēcijas/insercijas polimorfisms TOMM40 gēna 6 intronā vai 9 intronā; un

nosaka, vai minētais subjekts ir ar palielinātu vai pazeminātu Alzheimer slimības risku, kad minētais ģenētiskais variants ir klātesošs vai iztrūkstošs.

- (51) **C07D 471/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2334677**
A61K 31/47⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 09791625.8 (22) 18.08.2009
- (43) 22.06.2011
- (45) 09.10.2013
- (31) 89952 P (32) 19.08.2008 (33) US
175277 P 04.05.2009 US
- (86) PCT/US2009/054193 18.08.2009
- (87) WO2010/022076 25.02.2010
- (73) Array Biopharma, Inc., 3200 Walnut Street, Boulder, CO 80301, US
- (72) ALLEN, Shelley, US
CELESTE, Laura L., US
DAVIS, T. Gregg, US
DELISLE, Robert Kirk, US
GRESCHUK, Julie Marie, US
GROSS, Stefan, D., US
HICKEN, Erik, James, US
JACKSON, Leila, J., US
LYSSIKATOS, Joseph, P., US
KALLAN, Nicholas C., US
MARMSATER, Fredrik, P., US
MUNSON, Mark, C., US
PHENEGER, Jed, US
RAST, Bryson, US
ROBINSON, John, E., US
SCHLACHTER, Stephen T., US
TOPALOV, George T., US
WRIGHT, A. Dale, US
ZHAO, Qian, US
- (74) Office Freylinger, P.O. Box 48, 8001 Strassen, LU
Svetlana MAKEJEVA, Intelektuālā īpašuma juridiskā firma
LATISS, Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV
- (54) **TRIAZOLOPIRIDĪNA SAVIENOJUMI KĀ PIM KINĀZES INHIBITORI**
TRIAZOLOPYRIDINE COMPOUNDS AS PIM KINASE INHIBITORS
- (57) 1. Savienojums ar vispārējo formulu I:



vai tā farmaceutiski pieņemami sāļi, kur:

A ir OR¹⁰ vai NR¹¹R¹²;

B ir H, F, Cl, OR^a, (C₁₋₆alkilgrupa)NR^bR^c, (C₁₋₆alkilgrupa)OH, CH(OH)CH₂OH vai

C₁₋₄alkilgrupa;

R¹ ir H, F, Cl, Br, Me, ciklopropilgrupa vai CN;

R^{1a}, R², R³ un R⁴ ir neatkarīgi H, F, Cl, Br, Me vai CN;

R⁵ un R⁷ ir neatkarīgi H, F, Me vai CN;

R⁶ ir H, F, Me, Br, CN, ciklopropilgrupa, fenilgrupa, MeO- vai MeOCH₂CH₂O-;

R¹⁰ ir H, hetCyc¹, -(C₁₋₃alkilgrupa)hetCyc^{1a}, hetCyc², (CR¹⁷R¹⁸)_p- (CR¹³R¹⁴)CH₂NR¹⁵R¹⁶,

-(CR¹⁷R¹⁸)_p(CR¹³R¹⁴)CH₂OH, C₁₋₆alkilgrupa, hetAr¹, (C₁₋₃alkilgrupa)hetAr^{1a} vai C₃₋₇cikloalkilgrupa, kas aizvietota ar NH₂, (C₁₋₆alkilgrupa)NH vai N(C₁₋₆alkilgrupa)₂;

R¹¹ ir H vai C₁₋₆alkilgrupa;

R¹² ir hetCyc³, (C₁₋₆alkilgrupa)NR¹⁵R¹⁶, C(O)(C₁₋₆alkilgrupa)NR¹⁵R¹⁶, (C₁₋₆alkilgrupa)NHC(O)O(C₁₋₆alkilgrupa) vai C₄₋₇cikloalkilgrupa, kas neobligāti aizvietota ar OH, NH₂, NH(C₁₋₆alkilgrupa) vai N(C₁₋₆alkilgrupa)₂;

R¹³ ir H, C₁₋₆alkilgrupa, F vai OH un

R¹⁴ ir H, C₁₋₆alkilgrupa vai F, vai arī

R¹³ un R¹⁴ kopā ar oglekļa atomu, kuram tie ir pievienoti, veido 3- līdz 6-locekļu karbociklisku gredzenu;

katrs R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷ un R¹⁸ ir neatkarīgi H vai C₁₋₆alkilgrupa,

vai arī katrs R¹⁵, R¹⁷ un R¹⁸ ir neatkarīgi H vai C₁₋₆alkilgrupa un R¹⁶ ir H, C₁₋₆alkilgrupa, C(=O)CH₂F, CH₂CHF₂ vai CH₂CF₃;

vai NR¹⁵R¹⁶ veido 5- līdz 6-locekļu heterociklisku gredzenu ar N kā pirmo heteroatomu ciklā un otro heteroatomu ciklā, kas neobligāti atlasīts no N un O;

hetCyc¹, hetCyc^{1a} un hetCyc³ ir neatkarīgi 4- līdz 7-locekļu heterocikls ar slāpekļa atomu ciklā un neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem R⁹, vai

hetCyc¹ un hetCyc³ ir neatkarīgi 4- līdz 7-locekļu heterocikls ar slāpekļa atomu ciklā un ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem R⁹, un hetCyc^{1a} ir atlasīts no morfolinilgrupas un 4- līdz 7-locekļu azacikliskas grupas, kas neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem R⁹;

katrs R⁹ ir neatkarīgi atlasīts no halogēna atoma, C₁₋₆alkilgrupas, ciklopropilmetilgrupas, benzilgrupas, NRⁱR^j, -(C₁₋₆alkilgrupa)NRⁱR^j, ORⁱ, (C₁₋₆alkilgrupa)OR^k, C₁₋₆fluoralkilgrupas, C(O)NR^mRⁿ, (C₁₋₆alkilgrupa)C(O)NR^pR^q un C(O)O(C₁₋₆alkilgrupa);

hetCyc² ir 8-locekļu heterocikls ar tiltiņa atomu un ar slāpekļa atomu ciklā;

hetAr¹ un hetAr^{1a} ir neatkarīgi 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa ar 1-2 slāpekļa atomiem ciklā un ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas neatkarīgi atlasīti no

F, Cl, Br, Me, ciklopropilgrupas, CN, NH₂, (C₁₋₆alkilgrupa)NH un N(C₁₋₆alkilgrupa)₂;

R^a ir H, C₁₋₆alkilgrupa, -(C₁₋₆alkilgrupa)-O-(C₁₋₆alkilgrupa) vai -(C₁₋₆alkilgrupa)-O-(C₃₋₆cikloalkilgrupa);

katrs R^b, R^c, R^f, R^g, R^h, Rⁱ, R^k, R^m, R^p un R^q ir neatkarīgi atlasīti no H un C₁₋₆alkilgrupas;

R^j ir H, C₁₋₆alkilgrupa vai ciklopropilgrupa;

Rⁿ ir H, C₁₋₆alkilgrupa, -O-C₁₋₆alkilgrupa vai -O-C₃₋₆cikloalkilgrupa un p ir 0, 1 vai 2.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur:

A ir OR¹⁰ vai NR¹¹R¹²;

B ir H, F, OR^a, (C₁₋₆alkilgrupa)NR^bR^c, (C₁₋₆alkilgrupa)OH, CH(OH)CH₂OH vai C₁₋₄alkilgrupa;

R¹ ir H, F, Cl, Br, Me, ciklopropilgrupa vai CN;

R^{1a}, R², R³ un R⁴ ir neatkarīgi H, F, Cl, Br, Me vai CN;

R⁵ un R⁷ ir neatkarīgi H, F, Me vai CN;

R⁶ ir H, F, Me, Br, CN, ciklopropilgrupa vai fenilgrupa;

R¹⁰ ir H, hetCyc¹, -(C₁₋₃alkilgrupa)hetCyc^{1a}, hetCyc², -(CR¹⁷R¹⁸)_p- (CR¹³R¹⁴)CH₂NR¹⁵R¹⁶,

-(CR¹⁷R¹⁸)_p(CR¹³R¹⁴)CH₂OH, C₁₋₆alkilgrupa, hetAr¹, (C₁₋₃alkilgrupa)hetAr^{1a} vai C₃₋₇cikloalkilgrupa, kas aizvietota ar NH₂, (C₁₋₆alkilgrupa)NH vai N(C₁₋₆alkilgrupa)₂;

R¹¹ ir H vai C₁₋₆alkilgrupa;

R¹² ir hetCyc³, (C₁₋₆alkilgrupa)NR¹⁵R¹⁶, C(O)(C₁₋₆alkilgrupa)NR¹⁵R¹⁶, (C₁₋₆alkilgrupa)NHC(O)O(C₁₋₆alkilgrupa) vai C₄₋₇cikloalkilgrupa, kas neobligāti aizvietota ar OH, NH₂,

(C₁₋₆alkilgrupa)NH vai N(C₁₋₆alkilgrupa)₂;

R¹³ ir H, C₁₋₆alkilgrupa, F vai OH, un

R¹⁴ ir H, C₁₋₆alkilgrupa vai F, vai

R¹³ un R¹⁴ kopā ar oglekļa atomu, kuram tie ir pievienoti, veido 3- līdz 6-locekļu karbociklisku gredzenu;

katrs R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷ un R¹⁸ ir neatkarīgi H vai C₁₋₆alkilgrupa,

vai arī NR¹⁵R¹⁶ veido 5- līdz 6-locekļu heterociklisku gredzenu, kurā pirmais heteroatoms ir N un neobligāti otrs heteroatoms ciklā ir atlasīts no N un O;

hetCyc¹, hetCyc^{1a} un hetCyc³ ir neatkarīgi 4- līdz 7-locekļu heterocikls ar slāpekļa atomu ciklā, kas ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem R⁹;

katrs R⁹ ir neatkarīgi atlasīts no halogēna atoma, C₁₋₆alkilgrupas, ciklopropilmetilgrupas, benzilgrupas, NRⁱR^j, -(C₁₋₆alkilgrupas)NRⁱR^j, ORⁱ, (C₁₋₆alkilgrupas)OR^k, C₁₋₆fluoralkilgrupas, C(O)NR^mRⁿ, (C₁₋₆alkilgrupas)C(O)NR^pR^q un C(O)O(C₁₋₆alkilgrupas);

hetCyc² ir 8-locekļu heterocikliska grupa ar slāpekļa atomu ciklā un tiltiņa atomu,

hetAr¹ un hetAr^{1a} ir neatkarīgi 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa ar 1-2 slāpekļa atomiem ciklā, kas neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas neatkarīgi atlasīti no F, Cl, Br, Me, ciklopropilgrupas, CN, NH₂, (C₁₋₆alkilgrupas)NH un N(C₁₋₆alkilgrupas)₂;

R^a ir H, C₁₋₆alkilgrupa, -(C₁₋₆alkilgrupa)-O-(C₁₋₆alkilgrupa) vai -(C₁₋₆alkilgrupa)-O-(C₃₋₆cikloalkilgrupa);

katrs R^b, R^c, R^f, R^g, R^h, Rⁱ, R^k, R^m, R^p un R^q ir neatkarīgi atlasīti no H un C₁₋₆alkilgrupas;

R^j ir H, C₁₋₆alkilgrupa vai ciklopropilgrupa;

Rⁿ ir H, C₁₋₆alkilgrupa, -O-C₁₋₆alkilgrupa vai -O-C₃₋₆cikloalkilgrupa un p ir 0, 1 vai 2.

3. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā B ir H, F,

OR^a, (C₁₋₆alkilgrupa)NR^bR^c, (C₁₋₆alkilgrupa)OH vai CH(OH)CH₂OH.

4. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kurā A ir OR¹⁰.

5. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā R¹⁰ ir hetCyc¹, -(C₁₋₃alkilgrupa)hetCyc^{1a} vai hetCyc², kur hetCyc¹ un hetCyc^{1a} ir neobligāti aizvietoti ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem R⁹.

6. Savienojums saskaņā ar 5. pretenziju, kurā katrs R⁹ ir neatkarīgi atlasīts no F, C₁₋₆alkilgrupas, C(O)O(C₁₋₆alkilgrupas), (C₁₋₆alkilgrupas)OR^k, C(O)NR^mRⁿ, (C₁₋₆alkilgrupas)C(O)NR^pR^q un ORⁱ.

7. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju, kurā hetCyc¹ un -(C₁₋₃alkilgrupa)hetCyc^{1a} ir neobligāti aizvietoti ar vienu vai diviem aizvietotājiem R⁹, kas neatkarīgi atlasīti no Me, Et, izopropilgrupas, ciklopropilmetilgrupas, F, OH, OMe, CH₂OH, CH₂CH₂OH, CH₂CH₂F, CH₂OMe, C(=O)OMe, C(=O)NH₂ un CH₂C(=O)NH₂.

8. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā R¹⁰ ir -(CR¹⁷R¹⁸)_p- (CR¹³R¹⁴)CH₂NR¹⁵R¹⁶.

9. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā R¹⁰ ir -(CR¹⁷R¹⁸)_p- (CR¹³R¹⁴)CH₂OH.

10. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā R¹⁰ ir C₁₋₆alkilgrupa.

11. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā R¹⁰ ir C₃₋₇cikloalkilgrupa, kas aizvietota ar NH₂, (C₁₋₆alkilgrupa)NH vai N(C₁₋₆alkilgrupa)₂.

12. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā R¹⁰ ir hetAr¹ vai (C₁₋₃alkilgrupa)hetAr^{1a}.

13. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kurā A ir NR¹¹R¹².

14. Savienojums saskaņā ar 13. pretenziju, kurā R¹² ir hetCyc³, kas ir neobligāti aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem R⁹.

15. Savienojums saskaņā ar 14. pretenziju, kurā katrs R⁹ ir neatkarīgi atlasīts no (C₁₋₆alkilgrupas).

16. Savienojums saskaņā ar 13. pretenziju, kurā R¹² ir C₄₋₇cikloalkilgrupa, kas neobligāti aizvietota ar OH, NH₂, (C₁₋₆alkilgrupa)NH vai N(C₁₋₆alkilgrupa)₂.

17. Savienojums saskaņā ar 13. pretenziju, kurā R¹² ir (C₁₋₆alkilgrupa)NR¹⁵R¹⁶, C(O)(C₁₋₆alkilgrupa)NR¹⁵R¹⁶ vai (C₁₋₆alkilgrupa)NHC(O)(C₁₋₆alkilgrupa).

18. Savienojums, kas definēts jebkurā no 1. līdz 17. pretenzijai, kurā B ir H.

19. Savienojums, kas definēts jebkurā no 1. līdz 17. pretenzijai, kurā B ir OR^a.

20. Savienojums saskaņā ar 19. pretenziju, kurā B ir atlasīts no OMe, -OCH₂CH₂OMe un -OCH₂CH₂O(ciklopropilgrupa).

21. Savienojums, kas definēts jebkurā no 1. līdz 17. pretenzijai, kurā B ir F.

22. Savienojums, kas definēts jebkurā no 1. līdz 17. pretenzijai, kurā B ir atlasīts no (C₁₋₆alkilgrupas)NR^bR^c, (C₁₋₆alkilgrupas)OH, CH(OH)CH₂OH, C₁₋₄alkilgrupas un Cl.

23. Savienojums, kas definēts jebkurā no 1. līdz 22. pretenzijai, kurā katrs R¹, R², R³, R⁵ un R⁷ ir ūdeņraža atoms.

24. Farmaceutiska kompozīcija, kas ietver savienojumu ar formulu I, kā definēts jebkurā no 1. līdz 23. pretenzijai, vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli un farmaceutiski pieņemamu atšķaidītāju vai nesēju.

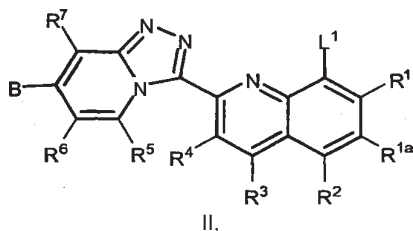
25. Savienojums ar formulu I, kā definēts jebkurā no 1. līdz 24. pretenzijai, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls pielietojumam iekaisuma vai autoimūnas slimības ārstēšanai.

26. Savienojums, kā definēts 25. pretenzijā, kur iekaisuma vai autoimūnā slimība ir multiplā skleroze, vilkēde vai iekaisīgā zarnu slimība.

27. Savienojums ar formulu I, kā definēts jebkurā no 1. līdz 26. pretenzijai, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, pielietojumam vēža ārstēšanā.

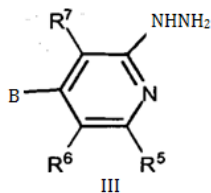
28. Process savienojuma saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas ietver:

(a) savienojumam ar formulu I, kurā A ir NR¹¹R¹²: atbilstoša savienojuma ar formulu II:

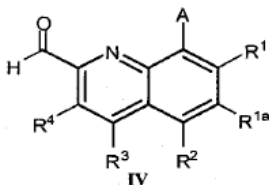


kurā L¹ ir aizejošs atoms vai grupa, sametināšanu ar savienojumu, kura formula ir HNR¹¹R¹², izmantojot pallādija (II) katalizatoru un ligandu bāzes klātbūtnē, vai

(b) savienojuma ar formulu III:

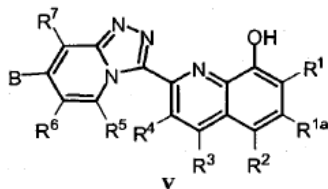


reakciju ar savienojumu, kura formula ir IV:



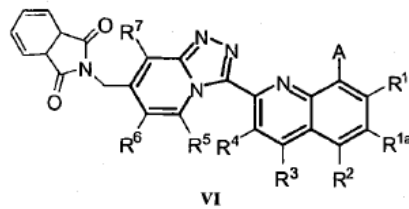
organiska hipervalenta joda reaģenta klātbūtnē; vai

(c) savienojumam ar formulu I, kurā A ir OR¹⁰: atbilstoša savienojuma ar formulu V:



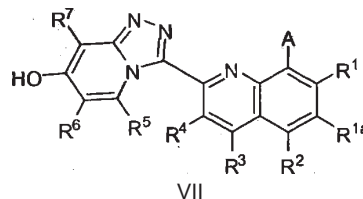
sametināšanu ar savienojumu, kura formula ir HO-R¹⁰, sametināšanas reaģenta un trifenilfosfina klātbūtnē piemērotā šķīdinātājā; vai

(d) savienojumam ar formulu I, kurā B ir (CH₂)NR^bR^c: atbilstoša savienojuma ar formulu VI:



reakciju ar hidrazīnu; vai

(e) savienojumam ar formulu I, kurā B ir OR^a: atbilstoša savienojuma ar formulu VII



reakciju ar savienojumu, kura formula ir R^a-L², kur L² ir aizejošs atoms vai grupa, bāzes klātbūtnē; un aizsarggrupas vai aizsarggrupu noņemšanu un, ja vēlams, sāls veidošanu.

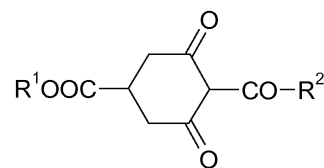
29. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas atlasīts no rindas:

- 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-N-(piperidin-4-il)hinolīn-8-amīna di-trifluoracetāts;
- 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-N-(2,2,6,6-tetrametilpiperidin-4-il)hinolīnamīns;
- (*trans*)-4-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīn-8-ilamino)cikloheksanols;
- (S)-2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-N-(pirolidin-3-il)hinolīn-8-amīns;
- (R)-2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-N-(pirolidin-3-il)hinolīn-8-amīns;
- 3-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīn-8-ilamino)propilkarbamīnskābes *tert*-butilesteris;
- N1-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīn-8-il)propān-1,3-diamīns;
- N1-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīn-8-il)-N1-izopentilpropān-1,3-diamīns;
- 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(piperidin-4-iloksi)hinolīns;
- 3-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīn-8-iloksi)propān-1-amīns;
- (R)-2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(pirolidin-3-iloksi)hinolīns;
- (S)-2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(pirolidin-3-iloksi)hinolīns;
- (2S,4S)-4-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīn-8-iloksi)piperidīn-2-karbonskābes metilesteris;
- 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(piperidin-4-ilmetoksi)hinolīns;
- 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(2-(piperidin-2-il)etoksi)hinolīns;
- 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(piperidin-3-ilmetoksi)hinolīns;
- (*trans*)-4-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīn-8-iloksi)cikloheksānamīns;
- 3-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīn-8-iloksi)-2,2-dimetilpropān-1-amīns;
- 3-(2-(7-(aminometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīn-8-iloksi)-2,2-dimetilpropan-1-ols;
- (3-(8-izobutoksihinolīn-2-il)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-7-il)metānamīns;
- 3-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīn-8-iloksi)-N,N,2,2-tetrametilpropān-1-amīns;
- (1-((2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīn-8-iloksi)metil)ciklopropil)metanols;
- 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(neopentiloksi)hinolīns;
- 3-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīn-8-iloksi)-2,2-dimetilpropan-1-ols;
- 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((*trans*)-3-fluoropiperidin-4-iloksi)hinolīns;
- 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((*cis*)-3-fluoropiperidin-4-iloksi)hinolīns;

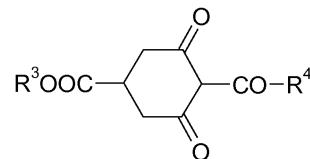
- 3-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-N-etil-2,2-dimetilpropān-1-amīns;
 3-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-N,2,2-trimetilpropān-1-amīns;
 8-(8-azabicyclo[3.2.1]oktan-3-iloksi)-2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīns;
 (2S)-3-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-2-etilpentān-1-amīns;
 (2R)-3-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-2-etilpentān-1-amīns;
 (2S)-3-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-2-etilbutān-1-amīns;
 (2R)-3-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-2-etilbutān-1-amīns;
 (2S)-3-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-2-etilheksān-1-amīns;
 (2R)-3-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-2-etilheksān-1-amīns;
 (2S,4R)-4-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)pirolidīn-2-karbonskābes metilesteris;
 2-(7-(2-metoksietoksi)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-ols;
 2-(7-metoksi-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-ols;
 3-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-6-fluorhinolin-8-iloksi)-2,2-dimetilpropān-1-amīns;
 4-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)piperidīn-1-karbonsamīds;
 3-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-2,2-difluorpropān-1-amīns;
 (cis)-4-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)cikloheksānamīns;
 3-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-5-fluorhinolin-8-iloksi)-2,2-dimetilpropān-1-amīns;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(piridin-3-ilmetoksi)hinolīns;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(piridin-4-ilmetoksi)hinolīns;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(5-fluorazepan-4-iloksi)hinolīns;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(5-fluorazepan-4-iloksi)hinolīna 1. stereozomērs;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(5-fluorazepan-4-iloksi)hinolīna 2. stereozomērs;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(5-fluorazepan-4-iloksi)hinolīna 3. stereozomērs;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(5-fluorazepan-4-iloksi)hinolīna 4. stereozomērs;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(3-fluorazepan-4-iloksi)hinolīns;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(azepan-4-iloksi)hinolīns;
 (2S,4S)-4-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-1-(terc-butoksikarbonil)piperidīn-2-karbonskābe;
 (2S,4S)-4-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-N,N-dimetilpiperidīn-2-karbonsamīds;
 (2S,4S)-4-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-N-metoksi-N-metilpiperidīn-2-karbonsamīds;
 ((2S,4S)-4-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)piperidīn-2-il)metanols;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((2S,4S)-2-(metoksimetil)piperidīn-4-iloksi)hinolīns;
 3-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-7-bromhinolin-8-iloksi)-2,2-dimetilpropān-1-amīns;
 2-(6-fluor-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((cis)-3-fluorpiperidīn-4-iloksi)hinolīns;
 (cis)-2-(7-fluor-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(3-fluorpiperidīn-4-iloksi)hinolīns;
 (S)-2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(pirolidīn-2-ilmetoksi)hinolīns;
 3-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)propān-1,2-diols;
 3-(2-(6-brom-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-2,2-dimetilpropān-1-amīns;
 3-(2-(6-ciklopropil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-2,2-dimetilpropān-1-amīns;
 2,2-dimetil-3-(2-(6-fenil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)propān-1-amīns;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((4-fluorpiperidīn-4-il)metoksi)hinolīns;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((4-metilpiperidīn-4-il)metoksi)hinolīns;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((4-tilpiperidīn-4-il)metoksi)hinolīns;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((4-ciklopropilmetil)piperidīn-4-il)metoksi)hinolīns;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((4-izopropilpiperidīn-4-il)metoksi)hinolīns;
 4-((2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)metil)-1-benzilpiperidīn-4-ols;
 4-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)metil)piperidīn-4-ols;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((4-metoksipiperidīn-4-il)metoksi)hinolīns;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(piridin-4-iloksi)hinolīns;
 4-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)piridīn-2-amīns;
 4-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)pirimidīn-2-amīns;
 2-(6-brom-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((4-fluorpiperidīn-4-il)metoksi)hinolīns;
 2-(6-brom-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((cis)-3-fluorpiperidīn-4-iloksi)hinolīns;
 2-(6-ciklopropil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((4-fluorpiperidīn-4-il)metoksi)hinolīns;
 2-(6-ciklopropil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((cis)-3-fluorpiperidīn-4-iloksi)hinolīns;
 8-((4-fluorpiperidīn-4-il)metoksi)-2-(6-fenil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīns;
 8-((cis)-3-fluorpiperidīn-4-iloksi)-2-(6-fenil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīns;
 2-(4-((2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)metil)-4-fluorpiperidīn-1-il)acetamīds;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((4-fluor-1-metilpiperidīn-4-il)metoksi)hinolīns;
 2-(4-((2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)metil)-4-fluorpiperidīn-1-il)etanols;
 2-(4-((2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)metil)-4-fluorpiperidīn-1-il)etanols;
 (2S,4S)-4-(2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)pirolidīn-2-karbonskābes metilesteris;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-6-fluor-8-((cis)-3-fluorpiperidīn-4-iloksi)hinolīns;
 (S)-2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-6-fluor-8-(piperidīn-3-ilmetoksi)hinolīns;
 (cis)-2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-6-fluor-8-(5-fluorazepan-4-iloksi)hinolīna 1. enantiomērs;
 (trans)-2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-6-fluor-8-(5-fluorazepan-4-iloksi)hinolīna 2. enantiomērs;
 (cis)-8-(5-fluorazepan-4-iloksi)-2-(7-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīna 1. enantiomērs;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(3,3-difluorpiperidīn-4-iloksi)-6-fluorhinolīns;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((cis)-3-fluorpiperidīn-4-iloksi)hinolīna 1. enantiomērs;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((cis)-3-fluorpiperidīn-4-iloksi)hinolīna 2. enantiomērs;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((trans)-3-fluorpiperidīn-4-iloksi)hinolīna 1. enantiomērs;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((trans)-3-fluorpiperidīn-4-iloksi)hinolīna 2. enantiomērs;
 2-(6-ciklopropil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((trans)-5-fluorazepan-4-iloksi)hinolīns;
 8-((trans)-5-fluorazepan-4-iloksi)-2-(6-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīna 1. enantiomērs;
 8-((trans)-5-fluorazepan-4-iloksi)-2-(6-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīna 2. enantiomērs;
 3-(8-((trans)-5-fluorazepan-4-iloksi)hinolin-2-il)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridīn-6-karbonitrils;
 2-(6-fluor-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((trans)-5-fluorazepan-4-iloksi)hinolīns;
 2-(6-fluor-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((4-fluorpiperidīn-4-il)metoksi)hinolīns;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((1-til-4-fluorpiperidīn-4-il)metoksi)hinolīns;
 2-((1,2,4)triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((4-fluor-1-(2-fluoretil)piperidīn-4-il)metoksi)hinolīns;

2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-6-fluor-8-((4-fluoropiperidin-4-il)metoksi)hinolīns;
 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((3-fluorazetidīn-3-il)metoksi)hinolīns;
 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-6-fluor-8-((3-fluorazetidīn-3-il)metoksi)hinolīns;
 8-((4-fluoropiperidin-4-il)metoksi)-2-(6-metoksi-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīns;
 6-fluor-8-((4-fluoropiperidin-4-il)metoksi)-2-(6-metoksi-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīns;
 8-((4-fluoropiperidin-4-il)metoksi)-2-(7-(2-metoksietoksi)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīns;
 (R)-4-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-6-fluorhinolin-8-iloksi)-3,3-dimetilbutān-1,2-diols;
 (R)-4-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-3,3-dimetilbutān-1,2-diols;
 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-6-fluor-8-((4-metoksiazepan-4-il)metoksi)hinolīns;
 2-(4-((2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-6-fluorhinolin-8-iloksi)metil)-4-metoksiazepan-1-il)etanols;
 4-((2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)metil)azepan-4-ols;
 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((4-metoksiazepan-4-il)metoksi)hinolīns;
 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((*trans*)-5-fluor-1-metilazepan-4-iloksi)hinolīna 1. stereozomērs;
 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((*trans*)-5-fluor-1-metilazepan-4-iloksi)hinolīna 2. stereozomērs;
 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((*trans*)-5-fluor-1-metilazepan-4-iloksi)hinolīna 3. stereozomērs;
 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((*trans*)-5-fluor-1-metilazepan-4-iloksi)hinolīna 4. stereozomērs;
 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-6-fluor-8-((*cis*)-5-fluorazepan-4-iloksi)hinolīna 2. enantiomērs;
 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-6-fluor-8-((*trans*)-5-fluorazepan-4-iloksi)hinolīns;
 8-((*cis*-4,5)-5-fluorazepan-4-iloksi)-2-(7-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīns;
 2,2-dimetil-3-(2-(7-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)propān-1-amīns;
 2-(7-hlor-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((3R,4S)-3-fluoropiperidin-4-iloksi)hinolīns;
 8-((4-metoksipiperidin-4-il)metoksi)-2-(7-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolīns;
 2-((2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)metil)morfolīns;
 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(azepan-4-iloksi)hinolīna 1. enantiomērs;
 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-(azepan-4-iloksi)hinolīna 2. enantiomērs;
 (1-((2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)metil)ciklopentil)metānamīns;
 2-((2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)metil)butan-1-ols;
 2-((2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)metil)-2-etilbutan-1-ols;
 4-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-3,3-dimetilbutān-1-amīns;
 2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)-8-((3-fluoropiperidin-3-il)metoksi)hinolīns;
 N-(3-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-2,2-dimetilpropil)-2-fluoracetamīds;
 3-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-N-(2,2-difluoretil)-2,2-dimetilpropān-1-amīns;
 3-(2-([1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-3-il)hinolin-8-iloksi)-2,2-dimetil-N-(2,2,2-trifluoretil)propān-1-amīns un to farmaceitiski pieņemamie sāļi.
 30. Savienojums saskaņā ar 29. pretenziju, kur minētā savienojuma farmaceitiski pieņemamais sāls ir tā hidrohlorīds.

- (43) 29.06.2011
 (45) 09.04.2014
 (31) 08165281 (32) 26.09.2008 (33) EP
 (86) PCT/EP2009/062450 25.09.2009
 (87) WO2010/034813 01.04.2010
 (73) BASF SE, 67056 Ludwigshafen, DE
 (72) RADEMACHER, Wilhelm, DE
 STROBEL, Dieter, DE
 Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV
 (54) **ACILCIKLOHEKSĀNDIONA KARBONSKĀBES VAI TĀS SĀĻU KOMBINĀCIJĀS AR ACILCIKLOHEKSĀNDIONA KARBONSKĀBES ESTERIEM IZMANTOŠANA GRAUDZĀĻU ATTĪSTĪBAS UZLABOŠANAI**
USE OF ACYLCYCLOHEXANEDIONE CARBOXYLIC ACID OR SALTS THEREOF IN COMBINATION WITH ACYLCYCLOHEXANEDIONE CARBOXYLIC ACID ESTERS FOR IMPROVING THE DEVELOPMENT OF GRAMINEOUS PLANTS
 (57) 1. Vismaz viena savienojuma (I)



kurā
 R¹ ir ūdeņraža atoms; un
 R² ir C₁₋₁₀alkilgrupa vai C₃₋₁₀cikloalkilgrupa;
 un/vai vismaz viena tā sāls
 kombinācijā ar vismaz vienu savienojumu (II)



- kurā
 R³ ir C₁₋₁₀alkilgrupa; un
 R⁴ ir C₁₋₁₀alkilgrupa vai C₃₋₁₀cikloalkilgrupa;
 izmantošana graudzāļu attīstības uzlabošanai.
 2. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju graudzāļu augšanas regulēšanai.
 3. Izmantošana saskaņā ar 2. pretenziju graudzāļu dzinum augšanas vai garuma samazināšanai un/vai saknes augšanas veicināšanai.
 4. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām labības augu sagāšanās veidrē aizkavēšanai.
 5. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju labības ražas un/vai graudu kvalitātes palielināšanai.
 6. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt graudzāles ir izvēlētas no labības augiem, zāliena un lauku zālēm, un cukurniedrēm.
 7. Izmantošana saskaņā ar 6. pretenziju, turklāt labības augi ir izvēlēti no kviešiem, tritikāles, rudziem, miežiem, auzām, rīsiem, kukurūzas un prosas.
 8. Izmantošana saskaņā ar 7. pretenziju, turklāt labības augi ir izvēlēti no kviešiem, tritikāles, rudziem, miežiem, auzām un rīsiem.
 9. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt R¹ ir ūdeņraža atoms vai viens kalcijs ekvivalents un R² ir etilgrupa vai ciklopropilgrupa.
 10. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt R³ ir etilgrupa un R⁴ ir etilgrupa vai ciklopropilgrupa.
 11. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 9. un 10. pretenzijas, turklāt R¹ ir viens kalcijs ekvivalents, R² ir etilgrupa, R³ ir etilgrupa un R⁴ ir ciklopropilgrupa.
 12. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt vismaz viena savienojuma ar formulu (I) vai tā sāls un vismaz viena savienojuma ar formulu (II) masu attiecība ir 10:1 līdz 1:10.
 13. Paņēmiens graudzāļu attīstības uzlabošanai, kurš satur vismaz viena savienojuma ar formulu (I) un/vai vismaz viena tā sāls

- (51) **A01N 37/42**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2337453**
A01P 21/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 09783425.3 (22) 25.09.2009

un vismaz viena savienojuma ar formulu (II), kā definēts jebkurā no 1. vai 9. līdz 12. pretenzijai, maisījumā vai atsevišķi, lietošanu vienlaikus vai secīgi ūdens izsmidzināšanas šķidrums veidā uz augiem vai augu daļām.

14. Paņēmiens saskaņā ar 13. pretenziju graudzāļu augšanas regulēšanai.

15. Kompozīcija, kas satur vismaz vienu savienojumu ar formulu (I) un/vai vismaz vienu tā sāli un vismaz vienu savienojumu ar formulu (II), kā definēts jebkurā no 1. vai 9. līdz 11. pretenzijai, turklāt vismaz viena savienojuma (I) vai tā sāls un vismaz viena savienojuma (II) masu attiecība ir 10:1 līdz 1:10.

- (51) **C11C 3/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2358851**
 (21) 09756298.7 (22) 16.11.2009
 (43) 24.08.2011
 (45) 12.03.2014
 (31) 08169225 (32) 17.11.2008 (33) EP
 (86) PCT/EP2009/065230 16.11.2009
 (87) WO2010/055158 20.05.2010
 (73) BASF SE, 67056 Ludwigshafen, DE
 (72) FASSBENDER, Stefan, DE
 (74) Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV

(54) **METĀNSULFONSKĀBES IZMANTOŠANA TAUKSKĀBES ESTERU IEGŪŠANAI**
USE OF METHANESULFONIC ACID FOR PRODUCING FATTY ACID ESTERS

(57) 1. Process taukskābes esteru un/vai taukskābes esteru, kas iegūti no īsas ķēdes vienvērtīgajiem spirtiem, kuri satur 1 līdz 5 oglekļa atomus, maisījumu iegūšanai, kurš ietver:

- (a) taukskābes glicerīdu ar īsas ķēdes vienvērtīgajiem spirtiem, kuri satur 1 līdz 5 oglekļa atomus, pāresterificēšanu vismaz viena bāziska katalizatora klātbūtnē, lai veidotu reakcijas maisījumu, kas satur taukskābes esteru un/vai taukskābes esteru maisījumu, un
 (b) vismaz daļas no soli (a) pāresterifikācijas rezultātā iegūtā reakcijas maisījuma apstrādi ar metānsulfonskābi.

2. Process saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt soli (a), pēc pāresterificēšanas pabeigšanas un pirms soļa (b) veikšanas, reakcijas maisījuma uzturēšanās laiks ir izvēlēts tā, ka notiek fāžu atdalīšana taukskābes estera fāzē un glicerīna fāzē.

3. Process saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt pāresterificēšanu soli (a) veic vairāk nekā vienā stadijā.

4. Process saskaņā ar 3. pretenziju, turklāt pāresterificēšanu soli (a) veic divās stadijās.

5. Process saskaņā ar 4. pretenziju, turklāt pirmajā stadijā tiek izmantoti 60 % līdz 90 % no kopējā izmantotā spirta un katalizatora daudzuma, kas izmantots pirmajā stadijā, un otrajā stadijā tiek izmantoti 10 % līdz 40 % no kopējā izmantotā spirta un katalizatora daudzuma.

6. Process saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, turklāt izmantotie taukskābes glicerīdi ir dabā sastopami augu un dzīvnieku tauki un eļļas, kuras izvēlētas no sojas pupiņu eļļas, palmu eļļas, palmu kodolu eļļas, kokosriekstu eļļas, saulespuķu eļļas, rapšu eļļas, linsēkļu eļļas, rīcineļļas, zemesriekstu eļļas, olīveļļas, naktssveces eļļas un ceratonijas sēkļu eļļas, un to maisījumiem.

7. Process saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt izmantotais īsas ķēdes vienvērtīgais spirts ir metanols vai etanols.

8. Process saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, turklāt izmantotie bāziskie katalizatori ir sārmu metāla vai sārmzemju metāla savienojumi, izvēlēti no nātrija hidroksīda, kālija hidroksīda un nātrija un kālija alkoksīdiem, kas veidoti no īsas ķēdes vienvērtīgiem spirtiem ar 1 līdz 5 oglekļa atomiem, vai to maisījumiem.

9. Process saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, turklāt bāziskais katalizators tiek lietots daudzumā 0,5 līdz 5 masas % no izmantotā taukskābes glicerīda masas.

10. Process saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, turklāt metānsulfonskābes daudzums soli (b) ir tāds, ka tas ir vismaz ekvivalents soli (a) izmantotajiem bāziskā katalizatora daudzumiem.

11. Process saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 10. pretenzijai, turklāt pēc pāresterificēšanas pabeigšanas soli (a) taukskābes estera fāze tiek izveidota, atdalīta un apstrādāta ar metānsulfonskābi soli (b).

12. Process saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, turklāt apstrādei soli (b) tiek izmantota metānsulfonskābe 50 % līdz 99 % skābes ūdens formā.

13. Process saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai, turklāt procesa soļa (b) izpilde sākas ar soli (a) iegūtā liekā spirta atdalīšanu.

14. Process saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai, turklāt tas tiek veikts kā nepārtraukts process.

15. Metānsulfonskābes izmantošana taukskābes alkilesteru vai to maisījumu iegūšanā, taukskābes glicerīdu pāresterificēšanā, izmantojot bāziskus katalizatorus.

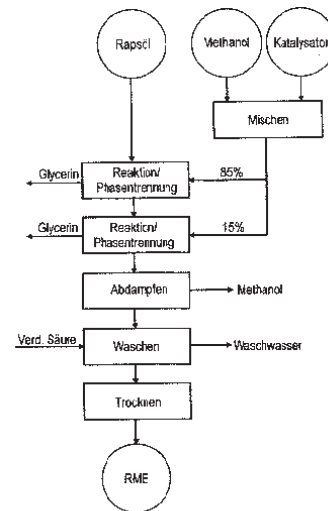


FIG.1

- (51) **A61K 9/48**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2367542**
A61K 9/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/4184⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 09796303.7 (22) 03.12.2009
 (43) 28.09.2011
 (45) 01.01.2014
 (31) 08075915 (32) 03.12.2008 (33) EP
 (86) PCT/EP2009/008857 03.12.2009
 (87) WO2010/063493 10.06.2010
 (73) Astellas Deutschland GmbH, Georg-Brauchle-Ring 64-66, 80992 München, DE
 (72) COLLEDGE, Jeffrey, NL
 OLTHOFF, Margaretha, NL
 (74) Olthoff, Margaretha, Astellas Pharma Europe BV, P.O. Box 344, 2300 AH Leiden, NL
 Jevgeņija GAINUTDINOVA, Tomsona iela 24-15, Rīga, LV-1013, LV

(54) **IEKŠĶĪGAS BENDAMUSTĪNA ZĀĻU FORMAS**
ORAL DOSAGE FORMS OF BENDAMUSTINE

(57) 1. Farmaceutiska kompozīcija iekšķīgai ievadīšanai, kas satur bendamustīnu vai farmaceutiski pieņemamu tā esteru, sāli vai solvātu kā aktīvo sastāvdaļu un farmaceutiski pieņemamu palīgvielu, kura ir farmaceutiski pieņemama nejonu virsmaktīva viela, kas izvēlēta no grupas, sastāvošas no makrogola glicerīna hidroksistearāta, polioksil-35-ricīneļļas un etilēnoksīda/propilēnoksīda bloka kopolimēra (Pluronic® L44 NF vai Poloksamer® 124).

2. Farmaceutiska kompozīcija, saskaņā ar 1. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka aktīvā sastāvdaļa ir bendamustīna hidrohlorīds.

3. Farmaceutiska kompozīcija, saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka tā satur aktīvo sastāvdaļu 10 līdz 1000 mg, labāk 25 līdz 600 mg, vēl labāk 50 līdz 200 mg un vislabāk aptuveni 100 mg.

4. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka tā papildus satur koloidālo silīcija dioksīdu.

5. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1., 2., 3. vai 4. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka tā papildus satur laurilmakrogola glicerīdus (Gelucire® 44/14).

6. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas atšķiras ar to, ka kompozīcija ir cietā želatīna kapsulā.

7. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas atšķiras ar to, ka tā uzrāda bendamustīna šķīšanas ātrumu vismaz 60 % 20 minūtēs, 70 % 40 minūtēs un 80 % 60 minūtēs, kas mērīts 500 ml šķīdināšanas vidē pie 1,5 pH ar lāpstīnveida maisītāja aparātiem pie 50 apgriezieniem minūtē saskaņā ar Eiropas Farmakopeju.

8. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 7. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka tā uzrāda šķīšanas ātrumu vismaz 60 % 10 minūtēs, 70 % 20 minūtēs un 80 % 30 minūtēs.

9. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas atšķiras ar to, ka tā tiek izmantota medicīniskā stāvokļa ārstēšanai, kurš ir izvēlēts no hroniskas limfocītiskas leukēmijas, akūtas limfocītiskas leukēmijas, hroniskas mielocītiskas leukēmijas, akūtas mielocītiskas leukēmijas, Hodžkina slimības, ne-Hodžkina limfomas, izkliedētās mielomas, krūšu dziedzera vēža, olnīcas vēža, sīkšņu plaušu vēža, nesīkšņu plaušu vēža un autoimūnslimības.

10. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas atšķiras ar to, ka tā ir jāievada kombinācijā ar vismaz vienu papildu aktīvu līdzekli, pie tam minētais papildu aktīvais līdzeklis tiek dots agrāk par, vienlaicīgi ar vai pēc farmaceitiskās kompozīcijas ievadīšanas un ir izvēlēts no grupas, sastāvošas no antivielas, specifiskas pret CD20, antraciklīna atvasinājuma, vinca alkaloida vai platīna atvasinājuma.

11. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka anti viela, kas ir specifiska pret CD20, ir rituksimabs, antraciklīna atvasinājums ir doksorubicīns vai daunorubicīns, vinca alkaloids ir vinkristīns un platīna atvasinājums ir cisplatīns vai karboplatīns.

12. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, kura ir jāievada kombinācijā ar vismaz vienu kortikosteroīdu, pie tam minētais kortikosteroīds tiek dots agrāk par, vienlaicīgi ar vai pēc farmaceitiskās kompozīcijas ievadīšanas.

13. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 12. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka kortikosteroīds ir prednizons vai prednizolons.

(51) B65D 43/16 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾	(11) 2367729	
(21) 09771428.1	(22) 15.12.2009	
(43) 28.09.2011		
(45) 15.01.2014		
(31) PCT/NL2008/050800	(32) 15.12.2008	(33) WO
(86) PCT/NL2009/050766	15.12.2009	
(87) WO2010/071424	24.06.2010	
(73) N.V. Nutricia, Eerste Stationsstraat 186, 2712 HM Zoetermeer, NL		
(72) DOLS, Merijn, NL		
STEVENS, John Boyet, US		
(74) Nederlandsch Octrooibureau, P.O. Box 29720, 2502 LS The Hague, NL		
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV		

(54) **KONTEINERA VĀKA DAĻA
LID PART FOR A CONTAINER**

(57) 1. Bērnu pulverveida pārtikas konteineru vāka daļa (2), kas būtībā ir izgatavota no termoplastiska materiāla un satur savienojuma daļu (5) konteineru malas un vāka (4) savienošanai, kurš šarnīrveidā ir savienots ar minēto savienojuma daļu (5), turklāt vākam (4) ir centrālā daļa un koncentrīks vāka atloks (8), kas ir vērsts prom no centrālās daļas (2), turklāt minētā savienojuma daļa (5) satur:

- sienīņu (11), kurai ir tāda izmēra piekļuves atvere (6), kas ir pietiekami liela, lai caur to ievirzītu roku ar kausiņu satura paņemšanai, un minētās piekļuves atveres laukums ir vismaz 50 cm²,
- pirmo koncentrīsko atloku (7), kas aptver piekļuves atveri (6) un ir vērsts prom no minētās sienīņas (11), turklāt pirmajam koncentrīskajam atlokam (7) pie sienīņas (11) ir pirmais ārējais perimetrs, bet pie pirmā atloka (7) ietvara ir otrs ārējais perimetrs tādā veidā, ka pirmais atloks (7) virzienā prom no sienīņas (11) sašaurinās,

kas ir raksturīga ar to, ka vāka atlokam (8) pie centrālās daļas (2) ir pirmais iekšējais perimetrs, bet pie vāka atloka (8) ietvara ir otrs iekšējais perimetrs, turklāt vāka otrs iekšējais perimetrs ir mazāks nekā pirmais perimetrs pie vāka atloka (8) ietvara tādā veidā, ka minētā vāka atloks (8) no centrālās daļas (2) uz iekšpusi sašaurinās,

turklāt minētā vāka atloka (8) un pirmā atloka (7) perimetri ir savstarpēji salāgoti tā, lai vāks (4) hermētiski noslēgtos pie savienojuma daļas (5) pirmā atloka (7) tādā veidā, ka vāka atloka (8) un pirmā atloka (7) salāgojamās koniskās formas uzvelk vāku (4) uz savienojuma daļas (5) sienīņas (11), ar ko tiek nodrošināts papildu blīvējums starp vāka atloka (8) malu un sienīņas (11) virsmu, kura aptver pirmo atloku (7).

2. Vāka daļa saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt laukums ir vismaz 75 cm².

3. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt laukums ir mazāks par 200 cm².

4. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt minētais pirmais atloks (7) ierobežo piekļuves atveri (6).

5. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt vāka atloks (8) pie tā ietvara satur noslīpinātu iekšējo malu.

6. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt koncentrīskais pirmais atloks (7) pa aploci tuvu tā ārējai malai vai pie ietvara kļūst biežāks.

7. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt vāka atloka (8) otrs iekšējais perimetrs ir aptuveni par 2 līdz 7 % mazāks nekā pirmā atloka (7) pirmais ārējais perimetrs.

8. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt minētā piekļuves atvere (6) būtībā ir apaļa vai eliptiska.

9. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt piekļuves atveres (6) laukums ir vismaz 50 % no savienojuma daļas laukuma.

10. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt piekļuves atveres (6) iekšējais diametrs ir aptuveni 9 līdz 13 cm, bet savienojuma daļas (5) diametrs ir aptuveni 10 līdz 13 cm.

11. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt minētais vāka atloks (8) ir no termoplastiska materiāla, kas ļauj tā perimetriem pagarināties, vāku (4) uzspiežot uz pirmā atloka (7), turklāt, ja vāks nenoslēdz atveri, vāka atloka pirmais un otrs perimetrs ir mazāki nekā pirmā atloka perimetri.

12. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt pirmā atloka (7) biežums, ņemot vērā, ka tas ir no termoplastiska materiāla, ir izvēlēts, lai nodrošinātu stingru atloku.

13. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt minētā vāka daļa (4) ir izgatavota no termoplastiska polimēra, kas sastāv no grupas, kuru veido polietilēns (PE) un polipropilēns (PP).

14. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt vāks ir no termoplastiska materiāla, kura elastība ir tāda, ka tā ar vāka atloku (8) un pirmo atloku (7) ļauj vākam (4) hermētiski noslēgties uz savienojuma daļas (5).

15. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt vāka daļa (2) ir izveidota ar spiedienliešanu tādā veidā, ka vāks (4) ar pagriešanas iespēju ir savienots ar savienojuma daļu (5), izmantojot šarnīru (9).

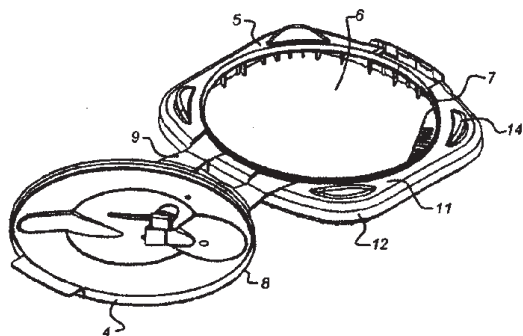
16. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt savienojuma daļa (5) satur koncentrīsku ietvaru (12), kuram ir koncentrīska rievā (13) konteineru daļas ietvara ievietošanai.

17. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt savienojuma daļa (5) satur izciļņus (14) konteineru sakraušanai citam uz cita.

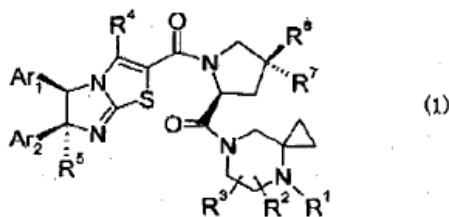
18. Vāka daļa saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt koncentrīskā ietvara (12) ierobežotais laukums ir lielāks par piekļuves atveres (6) laukumu.

19. Konteiners, kas satur vāka daļu saskaņā ar iepriekšējām pretenzijām un konteineru daļu, turklāt konteineru daļa satur apakšdaļu un ar to savienotu koncentrīsku konteineru sienīņu, kura sniedzas līdz ietvaram vāka daļas ievietošanai.

Fig 2



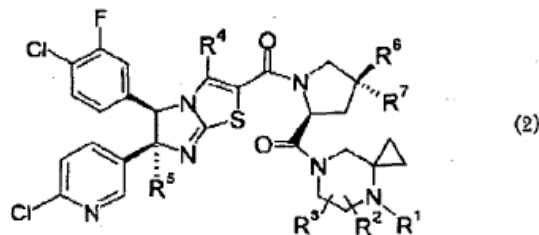
- (51) **C07D 513/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2380892**
A61K 31/499⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 35/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 43/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 10731281.1 (22) 15.01.2010
(43) 26.10.2011
(45) 02.04.2014
(31) 2009007536 (32) 16.01.2009 (33) JP
(86) PCT/JP2010/050372 15.01.2010
(87) WO2010/082612 22.07.2010
(73) Daiichi Sankyo Company, Limited, 3-5-1, Nihonbashi Honcho, Chuo-kuTokyo 103-8426, JP
(72) UOTO Kouichi, JP
SUGIMOTO Yuuichi, JP
NAITO Hiroyuki, JP
MIYAZAKI Masaki, JP
YOSHIDA Keisuke, JP
AONUMA Masashi, JP
(74) Wallace, Sheila Jane, Marks & Clerk LLP, 90 Long Acre, London WC2E 9RA, GB
Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
(54) **IMIDAZOTIAZOLA ATVASINĀJUMI AR PROLĪNA GRE-DZENA STRUKTŪRU**
IMIDAZOTHIAZOLE DERIVATIVE HAVING PROLINE RING STRUCTURE
(57) 1. Savienojums, kurš apzīmēts ar vispārīgu formulu (1) vai tā sāls,



raksturīgs ar to, ka
Ar₁ ir fenilgrupa, kurai var būt viens vai vairāki aizvietotāji, kuri izvēlēti no halogēna atoma, ciāngrupas un (C₁-C₆)alkilgrupas;
Ar₂ ir fenilgrupa, kurai var būt viens vai vairāki aizvietotāji, kuri izvēlēti no halogēna atoma, (C₁-C₆)alkilgrupas un ciāngrupas, vai piridilgrupa, kurai var būt viens vai vairāki aizvietotāji, kas izvēlēti no halogēna atoma, (C₁-C₆)alkilgrupas un ciāngrupas;
R¹ ir (C₁-C₆)alkilgrupa, kurai var būt viens vai vairāki aizvietotāji, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₆)alkoksigrupas, karbamoilgrupas, aminogrupas, (C₁-C₆)alkanoilgrupas un ciāngrupas, un (C₁-C₆)alkanoilgrupa, kurai var būt viens vai vairāki aizvietotāji, izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₆)alkoksigrupas, karbamoilgrupas, aminogrupas, un ciāngrupas, ūdeņraža atoms vai hidroksilgrupa,
R² un R³ katrs neatkarīgi ir (C₁-C₆)alkilgrupa, kurai var būt viens vai vairāki aizvietotāji, izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₆)alkoksigrupas, karbamoilgrupas, aminogrupas,

(C₁-C₆)alkanoilgrupas un ciāngrupas, vai ūdeņraža atoms, vai R² un R³ kopā veido oksogrupu, vai R² un R³ kopā ar oglekļa atomiem, ar kuriem R² un R³ attiecīgi saistīti, var veidot 3 līdz 5 locekļu piesātinātu ogļūdeņražu gredzenu spiro vai kondensētā formā, R⁴ ir (C₁-C₆)alkilgrupa, kurai var būt viens vai vairāki aizvietotāji, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₆)alkoksigrupas, karbamoilgrupas, aminogrupas, (C₁-C₆)alkanoilgrupas un ciāngrupas, R⁵ ir (C₁-C₆)alkilgrupa, kurai var būt viens vai vairāki aizvietotāji, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₆)alkoksigrupas, karbamoilgrupas, aminogrupas, (C₁-C₆)alkanoilgrupas un ciāngrupas, R⁶ ir ūdeņraža atoms, un R⁷ ir halogēna atoms.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš apzīmēts ar vispārīgu formulu (2) vai tā sāls:



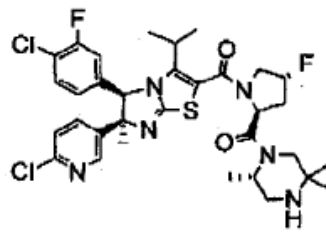
raksturīgs ar to, ka
R¹ ir (C₁-C₆)alkilgrupa, kurai var būt viens vai vairāki aizvietotāji, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₆)alkoksigrupas, karbamoilgrupas, aminogrupas, (C₁-C₆)alkanoilgrupas un ciāngrupas, un (C₁-C₆)alkanoilgrupa, kurai var būt viens vai vairāki aizvietotāji, izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₆)alkoksigrupas, karbamoilgrupas, aminogrupas un ciāngrupas, ūdeņraža atoms vai hidroksilgrupa,
R² un R³ katrs neatkarīgi ir (C₁-C₆)alkilgrupa, kurai var būt viens vai vairāki aizvietotāji, izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₆)alkoksigrupas, karbamoilgrupas, aminogrupas, (C₁-C₆)alkanoilgrupas un ciāngrupas, vai ūdeņraža atoms, vai R² un R³ kopā veido oksogrupu, vai R² un R³ kopā ar oglekļa atomiem, ar kuriem R² un R³ attiecīgi saistīti, var veidot 3 līdz 5 locekļu piesātinātu ogļūdeņražu gredzenu spiro vai kondensētā formā, R⁴ ir (C₁-C₆)alkilgrupa, kurai var būt viens vai vairāki aizvietotāji, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₆)alkoksigrupas, karbamoilgrupas, aminogrupas, (C₁-C₆)alkanoilgrupas un ciāngrupas, R⁵ ir (C₁-C₆)alkilgrupa, kurai var būt viens vai vairāki aizvietotāji, kas izvēlēti no halogēna atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₆)alkoksigrupas, karbamoilgrupas, aminogrupas, (C₁-C₆)alkanoilgrupas un ciāngrupas, R⁶ ir ūdeņraža atoms, un R⁷ ir halogēna atoms.

3. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju vai tā sāls, raksturīgs ar to, ka R¹ ir (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₆)alkanoilgrupa, kurai kā aizvietotāji var būt viens vai vairāki halogēna atomi, vai ūdeņraža atoms.

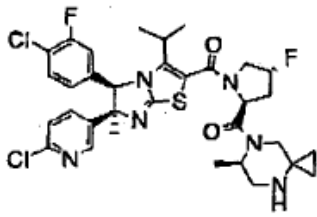
4. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai vai tā sāls, raksturīgs ar to, ka R⁴ ir (C₁-C₆)alkilgrupa.

5. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai vai tā sāls, raksturīgs ar to, ka R⁵ ir (C₁-C₆)alkilgrupa.

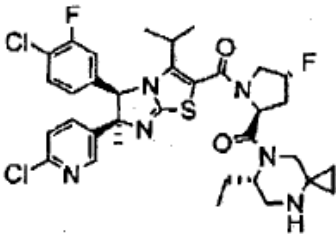
6. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš apzīmēts ar sekojošu formulu:



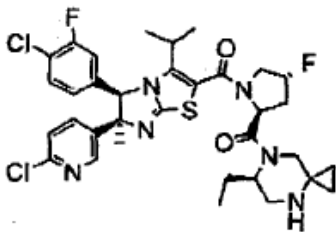
7. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš apzīmēts ar sekojošu formulu:



8. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš apzīmēts ar sekojošu formulu:



9. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš apzīmēts ar sekojošu formulu:



10. Medikaments, kas ietver savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai vai tā sāli kā aktīvo ingredientu.

11. Farmaceutiska kompozīcija, kas ietver savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai vai tā sāli un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

12. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai vai tā sāls pielietošana medikamenta ražošanā.

13. Pretvēža līdzeklis, kurš ietver savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai vai tā sāli kā aktīvo ingredientu.

14. Pretvēža līdzeklis saskaņā ar 13. pretenziju, raksturīgs ar to, ka vēzis ir jebkurš, kas izvēlēts no plaušu vēža, krūts vēža, prostatas vēža, resnās zarnas vēža, akūtas mieloidās leikēmijas, ļaundabīgās limfomas, retinoblastomas, neiroblastomas un sarkomas.

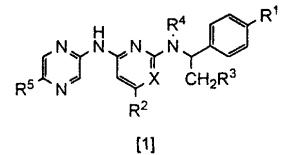
15. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai vai tā sāls pielietošana medikamenta vēža ārstēšanai ražošanai.

16. Pielietošana saskaņā ar 15. pretenziju, raksturīga ar to, ka vēzis ir izvēlēts no plaušu vēža, krūts vēža, prostatas vēža, resnās zarnas vēža, akūtas mieloidās leikēmijas, ļaundabīgās limfomas, retinoblastomas, neiroblastomas un sarkomas.

17. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai vai tā sāls vēža ārstēšanai.

18. Savienojums pielietošanai saskaņā ar 17. pretenziju, raksturīgs ar to, ka vēzis ir izvēlēts no plaušu vēža, krūts vēža, prostatas vēža, resnās zarnas vēža, akūtas mieloidās leikēmijas, ļaundabīgās limfomas, retinoblastomas, neiroblastomas un sarkomas.

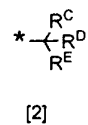
- (87) WO2010/090290 12.08.2010
- (73) Nippon Shinyaku Co., Ltd., 14, Kissshoin Nishinosho Monguchicho Minami-ku, Kyoto-shi, Kyoto 601-8550, JP
- (72) FUJIHARA, Hidetaka, JP
 ASAKI, Tetsuo, JP
 HORI, Katsutoshi, JP
 NAITO, Haruna, JP
- (74) von Uexküll - Gùldenband, Alexa, et al, Vossius & Partner, Siebertstrasse 4, 81675 München, DE
 Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV
- (54) **AMINOPIRAZĪNA ATVASINĀJUMS UN MEDIKAMENTS AMINOPYRAZINE DERIVATIVE AND MEDICINE**
- (57) 1. Savienojums, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [1]:



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kurā savienojums ir definēts ar šādiem (I) vai (II):

- (I):
 X ir slāpekļa atoms;
 R¹ ir halogēna atoms;
 R² ir:
 (1) ūdeņraža atoms,
 (2) halogēna atoms,
 (3) ciāngrupa,
 (4) grupa, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [2]:

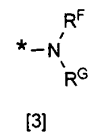
[Chem.2]



(kurā * norāda sasaistīšanās pozīciju; un R^C, R^D un R^E ir vienādi vai atšķirīgi un katrs ir (a) ūdeņraža atoms vai (b) alkilgrupa, neobligāti aizvietota ar hidroksilgrupu vai alkoksigrupu, vai arī divi no R^C, R^D un R^E kopā ar blakus esošu oglekļa atomu veido slāpekļa atomu saturošu piesātinātu heterociklisku grupu, un atlikušais ir ūdeņraža atoms, piesātināta heterocikliska grupa, neobligāti aizvietota ar alkilsulfonilgrupu),

- (5) grupa, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [3]:

[Chem.3]



(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^F un R^G ir vienādi vai atšķirīgi un katrs ir (a) ūdeņraža atoms, (b) alkilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no hidroksilgrupas, aminogrupas, dialkilaminogrupas, piesātinātas cikliskas aminogrupas, alkilkarbonilaminogrupas, alkilsulfonilaminogrupas, arilgrupas, heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas ar alkilgrupu, tetrahidrofurānilgrupu un karbamoilgrupu, (c) alkilkarbonilgrupa, (d) alkilsulfonilgrupa, (e) karbamoilgrupa, vai (f) heteroarilgrupa, neobligāti aizvietota ar alkilgrupu, vai arī R^F un R^G kopā ar blakus esošu slāpekļa atomu veido piesātinātu ciklisku aminogrupu, kura var neobligāti būt aizvietota ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no (a) halogēna atoma, (b) ciāngrupas, (c) hidroksilgrupas, (d) alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no hidroksilgrupas, alkoksigrupas, aminogrupas, alkoksikarbonilaminogrupas, alkilsulfonilaminogrupas un alkilkarbonilaminogrupas, (e) cikloalkilgrupas, (f) halogēnalkilgrupas, (g) alkoksigrupas,

- (51) **C07C 57/145**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2394999**
A61K 31/497⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/506⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 401/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 403/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 403/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 413/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 10738621.1 (22) 05.02.2010
- (43) 14.12.2011
- (45) 29.01.2014
- (31) 2009026470 (32) 06.02.2009 (33) JP
 2009276133 04.12.2009 JP
- (86) PCT/JP2010/051722 05.02.2010

(h) oksogrupas, (i) grupas, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [4]:

[Chem.4]



[4]

(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^H ir alkilgrupa vai arilgrupa), (j) grupas, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [5]:

[Chem.5]



[5]

(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^I un R^J ir vienādi vai atšķirīgi un katrs ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa, karbamoilgrupa, alkilkarbonilgrupa vai alkilsulfonilgrupa), (k) grupas, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [6]:

[Chem.6]



[6]

(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^K ir alkilgrupa, hidroksilgrupa, aminogrupa, alkilaminogrupa, dialkilaminogrupa, cikloalkilaminogrupa, (cikloalkil)alkilaminogrupa, (hidroksialkil)aminogrupa, (alkoksialkil)aminogrupa, alkoksigrupa, alkilsulfonilaminogrupa vai piesātināta cikliska aminogrupa), un (1) piesātināta cikliska aminogrupa, neobligāti aizvietota ar hidroksilgrupu; un piesātināta cikliska aminogrupa, ko veido, savienojot R^F, R^G un blakus esošu slāpekļa atomu, var veidot spirosaiti ar grupu, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [7A] vai [7B]:

[Chem.7]



[7A]



[7B]

(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš)),
(6) grupa, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [8]:

[Chem.8]

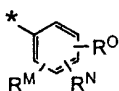


[8]

(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^L ir (a) alkilgrupa, (b) hidroksilgrupa, (c) alkoksigrupa, (d) piesātināta cikliska aminogrupa, neobligāti aizvietota ar alkilgrupu vai alkilsulfonilgrupu, vai (e) aminoalkilsulfonilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no alkilgrupas, cikloalkilgrupas, (cikloalkil)alkilgrupas, aralkilgrupas, halogēnalkilgrupas, dialkilaminoalkilgrupas, alkoksialkilgrupas un hidroksialkilgrupas),

(7) grupa, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [9]:

[Chem.9]



[9]

(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^M, R^N un R^O ir vienādi vai atšķirīgi un katrs ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms, ciāngrupa, alkoksigrupa, karbamoilgrupa, sulfamoilgrupa, monoalkilaminosulfonilgrupa vai alkilsulfonilgrupa, vai arī divi no R^M, R^N un R^O kopā veido metilēndioksigrupu),

(8) -OR^P (R^P ir alkilgrupa, neobligāti aizvietota ar grupu, izvēlētu no rindas, kas sastāv no hidroksilgrupas, dialkilaminogrupas, alkoksigrupas, tetrahidrofuranilgrupas un cikloalkilgrupas, vai neobligāti skābekļa atomu saturoša piesātināta cikliska grupa, neobligāti aizvietota ar hidroksilgrupu), vai

(9) heteroarilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no ciāngrupas, halogēna atoma, hidroksilgrupas, alkoksigrupas, alkilkarbonilgrupas, karbamoilgrupas, alkilgrupas, cikloalkilgrupas, (cikloalkil)alkilgrupas, aralkilgrupas, hidroksikarbonilgrupas un alkoksialkilgrupas; R³ ir ūdeņraža atoms vai hidroksilgrupa; R⁴ ir ūdeņraža atoms vai alkilgrupa; un R⁵ ir ūdeņraža atoms vai alkilgrupa;

(II):

X ir -CR^A;R^A ir grupa, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [10]:

[Chem.10]



[10]

(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^B ir (a) aminogrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no alkilgrupas, cikloalkilgrupas, (cikloalkil)alkilgrupas un alkoksialkilgrupas, (b) alkoksigrupa, (c) hidroksilgrupa vai (d) piesātināta cikliska aminogrupa);

R¹ ir halogēna atoms;R² ir ūdeņraža atoms;R³ ir ūdeņraža atoms vai hidroksilgrupa;R⁴ ir ūdeņraža atoms vai alkilgrupa; unR⁵ ir ūdeņraža atoms vai alkilgrupa.

2. Savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kurā savienojums, kas atbilst vispārīgai formulai [1], ir definēts ar šādiem [i] vai [ii]:

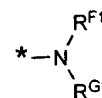
[i]:

X ir CH vai slāpekļa atoms; un

R² ir:

(1) grupa, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [11]:

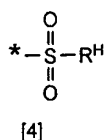
[Chem.11]



[11]

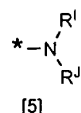
(kurā * norāda sasaistīšanās pozīciju; un R^{F1} un R^{G1} ir vienādi vai atšķirīgi un katrs ir (a) ūdeņraža atoms, (b) alkilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no hidroksilgrupas, aminogrupas, dialkilaminogrupas, piesātinātas cikliskas aminogrupas, alkilkarbonilaminogrupas, alkilsulfonilaminogrupas, arilgrupas, heteroarilgrupas, neobligāti aizvietota ar alkilgrupu, tetrahidrofuranilgrupu un karbamoilgrupu, (c) alkilkarbonilgrupa, (d) alkilsulfonilgrupa, (e) karbamoilgrupa vai (f) heteroarilgrupa, neobligāti aizvietota ar alkilgrupu, vai arī R^F un R^G kopā ar blakus esošu slāpekļa atomu veido piesātinātu ciklisku aminogrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no (a) halogēna atoma, (b) ciāngrupas, (c) hidroksilgrupas, (d) alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no hidroksilgrupas, alkoksigrupas, aminogrupas, alkoksikarbonilaminogrupas, alkilsulfonilaminogrupas un alkilkarbonilaminogrupas, (e) cikloalkilgrupas, (f) halogēnalkilgrupas, (g) alkoksigrupas, (h) oksogrupas, (i) grupas, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [4]:

[Chem.12]



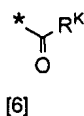
(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^H ir alkilgrupa vai arilgrupa), (j) grupas, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [5]:

[Chem.13]



(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^I un R^J ir vienādi vai atšķirīgi un katrs ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa, karbamoilgrupa, alkilkarbonilgrupa vai alkilsulfonilgrupa), (k) grupas, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [6]:

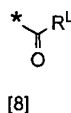
[Chem.14]



(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^K ir alkilgrupa, hidroksilgrupa, aminogrupa, alkilaminogrupa, dialkilaminogrupa, cikloalkilaminogrupa, (cikloalkil)alkilaminogrupa, (hidroksialkil)aminogrupa, (alkoksialkil)aminogrupa, alkoksigrupa, alkilsulfonilaminogrupa vai piesātināta cikliska aminogrupa) un (1) piesātināta cikliska aminogrupa, neobligāti aizvietota ar hidroksilgrupu,

(2) grupa, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [8]:

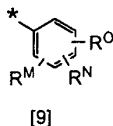
[Chem.15]



(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^L ir (a) alkilgrupa, (b) hidroksilgrupa, (c) alkoksigrupa, (d) piesātināta cikliska aminogrupa, neobligāti aizvietota ar alkilgrupu vai alkilsulfonilgrupu vai (e) aminogrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no alkilgrupas, cikloalkilgrupas, (cikloalkil)alkilgrupas, aralkilgrupas, halogēnalkilgrupas, dialkilaminoalkilgrupas, alkoksialkilgrupas un hidroksialkilgrupas),

(3) grupa, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [9]:

[Chem.16]



(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^M, R^N un R^O ir vienādi vai atšķirīgi un katrs ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms, ciāngrupa, alkoksigrupa, karbamoilgrupa, sulfamoilgrupa, monoalkilaminosulfonilgrupa vai alkilsulfonilgrupa, vai arī divi no R^M, R^N un R^O kopā veido metilēndioksigrupu),

(4) -OR^{P1} (kur R^{P1} ir alkilgrupa, neobligāti aizvietota ar grupu, izvēlētu no rindas, kas sastāv no hidroksilgrupas, dialkilaminogrupas, alkoksigrupas, tetrahidrofuranilgrupas un cikloalkilgrupas), vai

(5) heteroarilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no ciāngrupas, halogēna atoma, hidroksilgrupas, alkoksigrupas, alkilkarbonilgrupas, karbamoilgrupas, alkilgrupas, cikloalkilgrupas, (cikloalkil)alkilgrupas, aralkilgrupas, hidroksikarbonilgrupas un alkoksialkilgrupas;

[ii]:

X ir -CR^A;

R^A ir grupa, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [10]:

[Chem.17]



[10]

(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^B ir (a) aminogrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no alkilgrupas, cikloalkilgrupas, (cikloalkil)alkilgrupas un alkoksialkilgrupas, (b) alkoksigrupas, (c) hidroksilgrupa vai (d) piesātināta cikliska aminogrupa); un R² ir ūdeņraža atoms.

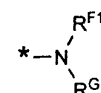
3. Savienojums vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kurā:

X ir CH;

R² ir:

(1) grupa, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [11]:

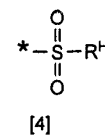
[Chem.18]



[11]

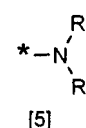
(kurā * norāda sasaistīšanās pozīciju; un R^{F1} un R^{G1} ir vienādi vai atšķirīgi un katrs ir (a) ūdeņraža atoms, (b) alkilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no hidroksilgrupas, aminogrupas, dialkilaminogrupas, piesātinātas cikliskas aminogrupas, alkilkarbonilaminogrupas, alkilsulfonilaminogrupas, arilgrupas, heteroarilgrupas, neobligāti aizvietotas ar alkilgrupu, tetrahidrofuranilgrupu un karbamoilgrupu, (c) alkilkarbonilgrupa, (d) alkilsulfonilgrupa, (e) karbamoilgrupa vai (f) heteroarilgrupa, neobligāti aizvietota ar alkilgrupu, vai arī R^{F1} un R^{G1} kopā ar blakus esošu slāpekļa atomu veido piesātinātu ciklisku aminogrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no (a) halogēna atoma, (b) ciāngrupas, (c) hidroksilgrupas, (d) alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no hidroksilgrupas, alkoksigrupas, aminogrupas, alkoksikarbonilaminogrupas, alkilsulfonilaminogrupas un alkilkarbonilaminogrupas, (e) cikloalkilgrupas, (f) halogēnalkilgrupas, (g) alkoksigrupas, (h) oksogrupas, (i) grupas, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [4]:

[Chem.19]



(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^H ir alkilgrupa vai arilgrupa), (j) grupas, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [5]:

[Chem.20]



(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^I un R^J ir vienādi vai dažādi un katrs ir ūdeņraža atoms, alkilgrupa, karbamoilgrupa, alkilkarbonilgrupa vai alkilsulfonilgrupa), (k) grupas, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [6]:

[Chem.21]



[6]

(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^K ir alkilgrupa, hidroksilgrupa, aminogrupa, alkilaminogrupa, dialkilaminogrupa, cikloalkilaminogrupa, (cikloalkil)alkilaminogrupa, (hidroksialkil)aminogrupa, (alkoksialkil)aminogrupa, alkoksigrupa, alkilsulfonilaminogrupa vai piesātināta cikliska aminogrupa), un (1) piesātināta cikliska aminogrupa, neobligāti aizvietota ar hidroksilgrupu),

(2) grupa, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [8]:

[Chem.22]

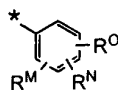


[8]

(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^L ir (a) alkilgrupa, (b) hidroksilgrupa, (c) alkoksigrupa, (d) piesātināta cikliska aminogrupa, neobligāti aizvietota ar alkilgrupu vai alkilsulfonilgrupu vai (e) aminogrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no alkilgrupas, cikloalkilgrupas, (cikloalkil)alkilgrupas, aralkilgrupas, halogēnalkilgrupas, dialkilaminoalkilgrupas, alkoksialkilgrupa un hidroksialkilgrupas),

(3) grupa, kas atbilst šādai vispārīgai formulai [9]:

[Chem.23]



[9]

(kurā * ir tāda pati nozīme, kā aprakstīts iepriekš; un R^M, R^N un R^O ir vienādi vai atšķirīgi un katrs ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms, ciāngrupa, alkoksigrupa, karbamoilgrupa, sulfamoilgrupa, monoalkilaminosulfonilgrupa vai alkilsulfonilgrupa, vai arī divi no R^M, R^N un R^O kopā veido metilēndioksigrupu),

(4) -OR^{P1} (kur R^{P1} ir alkilgrupa, neobligāti aizvietota ar grupu, izvēlētu no rindas, kas sastāv no hidroksilgrupas, dialkilaminogrupas, alkoksigrupas, tetrahidrofuranilgrupa un cikloalkilgrupas), vai

(5) heteroarilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai divām grupām, izvēlētām no rindas, kas sastāv no ciāngrupas, halogēna atoma, hidroksilgrupas, alkoksigrupas, alkilkarbonilgrupas, karbamoilgrupas, alkilgrupas, cikloalkilgrupas, (cikloalkil)alkilgrupas, aralkilgrupas, hidroksikarbonilgrupas un alkoksialkilgrupas.

4. Savienojums vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kurā savienojums ir izvēlēts no rindas, kas sastāv no šādiem savienojumiem (1) līdz (229):

- (1) (S)-4-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}piperazin-2-ons,
- (2) N-((S)-1-[2-((S)-1-(4-fluorfenil)etil)amino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]pirolidin-3-il)acetamīds,
- (3) (S)-6-(3,3-difluorazetidīn-1-il)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
- (4) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
- (5) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)-3,4'-bipiridīn-2',6'-diamīns,
- (6) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-metoksi-N⁶-(pirazin-2-il)-3,4'-bipiridīn-2',6'-diamīns,
- (7) (S)-2'-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6'-(pirazin-2-ilamino)-3,4'-bipiridīn-6-ols,
- (8) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-(oksazol-5-il)-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
- (9) (S)-6-hlor-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
- (10) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-[4-(metilsulfonil)fenil]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,

- (11) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-6-(1H-pirazol-4-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
- (12) (S)-2-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-iloksi}etanols,
- (13) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-6-(piridin-3-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
- (14) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-6-(piridin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
- (15) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-6-(piridin-4-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
- (16) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}pirolidin-2-ons,
- (17) (S)-4-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}piperazin-2,6-dions,
- (18) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}tetrahidropirimidin-2(1H)-ons,
- (19) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-6-(pirolidin-1-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
- (20) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-morfolīn-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
- (21) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}imidazolidin-2-ons,
- (22) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-(oksazol-5-il)-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
- (23) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-(6-metoksipiridin-3-il)-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
- (24) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-6-(1H-pirazol-3-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
- (25) (S)-4-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}piridin-2-ols,
- (26) (S)-5-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}piridin-2-ols,
- (27) N-((R)-1-(2-((S)-1-(4-fluorfenil)etilamino)-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il)pirolidin-3-il)acetamīds,
- (28) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)-4-(1H-pirazol-4-il)piridīn-2,6-diamīns,
- (29) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)-4-(1H-pirazol-3-il)piridīn-2,6-diamīns,
- (30) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-[3-(metilsulfonil)fenil]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidin-2,4-diamīns,
- (31) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-[4-(metilsulfonil)fenil]-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
- (32) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-(1-izopropil-1H-pirazol-4-il)-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
- (33) N-((S)-1-[2-((S)-1-(4-fluorfenil)etil)amino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il]pirolidin-3-il)acetamīds,
- (34) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-morfolīn-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
- (35) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)-4-tiomorfolīnpiridīn-2,6-diamīns,
- (36) (S)-3-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il}propan-1-ols,
- (37) (S)-N-(1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}azetidīn-3-il)acetamīds,
- (38) (S)-6-(azetidīn-1-il)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
- (39) (S)-6-(3-fluorazetidīn-1-il)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
- (40) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}azetidīn-2-ons,
- (41) (S)-4-(1-etil-1H-pirazol-4-il)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
- (42) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-(1-metil-1H-pirazol-5-il)-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
- (43) (S)-4-[1-(ciklopropilmetil)-1H-pirazol-4-il]-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
- (44) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-6-(tiazol-5-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
- (45) 1-{2-((S)-1-(4-fluorfenil)etilamino)-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}pirolidin-3-ols,
- (46) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(5-metiltiazol-2-il)-N⁶-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4,6-triamīns,
- (47) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)-4,5'-bipirimidīn-2,6-diamīns,

- (48) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-(2-metoksitiazol-5-il)-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidin-2,4-diamīns,
(49) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-6-(tiazol-2-il)pirimidin-2,4-diamīns,
(50) (S)-5-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]pikolīnitrils,
(51) (S)-1-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]piperidīn-4-karboksamīds,
(52) (S)-5-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]pikolīnamīds,
(53) 4-[2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]piperazīn-2-karboksamīds,
(54) 6-(3-aminopirolidin-1-il)-N²-[(S)-1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidin-2,4-diamīns,
(55) N-(1-[2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]pirolidin-3-il)metānsulfonamīds,
(56) (S)-2-[(2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il](2-hidroksietil)amino)etan-1-ols,
(57) (S)-N⁴-[2-(dimetilamino)etil]-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)pirimidin-2,4,6-triamīns,
(58) 1-2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]piperidīn-3-karboksamīds,
(59) (S)-1-[2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]pirolidīn-2-karboksamīds,
(60) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-[4-(metilsulfonyl)piperazin-1-il]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidin-2,4-diamīns,
(61) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-6-(1H-pirol-3-il)pirimidin-2,4-diamīns,
(62) (R)-1-[2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]-4-hidroksipirolidin-2-ons,
(63) N²-[(S)-1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-N⁶-[(tetrahydrofuran-2-il)metil]pirimidin-2,4,6-triamīns,
(64) ((S)-1-[2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]pirolidin-2-il)metanols,
(65) ((R)-1-[2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]pirolidin-2-il)metanols,
(66) (S)-1-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]piperidin-4-ols,
(67) (S)-1-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]azetidīn-3-ols,
(68) 1-[2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]piperidin-3-ols,
(69) (S)-5-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]nikotīnitrils,
(70) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-6-(2H-tetrazol-5-il)pirimidin-2,4-diamīns,
(71) (S)-N⁴-(2-aminoetil)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)pirimidin-2,4,6-triamīns,
(72) (S)-N-(2-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-ilamino]etil)metānsulfonamīds,
(73) (S)-N-(2-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-ilamino]etil)acetamīds,
(74) (S)-2-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-ilamino]acetamīds,
(75) (S)-4-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]benzamīds,
(76) (S)-3-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]benzonitrils,
(77) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-(furan-3-il)-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidin-2,4-diamīns,
(78) etil-(S)-1-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]piperidin-4-karboksilāts,
(79) (S)-5-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]nikotīnamīds,
(80) (S)-1-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]piperidīn-4-karbonskābe,
(81) (S)-2-[2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-ilamino]-2-feniletanols,
(82) (S)-2-[2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-ilamino]-3-fenilpropan-1-ols,
(83) (R)-2-[2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-ilamino]-4-metilpentan-1-ols,
(84) (S)-6-[2-(dimetilamino)etoksi]-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidin-2,4-diamīns,
(85) (S)-1-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]-1H-pirazol-4-karbonskābe,
(86) (S)-3-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]benzamīds,
(87) (S)-6-(benzo[d]1,3-dioksol-5-il)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidin-2,4-diamīns,
(88) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-(2-fluorpiridin-4-il)-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidin-2,4-diamīns,
(89) N²-[(S)-1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-6-[(tetrahydrofuran-2-il)metoksi]pirimidin-2,4-diamīns,
(90) (S)-2-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-iloksi]etanols,
(91) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-N⁶-[2-(pirolidin-1-il)etil]pirimidin-2,4,6-triamīns,
(92) (S)-3-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]izonikotīnamīds,
(93) (S)-3-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]izonikotīnitrils,
(94) (S)-2-[2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-ilamino]-3-metilbutan-1-ols,
(95) (S)-2-[2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etil]-6-[4-(metilsulfonyl)piperazin-1-il]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidin-2,4-diamīns,
(96) (1S,2S)-2-[2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-iloksi]cikloheksanols,
(97) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-[(5-metilpirazin-2-il)metil]-N⁶-(pirazin-2-il)pirimidin-2,4,6-triamīns,
(98) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(furan-2-ilmetil)-N⁶-(pirazin-2-il)pirimidin-2,4,6-triamīns,
(99) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-N⁶-[1-(piridin-3-il)etil]pirimidin-2,4,6-triamīns,
(100) (S)-1-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]-4-(hidroksimetil)piperidin-4-ols,
(101) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-N⁶-(piridin-2-ilmetil)pirimidin-2,4,6-triamīns,
(102) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-N⁶-(piridin-3-ilmetil)pirimidin-2,4,6-triamīns,
(103) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-N⁶-(piridin-4-ilmetil)pirimidin-2,4,6-triamīns,
(104) (S)-2-[2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-ilamino]-3-hidroksipropānamīds,
(105) (3S,4S)-1-[2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]pirolidin-3,4-diols,
(106) N²-[(S)-1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-6-(1,4-dioksa-8-azaspiro[4.5]dekan-8-il)pirimidin-2,4-diamīns,
(107) (S)-8-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]-1,3-dioksa-8-azaspiro[4.5]dekan-2-ons,
(108) (S)-4-(1-benzil-1H-pirazol-4-il)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)piridin-2,6-diamīns,
(109) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-[4-(fenilsulfonyl)piperazin-1-il]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidin-2,4-diamīns,
(110) (S)-4-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il]benzamīds,
(111) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)-4-(1H-pirol-3-il)piridin-2,6-diamīns,
(112) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)piridin-2,6-diamīns,
(113) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-(4-metil-1H-imidazol-1-il)-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidin-2,4-diamīns,
(114) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-(4-metoksifenil)-N⁶-(pirazin-2-il)piridin-2,6-diamīns,
(115) (S)-4-(4-fluorfenil)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)piridin-2,6-diamīns,
(116) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-metil-N⁶-(pirazin-2-il)piridin-2,6-diamīns,
(117) (S)-1-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]-N-(metilsulfonyl)piperidin-4-karboksamīds,
(118) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-(furan-3-il)-N⁶-(pirazin-2-il)piridin-2,6-diamīns,
(119) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-[4-(metilsulfonyl)piperazin-1-il]-N⁶-(pirazin-2-il)piridin-2,6-diamīns,
(120) (S)-1-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il]-4-(hidroksimetil)piperidin-4-ols,
(121) (S)-4-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il]benzolsulfonamīds,

- (122) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-metoksi-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
(123) 4-{2-[(1S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il}-1λ⁶,4-tiomorfolin-1,1-dions,
(124) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il}piperidin-4-ols,
(125) (S)-1-(4-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il}-1,4-diazepan-1-il)etanons,
(126) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)-N⁴-(pirimidin-2-il)piridīn-2,4,6-triamīns,
(127) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)-N⁴-(piridin-2-il)piridīn-2,4,6-triamīns,
(128) N²-[(S)-1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)-4-(1,4-dioksa-8-azaspiro[4.5]dekan-8-il)piridīn-2,6-diamīns,
(129) metil-(S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnāts,
(130) (S)-4-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}-N-metilbenzolsulfonamīds,
(131) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-(4-metil-1H-imidazol-1-il)-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
(132) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴,N⁶-di(pirazin-2-il)piridīn-2,4,6-triamīns,
(133) (S)-4-(ciklopropilmetoksi)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
(134) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N²-metil-4-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
(135) (S)-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il}metanols,
(136) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnskābe,
(137) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-(2-metoksietoksi)-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
(138) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidīn-4-karbonitrils,
(139) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnitrils,
(140) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(141) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-(1,2,4-oksadiazol-3-il)-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
(142) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-(1,2,4-oksadiazol-3-il)-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
(143) metil-(S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)nikotīnāts,
(144) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-N,N-dimetil-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(145) (S)-N-[2-(dimetilamino)etil]-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(146) (S)-N-t-butil-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(147) (S)-N-etil-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(148) (S)-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il}[4-(metānsulfonil)piperazin-1-il]metanons,
(149) (S)-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il}-(pirolidin-1-il)metanons,
(150) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-N-izopropil-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(151) (S)-1-{2-[(S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}azetidīn-2-karboksamīds,
(152) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)-4-(tetrahidro-2H-piran-4-iloksi)piridīn-2,6-diamīns,
(153) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}azetidīn-3-karboksamīds,
(154) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-N-(2-hidroksietil)-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(155) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-N-metil-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(156) (S)-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il}(morfolīn)metanons,
(157) (S)-N-benzil-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(158) (S)-N-ciklopropil-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(159) (S)-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il}(4-metilpiperazin-1-il)metanons,
(160) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-N-(2-metoksietil)-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(161) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-N-propil-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(162) (S)-N-ciklopropilmetil-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(163) (S)-N-ciklobutil-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(164) 2-(4-fluorfenil)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(165) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-N-izobutil-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(166) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)-N-(2,2,2-trifluoretil)izonikotīnamīds,
(167) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-N-(3-hidroksipropil)-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(168) (S)-N-(2-etoksietil)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)izonikotīnamīds,
(169) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}-N-metilazetidīn-3-karboksamīds,
(170) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-(metoksietil)-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
(171) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}-N,N-dimetilazetidīn-3-karboksamīds,
(172) (S)-N-(1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}azetidīn-3-il)metānsulfonamīds,
(173) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}azetidīn-3-karbonitrils,
(174) 2-(4-fluorfenil)-2-[4-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-2-ilamino]etanols,
(175) (S)-N-etil-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}azetidīn-3-karboksamīds,
(176) (S)-N,N-dietil-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}azetidīn-3-karboksamīds,
(177) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il}etanols,
(178) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-(3-metoksiazetidīn-1-il)-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
(179) (S)-N-[2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]-3-metilazetidīn-3-ols,
(180) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-N-metil-6-(pirazin-2-ilamino)nikotīnamīds,
(181) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-N,N-dimetil-6-(pirazin-2-ilamino)nikotīnamīds,
(182) (S)-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)nikotīnamīds,
(183) (S)-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-3-il}(morfolīn)metanons,
(184) (S)-N-ciklopropilmetil-2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)nikotīnamīds,
(185) (S)-N-(1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}azetidīn-3-il)etānsulfonamīds,
(186) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}-N-izopropilazetidīn-3-karboksamīds,
(187) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}-3-(trifluormetil)azetidīn-3-ols,
(188) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}azetidīn-3-il}(pirolidin-1-il)metanons,
(189) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}-N-(2-metoksietil)azetidīn-3-karboksamīds,
(190) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}azetidīn-3-il}(piperidin-1-il)metanons,
(191) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}azetidīn-3-il}(morfolīn)metanons,
(192) (S)-N-(ciklopropil)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}azetidīn-3-karboksamīds,
(193) (S)-N-(ciklopropilmetil)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}azetidīn-3-karboksamīds,
(194) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}-N-(2-hidroksietil)azetidīn-3-karboksamīds,
(195) (S)-3-ciklopropil-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il}azetidīn-3-ols,

(196) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]-3-izopropilazetidīn-3-ols,
 (197) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il]azetidīn-3-ols,
 (198) (S)-3-ciklopropil-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il]azetidīn-3-ols,
 (199) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il]-3-izopropilazetidīn-3-ols,
 (200) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il]-3-metilazetidīn-3-ols,
 (201) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il]-3-(trifluormetil)azetidīn-3-ols,
 (202) (S)-4-(3,3-difluorazetidīn-1-il)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
 (203) (S)-N-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il}acetamīds,
 (204) (S)-N-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il}metānsulfonamīds,
 (205) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il}urīnviela,
 (206) (S)-4-(3-ciklopropil-3-metoksiazetidīn-1-il)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
 (207) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-(3-izopropil-3-metoksiazetidīn-1-il)-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
 (208) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-(3-metoksi-3-metilazetidīn-1-il)-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
 (209) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-N⁶-(5-metilpirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
 (210) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-[1-(metānsulfonil)piperidin-4-il]-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
 (211) (S)-N-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il}propionamīds,
 (212) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-[1-(2-metoksietil)-1H-pirazol-4-il]-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
 (213) (S)-4-(1-ciklopropil-1H-pirazol-4-il)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
 (214) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-[1-(metoksietil)-1H-pirazol-4-il]-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns,
 (215) (S)-6-[3-(dimetilamino)azetidīn-1-il]-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
 (216) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-[3-(metilamino)azetidīn-1-il]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
 (217) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)-6-[3-(pirolidīn-1-il)azetidīn-1-il]pirimidīn-2,4-diamīns,
 (218) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-(3-morfolīnazetidīn-1-il)-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
 (219) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-6-[3-(4-metilpiperazin-1-il)azetidīn-1-il]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
 (220) (S)-1-(1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]azetidīn-3-il}piperidin-4-ols,
 (221) 4-{2-[(1S)-1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]-1λ⁶,4-tiomorfolīn-1,1-dions,
 (222) (S)-1-(1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]azetidīn-3-il}urīnviela,
 (223) (S)-1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]azetidīn-3-il}metanols,
 (224) t-butil-(S)-(1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]azetidīn-3-il}metilkarbamāts,
 (225) (S)-6-[3-(aminometil)azetidīn-1-il]-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-N⁴-(pirazin-2-il)pirimidīn-2,4-diamīns,
 (226) (S)-N-[(1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]azetidīn-3-il}metil)etānsulfonamīds,
 (227) (S)-N-[(1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)pirimidin-4-il]azetidīn-3-il}metil)acetamīds,
 (228) (S)-N²-[1-(4-fluorfenil)etil]-4-[3-morfolīnazetidīn-1-il]-N⁶-(pirazin-2-il)piridīn-2,6-diamīns, un
 (229) (S)-1-(1-{2-[1-(4-fluorfenil)etilamino]-6-(pirazin-2-ilamino)piridin-4-il]azetidīn-3-il}piperidin-4-ols.

5. Farmaceutiska kompozīcija, kas kā aktīvu sastāvdaļu satur savienojumu vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzījai.

6. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, izmantošanai vēža, iekaisuma vai angiopātijas profilaksei vai ārstēšanai.

7. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 6. pretenziju, kur vēzis ir asins vēzis vai viendabīgs vēzis.

8. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 7. pretenziju, kur asins vēzis ir mieloīdproliferatīvā neoplazma, mieloīdoplastiskie sindromi, akūtā limfocītu leukēmija, akūtā mieloīdu leukēmija, hroniskā mieloīdu leukēmija vai multiplā mieloma.

9. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 8. pretenziju, kur mieloīdproliferatīvā neoplazma ir *polycythemia vera*.

10. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 8. pretenziju, kur mieloīdproliferatīvā neoplazma ir esenciālā trombocitose.

11. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 8. pretenziju, kur mieloīdproliferatīvā neoplazma ir idiopātiskā mieloīdofibroze.

12. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 7. pretenziju, kur viendabīgais vēzis ir prostatas vēzis vai krūts vēzis.

13. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 6. pretenziju, kur iekaisuma traucējums ir reimatoīdais artrīts, iekaisīgu zarnu slimība, osteoporoze vai multiplā skleroze.

14. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 6. pretenziju, kur angiopātija ir plaušu hipertensija, arterioskleroze, aneirisma vai varikozās vēnas.

- | | |
|--|-------------------------|
| (51) A23J 1/00 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | (11) 2417859 |
| A23J 3/00 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | |
| (21) 11720609.4 | (22) 25.01.2011 |
| (43) 15.02.2012 | |
| (45) 12.03.2014 | |
| (31) 2009145043 | (32) 07.12.2009 (33) RU |
| (86) PCT/RU2011/000035 | 25.01.2011 |
| (87) WO2011/078746 | 30.06.2011 |
| (73) Ponomarev, Vasily Vasilievich, Kaluzhskaya pl. 1-1-33, Moscow 117049, RU
Bikbov, Takhir Mukhammedovich, Proezd Karamzina 9-1-185, Moscow 117463, RU | |
| (72) PONOMAREV, Vasily Vasilievich, RU
BIKBOV, Takhir Mukhammedovich, RU | |
| (74) Bucher, Ralf Christian, Patentanwalt Dipl.-Ing., Alte Landstrasse 23, 85521 Ottobrunn, DE
Lūcija KUŽJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV | |
| (54) KONCENTRĒTI PROTEĪNU PRODUKTI UN METODES TO RAŽOŠANAI
CONCENTRATED PROTEIN PRODUCTS AND METHODS FOR PRODUCING SAME | |
| (57) 1. Metode koncentrētu proteīnu produktu gatavošanai, kur pirmajā stadijā no izejmateriālu avotu ūdens suspensijām koncentrācijā, kas pārsniedz kritisko gela veidošanās koncentrāciju, gela veidošanas ceļā tiek radīti geli un otrajā stadijā iegūtie geli tiek papildus ekstrahēti ar šķīdinātājiem, kas ekstrahē sola frakciju, lai iegūtu gala produktu, kas ir gela frakcija ar proteīna molekulu trīsdimensiju sašūtu tīklveida struktūru, turklāt pirms ekstrakcijas gelu virsmas laukums tiek papildus palielināts ar ūdens tvaiku eksploziju, kasaldēšanu un sekojošu ūdens aizvākšanu no mikroporainā gela, ar pārtikas irdinātājiem, ar strauju spiediena pazemināšanu vai, izmantojot kriotropo efektu. | |
| 2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt gels tiek gatavots ar termotropo, kriotropo vai barotermotropo gela veidošanas metodi. | |
| 3. Proteīnu produkti gela frakciju veidā ar proteīna molekulu trīsdimensiju sašūtu tīklveida struktūru, kas iegūstami ar metodi saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju. | |

- | | |
|--|-------------------------|
| (51) E05F 3/20 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | (11) 2426300 |
| E05F 3/10 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | |
| E05F 3/22 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | |
| (21) 10187458.4 | (22) 13.10.2010 |
| (43) 07.03.2012 | |
| (45) 16.04.2014 | |
| (31) 10175479 | (32) 06.09.2010 (33) EP |
| (73) In & Tec S.r.l., Via Scuole 1/G, 25128 Brescia, IT
(72) BACCETTI, Luciano, IT | |
| (74) Autuori, Angelo, et al, Eureka IP Consulting, Borgo Santa Lucia, 31, IT-36100 Vicenza, IT | |

Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV

(54) **DURVJU, ĪPAŠI STIKLA DURVJU, AIZVĒRŠANAS VIRA DOOR CLOSING HINGE, PARTICULARLY FOR GLASS DOORS**

(57) 1. Durvju, īpaši stikla durvju, aizvēršanas vira, kura ir atbalstāma ar stacionāras balstkonstrukcijas palīdzību, pie tam durvis ir pārvietojamas starp atvērtu pozīciju un aizvērtu pozīciju un durvju aizvēršanas vira satur:

- kārbveida korpusu (10), kas ir nostiprināms pie pirmās stacionārās balstkonstrukcijas un durvīm, un tapu (20), kas definē pirmo longitudinālo asi (X), kas ir nostiprināma pie otrās stacionārās balstkonstrukcijas (S) un pie durvīm, pie tam minētā tapa (20) un minētais kārbveida korpuss (10) ir savstarpēji savienoti ar rotācijas iespēju ap minēto pirmo asi (X) starp atvērtu durvju pozīciju un aizvērtu durvju pozīciju,

- aizvēršanas līdzekli (30), lai automātiski atgrieztu durvis no atvērtas pozīcijas aizvērtā pozīcijā,

- bremzēšanas līdzekli (40), kas iedarbojas uz minēto aizvēršanas līdzekli (30), lai pretdarbotos tā darbībai,

pie tam minētais aizvēršanas līdzeklis (30) satur pirmo izciļņa elementu (31), kas mijiedarbojas ar pirmo plunžera elementu (32), kas ir pārvietojams minētajā kārbveida korpusā (10) starp pirmo saspiesto gala pozīciju, kura atbilst atvērtu durvju pozīcijai, un pirmo izstiepto gala pozīciju, kura atbilst aizvērtu durvju pozīcijai,

pie tam bremzēšanas līdzeklis (4) satur otro izciļņa elementu (41), kas mijiedarbojas ar otro plunžera elementu (42), kas ir pārvietojams minētajā kārbveida korpusā (10) starp otro saspiesto gala pozīciju, kura atbilst aizvērtu durvju pozīcijai, un otro izstiepto gala pozīciju, kura atbilst atvērtu durvju pozīcijai,

pie tam abi minētie izciļņa elementi (31, 41) ir unitāri ar minēto tapu (20) tādā veidā, lai varētu unitāri rotēt attiecībā pret minēto kārbveida korpusu (10),

pie tam minētais pirmais plunžera elements (32) satur vismaz vienu pirmo grūdējgalvu (33, 33'), kas mijiedarbojas ar minētā pirmā izciļņa elementa (31) vismaz vienu, būtībā pirmo, no pretēji profilētajām balstvirsmām (34, 34'), un minētais otrais plunžera elements (42) ietver vismaz vienu otro grūdējgalvu (43), kas mijiedarbojas ar minētā otrā izciļņa elementa (41) vismaz vienu otro pretēji profilēto balstvirsmu (44),

pie tam minētais aizvēršanas līdzeklis (30) satur pirmo elastīgo pretdarbības līdzekli (39), kas iedarbojas uz minēto pirmo plunžera elementu (32), lai veicinātu minētās vismaz vienas pirmās grūdējgalvas (33, 33') un minētās vismaz vienas pirmās pretēji profilētās balstvirsmas (34, 34') savstarpēju mijiedarbību, kā arī minētais bremzēšanas līdzeklis (40) satur otro elastīgo pretdarbības līdzekli (47), kas iedarbojas uz minēto otro plunžera elementu (41), lai veicinātu minētās vismaz vienas otrās grūdējgalvas (43) un minētās vismaz vienas otrās pretēji profilētās balstvirsmas (44) savstarpēju mijiedarbību,

kas raksturīga ar to, ka minētā tapa (20) ir iestarpināta starp pirmo un otro plunžera elementiem (32, 42), un vēl ir raksturīga ar to, ka minētais pirmais un otrais plunžera elementi (32, 42) abi ir slidoši pārvietojami gar otro asi (Y), kas būtībā ir perpendikulāra minētajai pirmajai asij (X), kā arī ar to, ka abām minētajām vismaz vienai pirmajai un otrajai grūdējgalvai (33, 33', 43) vispārīgi ir šķīvja veida forma, lai veidotu atbilstošo vismaz vienu pirmo un otro plaknes (π' , π'' , π''') būtībā perpendikulāri asij (X).

2. Durvju aizvēršanas vira saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam minētie pirmais un otrais plunžera elementi (32, 42) ir savstarpēji opozītas attiecībā pret minēto tapu (20).

3. Durvju aizvēršanas vira saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam vismaz viena pirmā un otrā no minētajām plaknēm (π' , π'' , π''') ir savstarpēji paralēlas.

4. Durvju aizvēršanas vira saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju, pie kam minētie pirmais un otrais plunžera elementi (32, 42) abi ir slidoši pārvietojami vienā un tai pašā darba kamerā (50), kas definē otro asi (Y), kura ir iekšējā ass attiecībā pret kārbveida korpusu (10).

5. Durvju aizvēršanas vira saskaņā ar vienu vai vairākām iepriekšējām pretenzijām, pie kam vismaz viena no grūdējgalvām (33, 33', 43), kas minētas kā pirmā un otrā grūdējgalvas, satur atbilstošī vismaz vienu pirmo un otro no minētajām plakanajām priekšējām

skaldnēm, kas būtībā ir paralēlas viena otrai un minētajai pirmajai longitudinālajai asij (X), pie tam vismaz viena pirmā un otrā no pretēji profilētajām balstvirsmām (34, 34', 44) satur atbilstošī vismaz vienu pirmo un otro no būtībā plakanajām kontaktvirsmām (37'', 38'', 46''), kas ir perpendikulāras viena pret otru un ir paralēlas minētajai pirmajai longitudinālajai asij (X), turklāt vismaz viena pirmā un otrā no minētajām priekšējām skaldnēm (35'', 36'', 45'') ir kontaktsakere ar minēto vismaz vienu pirmo un otro no kontaktvirsmām (37'', 38'', 46'').

6. Durvju aizvēršanas vira saskaņā ar 5. pretenziju, pie kam minētā vismaz viena pirmā priekšējā skaldne (35'', 36'') un vismaz viena pirmā kontaktvirsmā (37'', 38'') būtībā ir paralēlas viena otrai minētajā aizvērtajā durvju pozīcijā un būtībā ir perpendikulāras viena otrai minētajā atvērtajā durvju pozīcijā, pie tam vismaz viena otrā priekšējā skaldne (45'') un vismaz viena otrā kontaktvirsmā (46'') būtībā ir perpendikulāras viena attiecībā pret otru minētajā aizvērtajā durvju pozīcijā un būtībā ir paralēlas viena otrai minētajā atvērtajā durvju pozīcijā.

7. Durvju aizvēršanas vira saskaņā ar 4. pretenziju, pie kam: darba kamera (50) satur darba fluīdu; minētais pirmais plunžera elements (32) satur būtībā cilindrisku pirmo aizmugures daļu (32') un pirmo priekšējo daļu (32''), kas ietver minēto vismaz vienu pirmo grūdējgalvu (33, 33'); minētais otrais plunžera elements (42) satur būtībā cilindrisku otro aizmugures daļu (42') un otro priekšējo daļu (42''), kura ietver minēto vismaz vienu otro grūdējgalvu (43); minētās pirmā un otrā aizmugures daļas (32', 42') ir konfigurētas tā, lai sadalītu minēto darba kameru (50) pirmajā, otrajā un trešajā blakus esošos maināma tilpuma nodalījumos (51, 52, 53), kas atrodas savstarpējā fluīda komunikācijā.

8. Durvju aizvēršanas vira saskaņā ar iepriekšējo pretenziju, pie kam minētais pirmais un trešais maināma tilpuma nodalījumi ir konfigurēti tā, lai nodrošinātu minētajā aizvērtu durvju pozīcijā attiecīgi atbilstību maksimālajam un minimālajam tilpumam, pie tam minētais pirmais elastīgais pretdarbības līdzeklis (39) ir izvietots minētajā pirmajā nodalījumā (51), minētais otrais pretdarbības līdzeklis (47) ir izvietots minētajā trešajā nodalījumā (53) un gan pirmais, gan otrais izciļņa elementi (31, 41) ir izvietoti minētajā otrajā nodalījumā (52).

9. Durvju aizvēršanas vira saskaņā ar 7. vai 8. pretenziju, pie kam minētā darba kamera (50) satur vadības līdzekli (60), lai regulētu darba fluīda plūsmu un ļautu tam plūst no minētā pirmā nodalījuma (51) uz minēto trešo nodalījumu (53) caur otro nodalījumu (52), durvis atverot, un ļautu tam plūst atpakaļ no minētā trešā nodalījuma (53) uz minēto pirmo nodalījumu (51) caur minēto otro nodalījumu (52), durvis aizverot.

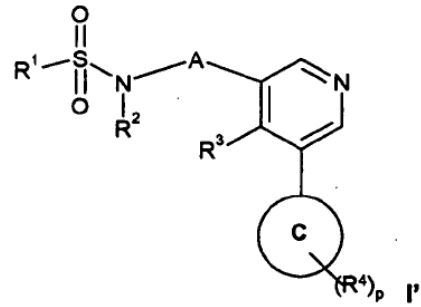
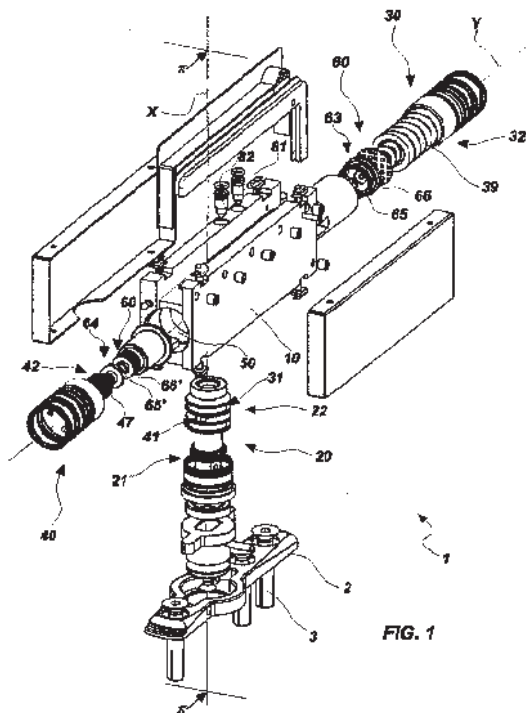
10. Durvju aizvēršanas vira saskaņā ar 9. pretenziju, pie kam: minētais vadības līdzeklis (60) satur pirmo kanālu (61), kas iet cauri minētajam pirmajam plunžera elementam (32), lai savienotu fluīda komunikācijai minēto pirmo nodalījumu (51) un minēto otro nodalījumu (52), un satur otro kanālu (62), kas iet cauri minētajam otrajam plunžera elementam (42), lai savienotu fluīda komunikācijai minēto trešo nodalījumu (53) un minēto otro nodalījumu (52); minētais vadības līdzeklis (60) vēl satur pirmo kontrolvārstu (63), kas mijiedarbojas ar minēto pirmo caurplūdes kanālu (61), un otro kontrolvārstu (64), kas mijiedarbojas ar otro minēto caurplūdes kanālu (62); minētais pirmais un otrais kontrolvārsti (63, 64) savstarpēji mijiedarbojas, lai selektīvi atvērtos, durvis atverot, un tādējādi ļautu darba šķidrums plūst no minētā pirmā nodalījuma (51) uz minēto otro nodalījumu (52) caur minēto pirmo caurplūdes kanālu (61) un no minētā otrā nodalījuma (52) uz minēto trešo nodalījumu (53) caur minēto otro caurplūdes kanālu (62) un selektīvi aizvērtos, durvis aizverot, tādējādi novēršot darba fluīda atpakaļplūsmu caur tiem.

11. Durvju aizvēršanas vira saskaņā ar 10. pretenziju, pie kam minētais vadības līdzeklis (60) papildus satur hidraulisku kontūru (70), kas atrodas minētā kārbveida korpusa (10) iekšpusē, lai savienotu fluīda komunikācijai minēto trešo nodalījumu (53) un minēto pirmo nodalījumu (51) caur minēto otro nodalījumu (52), aizverot minēto pirmo un otro kontrolvārstus (63, 64) un tādējādi pieļaujot darba fluīda atpakaļplūsmu, durvis aizverot.

12. Durvju aizvēršanas vira saskaņā ar 11. pretenziju, pie kam minētais hidrauliskais kontūrs (70) satur starposmu (75) starp minēto pirmo plunžera elementu (42) un minēto darba kameru (50), lai savienotu fluīda komunikācijai minēto trešo maināma tilpuma

nodalījumu (53) un minēto otro maināmā tilpuma nodalījumu (52), pie tam hidrauliskais kontūrs (70) papildus ietver kanālu (71), kas iet caur minēto kārbveida korpusu (10) un kam vismaz ieplūdes ports (72) ir fluīda komunikācijā ar minēto otro mainīgā tilpuma nodalījumu (52) un kam vismaz izplūdes ports (73) ir fluīda komunikācijā ar minēto pirmo mainīgā tilpuma nodalījumu (51).

13. Durvju aizvēršanas vira saskaņā ar 12. pretenziju, pie kam minētais kanāls (71) satur otro izplūdes portu (74), un minētā pirmā aizmugures daļa (32'') satur trešo caurplūdes kanālu (32'''), caur kuru minētās otrās longitudinālās ass (Y) virzienā slīd minētais plunžera elements, pie tam minēto otro izplūdes portu (74) un trešo caurplūdes kanālu (32''') ir iespējams savstarpēji atvienot, kad minētais pirmais plunžera elements (32) atrodas saspiestas gala pozīcijas tuvumā, un tos ir iespējams savstarpēji savienot, kad minētais pirmais plunžera elements (32) atrodas izstieptas gala pozīcijas tuvumā, lai selektīvi savienotu fluīda komunikācijai minēto kanālu (71) ar minēto pirmo mainīgā tilpuma nodalījumu (51) tā, lai pieļautu fiksatora (aizkritņa slēdzenes) nostrādi, durvīm tuvojoties aizvērtai pozīcijai.



vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kurā:

A ir -CHR⁵;
 gredzens C ir fenilgrupa vai 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa;
 R¹ ir C₁₋₇alkilgrupa, halogēnalkilgrupa, C₃₋₇cikloalkilgrupa, C₆₋₁₀arilgrupa, C₆₋₁₀aril-C₁₋₇alkilgrupa, C₆₋₁₀ariloksi-C₁₋₇alkilgrupa, heteroarilgrupa vai heterociklilgrupa, kur alkilgrupa, arilgrupa, heteroarilgrupa, heterociklilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar 1 līdz 5 R⁷;

R² ir ūdeņraža atoms, C₁₋₇alkilgrupa, halogēn-C₁₋₇alkilgrupa, C₃₋₇cikloalkilgrupa, C₃₋₇cikloalkil-C₁₋₇alkilgrupa, hidroksi-C₁₋₇alkilgrupa, C₁₇alkil-OC(O)C₁₋₇alkilgrupa, C₁₋₇alkoksi-C₁₋₇alkilgrupa, heteroarilgrupa, heterociklilgrupa vai C₆₋₁₀arilgrupa; kur arilgrupa un heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar hidroksilgrupu, C₁₋₇alkoksigrupu, C₁₋₇alkilgrupu, halogēn-C₁₋₇alkilgrupu, halogēna atomu, CN vai C₃₋₇cikloalkilgrupu;

R³ ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms, C₁₋₇alkilgrupa, halogēn-C₁₋₇alkilgrupa, C₃₋₇cikloalkilgrupa, ciāngrupa, C₁₋₇alkoksigrupa, hidroksilgrupa, nitrogrupa, -NH₂, -NH(C₁₋₇alkil) vai -N(C₁₋₇alkil)₂;

katrs R⁴ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, C₁₋₇alkilgrupas, halogēn-C₁₋₇alkilgrupas, C₃₋₇cikloalkilgrupas, ciāngrupas, -NH₂, -NH(C₁₋₇alkil), -N(C₁₋₇alkil)₂, C₁₋₇alkoksigrupas, halogēn-C₁₋₇alkoksigrupas, hidroksilgrupas, karboksilgrupas, nitrogrupas, sulfonilgrupas, sulfamoilgrupas, sulfonamīdgrupas, C₆₋₁₀arilgrupas, heterociklilgrupas, C₆₋₁₀ariloksigrupas, heterocikliloksigrupas, -SH, -S-C₁₋₇alkilgrupas, -C(O)O-C₆₋₁₀arilgrupas, -C(O)O-heterociklilgrupas, -C(O)O-heteroarilgrupas, -C(O)NR²-C₁₋₇alkilgrupas, -C(O)NR²-C₆₋₁₀arilgrupas, -C(O)NR²-heteroarilgrupas, -C(O)NR²-heterociklilgrupas, -NR²C(O)-C₁₋₇alkilgrupas, -NR²C(O)-C₆₋₁₀arilgrupas, -NR²C(O)-heteroarilgrupas, -NR²C(O)-heterociklilgrupas, -OC(O)-C₁₋₇alkilgrupas, -OC(O)-C₆₋₁₀arilgrupas, -OC(O)-heteroarilgrupas un -OC(O)-heterociklilgrupas; kur R⁴ ir neobligāti aizvietots ar 1 līdz 5 R⁷; vai

divas blakus esošas R⁴ grupas ar atomiem, pie kuriem tās ir pievienotas, var veidot fenilgrupas vai 5- vai 6-locekļu gredzena heteroarilgrupu, kurā minētais fenilgrupas vai heteroarilgrupas gredzens ir neobligāti aizvietots ar 1 līdz 4 R⁸;

R⁶ ir C₁₋₇alkilgrupa, C₃₋₇cikloalkilgrupa, halogēn-C₁₋₇alkilgrupa, heterociklilgrupa, heteroarilgrupa vai C₆₋₁₀arilgrupa;

katrs R⁷ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, C₁₋₇alkilgrupas, C₃₋₇cikloalkilgrupas, C₁₋₇alkoksigrupas, C₆₋₁₀ariloksigrupas, heterociklilgrupas, C₆₋₁₀arilgrupas, heteroarilgrupas, CN un halogēn-C₁₋₇alkilgrupas;

katrs R⁸ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, C₁₋₇alkilgrupas, halogēn-C₁₋₇alkilgrupas, C₁₋₇alkoksigrupas, CN un halogēn-C₁₋₇alkoksigrupas; vai

R² un R³; R¹ un R²; R¹ un R³; R¹ un R³; vai R² un R⁵ ar atomiem, pie kuriem tie ir pievienoti, var veidot 4- līdz 7-locekļu heterociklilgrupu; vai

R³ un R⁵ kopā ar atomiem, pie kuriem tie ir pievienoti, var veidot C₅₋₇cikloalkilgrupu; un

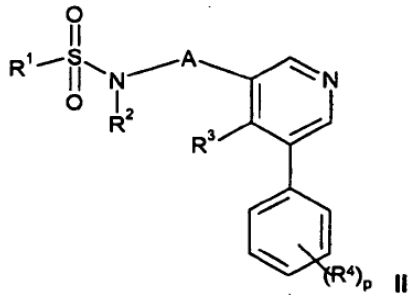
kur katra heteroarilgrupa ir monocikliska, aromātiska gredzens, kas satur 5 vai 6 gredzena atomus, kas izvēlēti no oglekļa atomiem un 1 līdz 5 heteroatomiem, un

katra heterociklilgrupa ir monocikliska, piesātināta vai daļēji piesātināta, izņemot nearomātisko daļu, kas satur 4 līdz 7 gredzena atomus, kas izvēlēti no oglekļa atomiem un 1 līdz 3 heteroatomiem; un katrs heteroatoms ir skābekļa atoms, slāpekļa atoms vai sēra atoms; un

p ir 0, 1, 2, 3, 4 vai 5, ar nosacījumu, ka gredzens C kopā ar divām blakus esošām R⁴ grupām neveido 2-indolgrupu.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu (II):

- | | | | | |
|------|--|------|----------------|---------|
| (51) | C07D 213/76 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/4418 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 9/00 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | (11) | 2429995 | |
| (21) | 10719758.4 | (22) | 12.05.2010 | |
| (43) | 21.03.2012 | | | |
| (45) | 22.01.2014 | | | |
| (31) | 178677 P | (32) | 15.05.2009 | (33) US |
| | 318413 P | | 29.03.2010 | US |
| (86) | PCT/EP2010/056572 | | 12.05.2010 | |
| (87) | WO2010/130796 | | 18.11.2010 | |
| (73) | Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH | | | |
| (72) | CHAMOIN, Sylvie, CH
HU, Qi-Ying, US
PAPILLON, Julien, US | | | |
| (74) | Mueller, Philippe, et al, Novartis Pharma AG, Patent Department, 4002 Basel, CH
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV | | | |
| (54) | ARILPIRIDĪNI KĀ ALDOSTERONA SINTĀZES INHIBITORI
ARYL PYRIDINE AS ALDOSTERONE SYNTHASE INHIBITORS | | | |
| (57) | 1. Savienojums ar formulu (I'): | | | |



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur

A ir -CHR⁵;

R¹ ir C₁₋₇alkilgrupa, halogēn-C_{1,7}alkilgrupa, C₃₋₇cikloalkilgrupa, C₆₋₁₀arilgrupa, C₆₋₁₀aril-C_{1,7}alkilgrupa, C₆₋₁₀ariloksi-C_{1,7}alkilgrupa, heteroarilgrupa vai heterociklilgrupa, kur alkilgrupa, arilgrupa, heteroarilgrupa, heterociklilgrupa ir neobligāti aizvietotas ar 1 līdz 5 R⁷; R² ir ūdeņraža atoms, C_{1,7}alkilgrupa, halogēn-C_{1,7}alkilgrupa vai C_{3,7}cikloalkilgrupa;

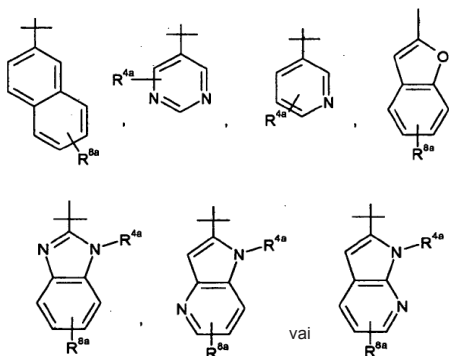
R³ ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms, C_{1,7}alkilgrupa, halogēn-C_{1,7}alkilgrupa, C_{3,7}cikloalkilgrupa, ciāngrupa, C_{1,7}alkoksigrupa, hidroksilgrupa, nitrogrupa, -NH₂, -NH(C_{1,7}alkil) vai -N(C_{1,7}alkil)₂; katrs R⁴ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, C_{1,7}alkilgrupas, halogēn-C_{1,7}alkilgrupas, C_{3,7}cikloalkilgrupas, ciāngrupas, -NH₂, -NH(C_{1,7}alkil), -N(C_{1,7}alkil)₂, C_{1,7}alkoksigrupas, halogēn-C_{1,7}alkoksigrupas, hidroksilgrupas, karboksilgrupas, nitrogrupas, sulfonilgrupas, sulfamoilgrupas, sulfonamīdgrupas, C₆₋₁₀arilgrupas, heterociklilgrupas, C₆₋₁₀ariloksigrupas, heterocikliloksigrupas, -SH, -S-C_{1,7}alkilgrupas, -C(O)O-arilgrupas, -C(O)O-heterociklilgrupas, -C(O)O-heteroarilgrupas, -C(O)NR²-C_{1,7}alkilgrupas, -C(O)NR²-C₆₋₁₀arilgrupas, -C(O)NR²-heteroarilgrupas, -C(O)NR²-heterociklilgrupas, -NR²C(O)-C_{1,7}alkilgrupas, -NR²C(O)-C₆₋₁₀arilgrupas, -NR²C(O)-heteroarilgrupas, -NR²C(O)-heterociklilgrupas, -OC(O)-C_{1,7}alkilgrupas, -OC(O)-C₆₋₁₀arilgrupas, -OC(O)-heteroarilgrupas un -OC(O)-heterociklilgrupas; kur R⁴ ir neobligāti aizvietots ar 1 līdz 5 R⁷;

R⁵ un R⁶ neatkarīgi ir C_{1,7}alkilgrupa, C_{3,7}cikloalkilgrupa, halogēn-C_{1,7}alkilgrupa, heterociklilgrupa;

katrs R⁷ neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, C_{1,7}alkilgrupas, C_{3,7}cikloalkilgrupas, C_{1,7}alkoksigrupas, C₆₋₁₀ariloksigrupas, heterociklilgrupas, C₆₋₁₀arilgrupas, heteroarilgrupas, CN un halogēn-C_{1,7}alkilgrupas; un p ir 0, 1, 2, 3, 4 vai 5.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur C ir fenilgrupa.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur gredzens C vai gredzens C kopā ar 2 R⁴ grupām ir:



kurā R^{8a} ir R⁸ vai ūdeņraža atoms un R^{4a} ir R⁴ vai ūdeņraža atoms.

5. Savienojums saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur R⁴ neatkarīgi ir izvēlēts no C_{1,4}alkilgrupas, C_{1,4}alkoksigrupas, CN, halogēna atoma, halogēn-C_{1,4}alkilgrupas vai halogēn-C_{1,7}alkoksigrupas.

6. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur R¹ ir C_{1,4}alkilgrupa, R² ir ūdeņraža atoms, R³ ir ūdeņraža atoms, A ir CHR⁵, R⁵ ir C_{1,4}alkilgrupa vai C_{3,6}cikloalkilgrupa, p ir 1 vai 2; un katrs R⁴ neatkarīgi ir C_{1,4}alkilgrupa,

halogēn-C_{1,4}alkilgrupa, C_{1,4}alkoksigrupa, CN, halogēna atoms vai halogēn-C_{1,4}alkoksigrupa.

7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, izvēlēts no:

- N-(1-(5-(3-hlor-4-ciānfenil)piridin-3-il)-2-metilpropil)etānsulfonamīda;
- N-(1-(5-(4-ciān-3-metoksifenil)piridin-3-il)etil)etānsulfonamīda;
- N-(1-(5-(3-hlor-4-ciānfenil)piridin-3-il)etil)etānsulfonamīda;
- N-(1-(5-(3-hlor-4-ciānfenil)piridin-3-il)butil)etānsulfonamīda;
- (R)-N-((5-(3-hlor-4-ciānfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;
- (S)-N-((5-(3-hlor-4-ciānfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;
- N-((5-(3-hlor-4-ciānfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;
- N-((5-(4-ciān-3-metoksifenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;
- (S)-N-((5-(4-ciān-2-metoksifenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;
- (R)-N-((5-(4-ciān-2-metoksifenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;
- (R)-N-((5-(4-ciān-3-fluorfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;
- (S)-N-((5-(4-ciān-3-fluorfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;
- N-((5-(4-ciān-2-fluorfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;
- N-((5-(3-hlor-4-ciānfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;
- N-((5-(3-hlor-4-ciānfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)propān-2-sulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(2-metoksifenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-((5-(2-hlorfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;
- N-((5-(4-ciānfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(3-fluorfenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(4-metoksifenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(4-etoksifenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-((5-(3-hlorfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(4-fluorfenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(2,4-dihlorfenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(3,5-dimetilfenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(3,5-dihlorfenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-((5-(4-hlorfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(4-(trifluormetoksi)fenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(2,3-dihlorfenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-((5-(3-hlor-4-fluorfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(6-metoksinaftalen-2-il)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-((5-(6-hlor-1-metil-1H-benzo[d]imidazol-2-il)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-((5-(3-hlor-4-ciānfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)-N-metiletānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(4-fluor-3-metilfenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(4-etilsulfanil-fenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(3-fluor-4-metoksifenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(2,4-dimetoksifenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(4-metilsulfanilfenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-benzo-[1,3]-dioksol-5-il)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(2,3-dihidro-benzofuran-5-il)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(1H-indol-5-il)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(2,4,6-trimetilfenil)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-benzo[b]tiofen-2-il)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-(1-metil-1H-indol-5-il)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- N-(ciklopropil(5-naftalen-1-il)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;
- ([5-(3-hlor-4-ciānfenil)-piridin-3-il]-ciklopropil-metil)-etānsulfonil-amino-etiškābes metilestera;
- etānsulfonskābes {[5-(3-hlor-4-ciānfenil)-piridin-3-il]-ciklopropil-metil}-izobutil-amīda;
- etānsulfonskābes {[5-(3-hlor-4-ciānfenil)-piridin-3-il]-ciklopropil-metil}-(2-hidroksi-etil)-amīda;

N-((4-hlor-5-(3-hlor-4-ciānfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)-N-metilmetānsulfonamīda;

N-((5-(6-ciānnaftalen-2-il)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;

N-(ciklopropil(5-(hinolin-6-il)piridin-3-il)metil)etānsulfonamīda;

(R)-N-((5-(4-ciān-3-metilfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;

(S)-N-((5-(4-ciān-3-metilfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;

N-((5-(5-ciānbenzofuran-2-il)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;

N-((5-(benzo[d]tiazol-5-il)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;

N-((5-(benzofuran-5-il)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;

N-(1-(5-(4-ciān-3-metilfenil)piridin-3-il)-2,2,2-trifluoretil)etānsulfonamīda;

vai tā farmaceitiski pieņemams sāls.

8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, izvēlēts no:

(R)-N-((5-(3-hlor-4-ciānfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;

(S)-N-((5-(3-hlor-4-ciānfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;

N-((5-(3-hlor-4-ciānfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;

N-((5-(4-ciān-3-metoksifenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;

(S)-N-((5-(4-ciān-2-metoksifenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;

(R)-N-((5-(4-ciān-2-metoksifenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;

(R)-N-((5-(4-ciān-3-fluorfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;

(S)-N-((5-(4-ciān-3-fluorfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda;

N-((5-(4-ciān-2-fluorfenil)piridin-3-il)(ciklopropil)metil)etānsulfonamīda; vai

tā farmaceitiski pieņemams sāls.

9. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur terapeitiski efektīvu savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemama sāls daudzumu un vienu vai vairākus farmaceitiski pieņemamus nesējus.

10. Kombinācija, sevišķi farmaceitiska kombinācija, kas satur terapeitiski efektīvu savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemama sāls daudzumu un vienu vai vairākus terapeitiski aktīvus līdzekļus, izvēlēts no HMG-Co-A reduktāzes inhibitora, angiotensīna II receptora antagonista, angiotensīna konvertējošā enzīma (AKE) inhibitora, kalcija kanālu blokatora (CaKB), duālā angiotensīna konvertējošā enzīma/neitrālās endopeptidāzes (AKE/NEP) inhibitora, endotelīna antagonista, renīna inhibitora, diurētiska līdzekļa, ApoAI imitējoša līdzekļa, pretdiabēta līdzekļa, aptaukošanās mazinoša līdzekļa, aldosterona receptora blokatora, endotelīna receptora blokatora un CETP inhibitora.

11. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemams sāls izmantošanai par medikamentu.

12. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemams sāls izmantošanai aldosterona sintāzes pastarpināta traucējuma vai slimības ārstēšanā pacientam.

13. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemams sāls izmantošanai tāda traucējuma vai slimības ārstēšanā pacientam, kas raksturīgs ar anormālu aldosterona sintāzes aktivitāti.

14. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai vai farmaceitiski pieņemams tā sāls izmantošanai tāda traucējuma vai slimības ārstēšanā, kas izvēlēta no hipokaliēmijas, hipertensijas, Konna slimības, nieru mazspējas, hroniskas nieru mazspējas, restenozes, aterosklerozes, X sindroma, aptaukošanās, nefropātijas, pēc miokarda infarkta, koronārām sirds slimībām, paaugstinātas kolagēna veidošanās, fibrozes un rekonstruējošas sekojošas hipertensijas un endotēlija disfunkcijas, sirds un asinsvadu slimībām, nieru disfunkcijas, aknu slimībām, cerebrovaskulārām slimībām, asinsvadu slimībām, retinopātijas, neiropātijas, insulīnopātijas, tūskas, endotēlija disfunkcijas, baroreceptoru disfunkcijas, migrēnas, galvas sāpēm, tādas sirds mazspējas, kā kongestīvā sirds mazspēja, aritmija, diastoliskā disfunkcija, kreisā ventrikulārā diastoliskā disfunkcija,

diastoliskā sirds mazspēja, pavājināta diastoliskā pildīšanās, sistoliskā disfunkcija, išēmijas, hipertrofiskās kardiomiopātijas, pēkšņas kardiālas nāves, miokardiālas un vaskulāras fibrozes, bojātu artēriju elastības, miokardiāliem nekrotiskiem bojājumiem, asinsvadu bojājuma, miokarda infarkta, kreisās ventrikulārās hipertrofijas, samazinātas izviedes frakcijas, sirds bojājumiem, asinsvadu sienu hipertrofijas, endotēlija sabiezējuma un koronāro artēriju fibrinoīdas nekrozes.

- (51) **C08G 64/02**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2430065**
A01N 25/30⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 10715887.5 (22) 04.05.2010
(43) 21.03.2012
(45) 19.03.2014
(31) 09159881 (32) 11.05.2009 (33) EP
(86) PCT/EP2010/056001 04.05.2010
(87) WO2010/130599 18.11.2010
(73) BASF SE, 67056 Ludwigshafen, DE
(72) TÜRK, Holger, DE
HABERECHEIT, Monika, DE
ISHAQUE, Michael, DE
YAMADA, Hiroe, DE
SCHÖNFELDER, Daniel, BE
BRUCHMANN, Bernd, DE
- (74) Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV
- (54) **HIPERSAZAROTI POLIKARBONĀTI SLIKTI ŠĶĪSTOŠU AKTĪVU VIELU ŠĶĪDINĀŠANAI**
HYPERBRANCHED POLYCARBONATES FOR SOLUBILIZING POORLY SOLUBLE ACTIVE SUBSTANCES
- (57) 1. Kompozīcija, kas satur amfifilu savienojumu un aktīvu sastāvdaļu, kuru šķīdība ūdenī 20 °C temperatūrā nepārsniedz 10 g/l, kur amfifils savienojums satur hipersazarotu polikarbonātu, kas ir savienots ar vismaz vienu lineāru vai ķemmveida polimēru un/vai ar vismaz vienu funkcionālu C₁-C₂₄ fragmentu, kas satur skābes grupu, aminogrupu vai vismaz divas hidroksilgrupas, kur lineārais polimērs ir:
- homopolimērs vai statistisks kopolimērs, kas satur polāru etilēnnepiesātinātu monomēru,
 - blokpolimērs, kas satur polietilēnglikola bloku vai ir veidots uz polāra etilēnnepiesātināta monomēra bāzes, vai
 - polikondensāts vai polipievienošanas produkts, kas satur polietilēnglikolu, vai
 - polietilēnglikols,
- turklāt d) polietilēnglikols ir savienots ar polikarbonātu caur līnkeru, un
- līnkers ir poliizocianāts, kura funkcionalitāte attiecībā uz izocianāta grupām ir vismaz 1,5 un kuru izvēlas no alifātiskiem, cikloalifātiskiem un aromātiskiem di- un poliizocianātiem, un arī izociānurātiem, alifātisku, cikloalifātisku un aromātisku diizocianātu alofanātiem, uretdioniem un biuretiem,
- funkcionālo C₁-C₂₄ fragmentu iegūst hipersazarota polikarbonāta reakcijā ar ciklisku karbonskābes anhidrīdu; vai funkcionālais C₁-C₂₄ fragments ir hidroksikarbonskābes, aminokarbonskābes, hidroksisulfoskābes, hidroksisulfāti, aminosulfoskābes, aminosulfāti, hidroksiamīni, poliamīni vai polioli, kuri ir kovalenti saistīti ar polikarbonātu ar linkera starpniecību, un
- polikarbonāts satur spirtu (B1), kurš ir trifunkcionāls vai lielākas funkcionalitātes polieterols uz spirta bāzes, kuriem ir vismaz trīs OH grupas, un (C₃-C₂₄)alkilēnoksīds.
2. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur polietilēnglikols ir polietilēnglikols vai polietilēnglikola monoalkilēteris ar molāro masu Mn vismaz 200 g/mol.
3. Kompozīcija saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur polārs etilēnnepiesātināts monomērs ir vinilpirolidons, (met)akrilskābe, sulfogrupu saturošs monomērs, aminofunkcionāls monomērs vai polietilēnglikola atvasinājuma (met)akrilesteris.
4. Kompozīcijas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur ķemmveida polimērs satur polietilēnglikola mono(met)akrīlātu vai alilspirta alkoksilātu polimerizētā formā.
5. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kur funkcionālais C₁-C₂₄ fragments ir kovalenti savienots ar linkera starpniecību un tiek izvēlēts no hidroksikarbonskābēm, aminokarbonskābēm, hidroksisulfoskābēm, hidroksisulfātiem,

aminosulfoskābēm vai aminosulfātiem, hidroksiamīniem (tādiem kā dietanolamīns), poliamīniem (piem., dietilēntetraamīns), vai polioliem (piem., glicerīns, trimetilpropāns, pentaeritritols).

6. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kur amfifils savienojums satur hipersazarotu polikarbonātu, kas ir savienots ar vismaz vienu lineāru vai ķemmveida polimēru.

7. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kur aktīvā sastāvdaļa satur aktīvu agroķīmisku vai farmaceitisku sastāvdaļu.

8. Amfifils savienojums, kas satur hipersazarotu polikarbonātu, kurš ir savienots ar vismaz vienu lineāru vai ķemmveida polimēru, kur lineārais polimērs ir:

a) homopolimērs vai statistisks polimērs, kas satur polāru etilēnnespiesātinātu monomēru,

b) blokpolimērs, kas satur polietilēnglikola bloku vai ir veidots uz polāra etilēnnespiesātināta monomēra bāzes, vai

c) polikondensāts vai polipievienošanas produkts, kas satur polietilēnglikolu, vai

d) polietilēnglikols, turklāt d) polietilēnglikols tiek savienots ar polikarbonātu caur linkeru, un linkers ir poliizocianāts, kura funkcionalitāte attiecībā uz izocianāta grupām ir vismaz 1,5 un kuru izvēlas no alifātiem, cikloalifātiem un di- un poliizocianātiem, kā arī izociānūrātiem un alifātiem, cikloalifātiem un aromātiem diizocianātu biuretiem, un polikarbonāts satur spirtu (B1), kurš ir trifunkcionāls vai lielākas funkcionalitātes polieterols uz spirta bāzes, kuriem ir vismaz trīs OH grupas, un (C₃-C₂₄)alkilēnoksīds.

9. Amfifils savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, kur polikarbonātu iegūst

a) iegūstot kondensācijas produktu (K), organisku karbonātu (A) vai fosgēna atvasinājumu, pakļaujot reakcijai ar spirtu (B), kuram ir vismaz trīs hidroksilgrupas, un

b) starpmolekulāri pārvēršot K hipersazarotā polikarbonātā, kurā OH grupu un karbonātgrupu vai fosgēngrupu attiecība izvēlēta tā, lai K vidēji ir i) viena karbonātgrupa vai karbamoilhlorīda grupa un vairāk nekā viena OH grupa, vai ii) viena OH grupa un vairāk nekā viena karbonātgrupa vai karbamoilgrupa.

10. Amfifils savienojums saskaņā ar 8. vai 9. pretenziju, kur ķemmveida polimērs satur polietilēnglikola (met)akrilātu polimerizētā formā.

11. Amfifils savienojums saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 10. pretenzijai, kur polietilēnglikols ir polietilēnglikols vai polietilēnglikola monoalkilēteris ar molāro masu Mn vismaz 200 g/mol.

12. Process amfifila savienojuma saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 11. pretenzijai iegūšanai, reaģējot polikarbonātam, lineāram vai ķemmveida polimēram un linkeram.

13. Amfifila savienojuma saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 11. pretenzijai izmantošana kompozīcijā, kas satur aktīvu sastāvdaļu, kuras šķīdība ūdenī 20 °C temperatūrā nepārsniedz 10 g/l, aktīvās sastāvdaļas šķīdināšanai ūdens vidē.

14. Amfifila savienojuma saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 11. pretenzijai izmantošana, apkarojot fitopatogēnas sēnes un/vai nevēlamu augu augšanu, un/vai nevēlamu kukaiņu vai ērcu invāziju, un/vai regulējot augu augšanu, kur amfifils savienojums iedarbojas uz attiecīgajiem augiem, kaitēkļiem, to dzīvotni, vai augiem, kuri jāaizsargā pret attiecīgajiem kaitēkļiem, vai uz augsni un/vai nevēlamiem augiem, un/vai kultūraugiem un/vai to dzīvotni.

15. Materiāls augu pavairošanai, kas satur amfifilu savienojumu saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 11. pretenzijai.

(43) 25.04.2012

(45) 26.03.2014

(31) 218472 P (32) 19.06.2009 (33) US

(86) PCT/US2010/038979 17.06.2010

(87) WO2010/148190 23.12.2010

(73) Alcon Research, Ltd., 6201 South Freeway, Mail Code TB4-8, Fort Worth, TX 76134-2099, US

(72) KABRA, Bhagwati P., US

(74) Teipel, Stephan, et al, Lederer & Keller Patentanwälte, Unsöldstrasse 2, 80538 München, DE
Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV

(54) **FARMACEITISKAS KOMPOZĪCIJAS UZ ŪDENS BĀZES, KAS SATUR BORĀTA-POLIOLU KOMPLEKSUS AQUEOUS PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING BORATE-POLYOL COMPLEXES**

(57) 1. Vairākkārtīgi lietojama oftalmoloģiska kompozīcija, kas ietver

pirmo polioli, kas izvēlēts no mannīta, sorbīta vai to kombinācijas, otro polioli, kas izvēlēts no propilēnglikola, glicerīna vai to kombinācijas,

efektīvu borāta daudzumu, kas sastāda mazāk nekā 0,5 % (masas/tilpuma vienībās) no kompozīcijas kopējā sastāva, benzalkonija hlorīdu (BAC) kā pretmikrobu konservantu, un BAC koncentrācija kompozīcijas sastāvā ir lielāka par 0,0007 % (masa/tilpums) bet mazāka par 0,0035 % (masas/tilpuma vienībās), un ūdeni.

2. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīga ar to, ka kompozīcija atbilst Eiropas Farmakopejas A, B vai abiem standartiem.

3. Kompozīcija saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, raksturīga ar to, ka pirmā poliola koncentrācija ir vismaz 0,01 %, bet ne vairāk par 0,5 % (masas/tilpuma vienībās).

4. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, raksturīga ar to, ka pirmā poliola koncentrācija ir mazāka par 0,35 % (masas/tilpuma vienībās).

5. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, raksturīga ar to, ka BAC koncentrācija ir mazāka par 0,0025 % (masas/tilpuma vienībās) no kompozīcijas.

6. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, raksturīga ar to, ka BAC koncentrācija ir mazāka par 0,0015 % (masas/tilpuma vienībās) no kompozīcijas.

7. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, raksturīga ar to, ka otrais poliols sastāda vismaz 0,1 %, bet mazāk par 5 % (masas/tilpuma vienībās) no kompozīcijas.

8. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, raksturīga ar to, ka pirmais poliols ir mannīts.

9. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, raksturīga ar to, ka kompozīcija praktiski nesatur citus konservantus, izņemot benzalkonija hlorīdu.

10. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, raksturīga ar to, ka pretestība, ko kompozīcija piešķir asaru pH normalizācijai pēc ievadīšanas acī, ir mazāka par 25 μl 1 M NaOH/ml kompozīcijas.

11. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, raksturīga ar to, ka pretestība, ko kompozīcija piešķir asaru pH normalizācijai pēc ievadīšanas acī, ir mazāka par 15 μl 1 M NaOH/ml kompozīcijas.

12. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, raksturīga ar to, ka kompozīcijas pH ir no 6,2 līdz 7,7.

13. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas satur papildu terapeitisku līdzekli.

14. Kompozīcija saskaņā ar 13. pretenziju, raksturīga ar to, ka terapeitiskais līdzeklis ir brinzolamīds, brimonidīns vai to kombinācija.

15. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas satur papildu anjonu dabas polimēru.

16. Kompozīcija saskaņā ar 15. pretenziju, raksturīga ar to, ka anjonu dabas polimērs ir izvēlēts no ksantānsveķiem vai karboksivinilpolimēra.

17. Kompozīcija saskaņā ar 15. pretenziju, raksturīga ar to, ka anjonu dabas polimērs ir karboksivinilpolimērs.

18. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, raksturīga ar to, ka kompozīcija ir suspensija ar terapeitisku līdzekli, suspendētu šķīdumā.

(51) **A61K 31/498**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2442790**

A61K 9/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 31/335⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 31/52⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 31/542⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 47/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 47/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 47/18⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 47/32⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 27/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 27/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(21) 10727317.9 (22) 17.06.2010

19. Kompozīcija saskaņā ar 18. pretenziju, raksturīga ar to, ka suspensijas viskozitāte ir lielāka par 0,02 Pa·s (20 cP) bet mazāka par 0,5 Pa·s (500 cP), un raksturīga ar to, ka suspensijas viskozitāte tiek mērīta pie liela bīdes ātruma 120 s⁻¹ istabas temperatūrā.

20. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 19. pretenzijai, raksturīga ar to, ka kompozīcija ir brīva no pretinfekcijas vai anti-biotiskiem terapeitiskiem līdzekļiem.

21. Kompozīcija saskaņā ar 18. vai 19. pretenziju, raksturīga ar to, ka suspensija tiek redispersģēta ar enerģisku kratīšanu ne vairāk kā 15 sekundes.

22. Kompozīcija saskaņā ar 13. pretenziju, raksturīga ar to, ka terapeitiskais līdzeklis ir brinzolamīda un brimonidīna kombinācija.

23. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām pielietošanai zīdītāja acu ārstēšanas metodē, kura ietver: minētās kompozīcijas ievadīšanu zīdītājam acīs atkārtoti ilgā laika periodā.

24. Kompozīcija saskaņā ar 23. pretenziju, raksturīga ar to, ka kompozīcija tiek ievadīta vismaz vienreiz diennaktī vismaz vienu mēnesi.

25. Kompozīcija saskaņā ar 23. vai 24. pretenziju pielietošanai minētajā metodē, ja pirms ievadīšanas zīdītāja acī papildus tiek diagnosticēts acu traucējums, kas ir piemēroti ārstēts ar terapeitiska līdzekļa pastāvīgu ievadīšanu.

26. Kompozīcija saskaņā ar 25. pretenziju, raksturīga ar to, ka acs traucējums ir paaugstināts acs iekšējais spiediens.

- (51) **A61P 25/08**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2448637**
A61K 31/352⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 10734541.5 (22) 29.06.2010
(43) 09.05.2012
(45) 12.03.2014
(31) 0911580 (32) 03.07.2009 (33) GB
(86) PCT/GB2010/051066 29.06.2010
(87) WO2011/001169 06.01.2011
(73) GW Pharma Limited, Porton Down Science Park, Salisbury, Wiltshire SP4 0JQ, GB
Otsuka Pharmaceutical Co. Limited, 9, Kanda-Tsukasamachi 2-chome Chiyoda-ku, Tokyo 101-8535, JP
- (72) WHALLEY, Ben, GB
STEPHENS, Gary, GB
WILLIAMS, Claire, GB
GUY, Geoffrey, GB
WRIGHT, Stephen, GB
KIKUCHI, Tetsuro, JP
- (74) Wells, Andrew, et al, Harrison Goddard Foote LLP, 4th Floor, Merchant Exchange, 17-19 Whitworth Street West, Manchester M1 5WG, GB
Svetlana MAKEJEVA, Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, Stabu iela 44-21, Rīga, LV-1011, LV

(54) **VIENA FITOKANABINOĪDA VAI VAIRĀKU FITOKANABINOĪDU KOMBINĀCIJU IZMANTOŠANA EPILEPSIJAS ĀRSTĒŠANĀ**

USE OF ONE OR A COMBINATION OF PHYTO-CANABINOIDS IN THE TREATMENT OF EPILEPSY

(57) 1. Kanabidiols (CBD) izmantošanai parciālo lēkmju ārstēšanā, kurā CBD ir klāt daudzumā, kas nodrošina vismaz 400 mg dienas devu.

2. CBD izmantošanai parciālo lēkmju ārstēšanā saskaņā ar 1. pretenziju, kurā CBD ir klāt daudzumā, kas nodrošina dienas devu no 400 līdz 800 mg.

3. CBD izmantošanai parciālo lēkmju ārstēšanā saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt parciālās lēkmes ir attīstījušās par smagas formas lēkmēm.

4. CBD izmantošanai parciālo lēkmju ārstēšanā saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, turklāt CBD tiek izmantots kombinācijā ar tetrahidrokanabivāriņu (THCV).

5. CBD izmantošanai parciālo lēkmju ārstēšanā saskaņā ar 4. pretenziju, kurā THC ir klāt daudzumā, kas nodrošina vismaz 1,5 mg dienas devu.

6. CBD izmantošanai parciālo lēkmju ārstēšanā saskaņā ar 5. pretenziju, kurā THC ir klāt daudzumā, kas nodrošina vismaz 15 mg dienas devu.

7. CBD izmantošanai parciālo lēkmju ārstēšanā saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, vai kombinācijā ar THC saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 6. pretenzijai, turklāt CBD viens pats vai kombinācijā ar THC ir klāt kā augu ekstrakts.

8. CBD izmantošanai parciālo lēkmju ārstēšanā saskaņā ar 7. pretenziju, kurā augu ekstrakts procentuāli satur mazāk par 5 masas % tetrahidrokanabīnola (THC) no jebkādiem augu ekstraktā esošiem kanabinoīdiem.

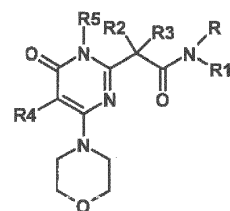
9. CBD izmantošanai parciālo lēkmju ārstēšanā saskaņā ar 8. pretenziju, kurā augu ekstrakts procentuāli satur mazāk par 1 masas % tetrahidrokanabīnola (THC) no jebkādiem augu ekstraktā esošiem kanabinoīdiem.

10. CBD izmantošanai parciālo lēkmju ārstēšanā saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, viens pats vai kombinācijā ar THC saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 6. pretenzijai, turklāt CBD viens pats vai kombinācijā ar THC ir klāt kā tīrs vai izolēts kanabinoīds.

11. Kompozīcija izmantošanai parciālo lēkmju ārstēšanā, kas satur kanabidiolu (CBD).

12. Kanabidiola (CBD) izmantošana medikamenta izgatavošanai parciālo lēkmju ārstēšanai.

- (51) **C07D 239/36**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2448927**
C07D 403/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 409/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 413/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/513⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 35/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/5377⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 239/47⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 403/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 403/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 413/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 10742014.3 (22) 01.07.2010
(43) 09.05.2012
(45) 12.03.2014
(31) 0903239 (32) 02.07.2009 (33) FR
241100 P 10.09.2009 US
0957070 09.10.2009 FR
- (86) PCT/FR2010/051375 01.07.2010
(87) WO2011/001114 06.01.2011
(73) SANOFI, 54 rue La Boétie, 75008 Paris, FR
(72) CARRY, Jean-Christophe, FR
CERTAL, Victor, FR
HALLEY, Frank, FR
KARLSSON, Karl Andreas, FR
SCHIO, Laurent, FR
THOMPSON, Fabienne, FR
- (74) Nony, et al, 3, rue de Penthièvre, 75008 Paris, FR
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV
- (54) **JAUNI (6-OKSO-1,6-DIHDRO-PIRIMIDIN-2-IL)-AMĪDA ATVASINĀJUMI, TO IEGŪŠANA UN TO FARMACEITISKA IZMANTOŠANA PAR AKT FOSFORILĒŠANAS INHIBITORIEM**
NOVEL (6-OXO-1,6-DIHYDRO-PYRIMIDIN-2-YL)-AMIDE DERIVATIVES, PREPARATION THEREOF, AND PHARMACEUTICAL USE THEREOF AS AKT PHOSPHORYLATION INHIBITORS
- (57) 1. Produkti ar formulu (I):



kurā:

R1 attēlo arilgrupu vai heteroarilgrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri var būt identiski vai atšķirīgi, izvēlēti no halogēna atomiem un hidroksilgrupas, CN, nitrogrupas,

-COOH, -COOalk, -CONRxRy, -NRxCORy, -CORy, -NRxCO₂Rz, alkoksigrupas, fenoksigrupas, alkiltiogrupas, alkilgrupas, alkenilgrupas, alkinilgrupas, cikloalkilgrupas, O-cikloalkilgrupas, heterocikloalkilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas;

pēdējās no minētām, alkoksigrupa, fenoksigrupa, alkiltiogrupa, alkilgrupa, alkenilgrupa, alkinilgrupa, heterocikloalkilgrupa, arilgrupa un heteroarilgrupa, kas pašas ir neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri var būt identiski vai atšķirīgi, izvēlēti no halogēna atomiem un hidroksilgrupas, alkoksigrupas, NRvRw, heterocikloalkilgrupas vai heteroarilgrupas;

arilgrupa un heteroarilgrupa, kas papildus ir neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām alkilgrupām un alkoksigrupām, pašas ir neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem; heterocikloalkilgrupa un heteroarilgrupa papildus var saturēt oksogrupu;

R attēlo ūdeņraža atomu vai arī ar R1 veido piesātinātu vai daļēji vai pilnīgi nepiesātinātu 5 vai 6 locekļu gredzenu, kas kondensēts ar arilgrupas vai heteroarilgrupas atlikumu un kas neobligāti satur vienu vai vairākus heteroatomus, izvēlēti no skābekļa atoma, sēra atoma, slāpekļa atoma, NH un Nalk, pie kam šī bicikliskā grupa neobligāti ir aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri var būt identiski vai atšķirīgi, izvēlēti no halogēna atomiem un CO-NH₂, hidroksilgrupas, alkilgrupas un alkoksigrupas; pēdējā no minētām, alkilgrupa, pati neobligāti ir aizvietota ar hidroksilgrupu, alkoksigrupu, NH₂, NHalk vai N(alk)₂;

R2 un R3, kuri var būt identiski vai atšķirīgi, neatkarīgi attēlo ūdeņraža atomu, halogēna atomu vai alkilgrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem;

R4 attēlo ūdeņraža atomu;

R5 attēlo ūdeņraža atomu vai alkilgrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem;

NRxRy ir tāds, ka Rx attēlo ūdeņraža atomu vai alkilgrupu un Ry attēlo ūdeņraža atomu vai cikloalkilgrupu, vai alkilgrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri var būt identiski vai atšķirīgi, izvēlēti no hidroksilgrupas, alkoksigrupas, NRvRw un heterocikloalkilgrupas; vai Rx un Ry veido ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir pievienoti, ciklisku grupu, kas satur no 3 līdz 10 locekļu gredzenu un neobligāti vienu vai vairākus citus heteroatomus, izvēlēti no skābekļa atoma, sēra atoma, NH un N-alkil, pie kam šī grupa ir neobligāti aizvietota;

NRvRw ir tāds, ka Rv attēlo ūdeņraža atomu vai alkilgrupu un Rw attēlo ūdeņraža atomu vai cikloalkilgrupu, CO₂alk vai alkilgrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākām grupām, kuras var būt identiskas vai atšķirīgas, izvēlētas no hidroksilgrupas, alkoksigrupas un heterocikloalkilgrupas; vai Rv un Rw veido ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir pievienoti, ciklisku grupu, kas satur no 3 līdz 10 locekļu gredzenu un neobligāti vienu vai vairākus citus heteroatomus, izvēlēti no skābekļa atoma, sēra atoma, NH un N-alkil, pie kam šī grupa ir neobligāti aizvietota; cikliskās grupas, ko Rx un Ry vai Rv un Rw, var attiecīgi veidot ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir pievienoti, ir neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām grupām, kuras var būt identiskas vai atšķirīgas, izvēlētas no halogēna atomiem un alkilgrupas, hidroksilgrupas, oksogrupas, alkoksigrupas, NH₂, NHalk un N(alk)₂;

Rz attēlo Ry vērtības, izņemot ūdeņraža atomu; Rx, Ry un Rz grupās -NRxCORy, -CORy un CO₂Rz ir izvēlēti no nozīmēm, kas norādītas iepriekš Rx, Ry un Rz;

visas iepriekš minētās alkilgrupas (alk), alkoksigrupas un alkiltiogrupas ir lineāras vai sazarotas un satur 1 līdz 6 oglekļa atomus, pie kam minētie produkti ar formulu (I) ir visās iespējamās racēmiskās, enantiomērās un diastereoizomēri stereoizomērās formās, un arī minēto produktu ar formulu (I) neorganisku un organisku skābju vai neorganisku un organisku bāzu pievienošanās sāļi.

2. Produkti ar formulu (I), kā definēts 1. pretenzijā, kurā:

R1 attēlo fenilgrupu, piridīna grupu, tienilgrupu, benzoksazililgrupu, benzfurililgrupu, indazolilgrupu, indolilgrupu, benzotienililgrupu, benzimidazolilgrupu, benzoksazililgrupu vai tetrahidrohinoililgrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri var būt identiski vai atšķirīgi, izvēlēti no halogēna atomiem un CN, nitrogrupas, -COOH, -COOalk, -NRxRy, alkoksigrupas, alkilgrupas, alkinilgrupas un cikloalkilgrupas;

pēdējās no minētām, alkoksigrupa, alkilgrupa un alkinilgrupa pašas ir neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri var būt identiski vai atšķirīgi, izvēlēti no halogēna atomiem un

hidroksilgrupas, alkoksigrupas, NRvRw, piperidilgrupas, pirolidinilgrupas vai heteroarilgrupas;

fenilgrupa un heteroarilgrupa ir papildus neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām alkilgrupām un alkoksigrupām;

R attēlo ūdeņraža atomu vai arī ar R1 veido benzoksazililgrupas, dihidroindolilgrupas, tetrahidroizohinoililgrupas, tetrahidrohinoililgrupas vai dihidropirolpiridilgrupas gredzenu, pie kam šie gredzeni neobligāti ir aizvietoti ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kuri var būt identiski vai atšķirīgi, izvēlēti no halogēna atomiem un CO-NH₂, hidroksilgrupas, alkilgrupas un alkoksigrupas;

pēdējā no minētām, alkilgrupa pati neobligāti ir aizvietota ar hidroksilgrupu, alkoksigrupu, NH₂, NHalk vai N(alk)₂;

R2 un R3, kuri var būt identiski vai atšķirīgi, neatkarīgi attēlo ūdeņraža atomu, fluora atomu vai alkilgrupu;

R4 attēlo ūdeņraža atomu;

R5 attēlo ūdeņraža atomu vai alkilgrupu;

NRxRy ir tāds, ka Rx attēlo ūdeņraža atomu vai alkilgrupu un Ry attēlo ūdeņraža atomu vai alkilgrupu; vai Rx un Ry ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir pievienoti, veido ciklisku grupu, kas satur 3 līdz 10 locekļu gredzenu un neobligāti vienu vai vairākus citus heteroatomus, izvēlēti no skābekļa atoma, sēra atoma, NH un N-alkil, šī cikliskā grupa ir neobligāti aizvietota;

NRvRw ir tāds, ka Rv attēlo ūdeņraža atomu vai alkilgrupu un Rw attēlo ūdeņraža atomu vai alkilgrupu;

visas iepriekš minētās alkilgrupas (alk) un alkoksigrupas ir lineāras vai sazarotas un satur 1 līdz 6 oglekļa atomus,

minētie produkti ar formulu (I) ir visās iespējamās racēmiskās, enantiomērās un diastereoizomēri stereoizomērās formās un arī minēto produktu ar formulu (I) neorganisku un organisku skābju vai neorganisku un organisku bāzu pievienošanās sāļi.

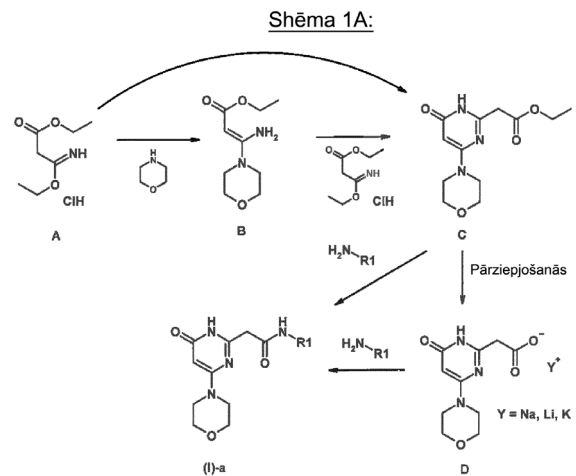
3. Produkti ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. un 2. pretenzijas, kas atbilst šādām formulām:

- 2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-fenilacetamīds,
- N-(4-fluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-hlorofenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-[3-(dimetilamino)fenil]-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(2,4-difluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3,4-difluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-(tiofen-3-il)acetamīds,
- N-(4-fluor-3-metoksifenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(2-fluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(2-metilfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(2-metoksifenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(2,3-difluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3,5-difluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-fluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(4-hlorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-metoksifenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-[3-(trifluorometil)fenil]acetamīds,
- N-(3-bromfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-[3-(2-metilpropan-2-il)fenil]-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- metil 3-({[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetil}amino)benzoāts,
- 3-({[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetil}amino)benzoksābe,

- 2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-[3-(propan-2-il)fenil]acetamīds,
- N-(3-metilfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-ciano-4-fluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-hidroksifenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(1H-indazol-6-il)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-cianofenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(5-fluorpiridin-2-il)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(4-fluor-3-metilfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-hlor-4-fluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-(piridin-3-il)acetamīds,
- N-(4-fluor-2-metilfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-hidroksifenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-brom-4-fluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-(3,4,5-trifluorfenil)acetamīds,
- N-[4-fluor-3-(hidroksimetil)fenil]-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-ciklopropilfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(2-hidroksifenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-brom-4-fluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-difluorometoksi)fenil]-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(4-fluor-3-metoksifenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]propānamīds,
- N-(2,3-dimetilfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(2-fluor-3-metilfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(1,3-benzoksazol-4-il)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-[3-(trifluorometoksi)fenil]acetamīds,
- 2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-[3-(propan-2-iloksi)fenil]acetamīds,
- N-(4-fluor-2-metoksifenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-5-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-metilpropan-2-il[2-[3-{{[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetil}amino]fenil}etil]karbamāts,
- N-[4-fluor-3-(trifluorometil)fenil]-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds
- N-(3-etinilfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-[3-(ciklopentiloksi)fenil]-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(4-fluor-2-hidroksifenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[2-(2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- N-(3-ciklopropil-4-fluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-(2,3,4-trifluorfenil)acetamīds,
- N-[4-fluor-3-(trifluorometoksi)fenil]-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-[3-(2-hidroksietoksi)fenil]-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-jodfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- metil-2-fluor-5-{{[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetil}amino}benzoāts,
- N-(3-etoksifenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(2,4-difluor-3-metoksifenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-(2,4,5-trifluorfenil)acetamīds,
- N-(3,5-dihlor-4-fluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[2-(2,3-dihidro-4H-1,4-benzoksazin-4-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3)-ons,
- N-(4-fluor-3-nitrofenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-fluor-5-{{[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetil}amino}benzoksābe,
- N-(5-fluor-2-hidroksifenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(2-brom-4-fluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(4-fluorfenil)-2-[1-metil-4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-hlor-4-fluorfenil)-2-[1-metil-4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-bromfenil)-2-[1-metil-4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[1-etil-4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-(4-fluorfenil)acetamīds,
- N-(1H-indol-4-il)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(4-fluorfenil)-3-metil-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]butānamīds,
- N-[4-fluor-3-(metoksimetil)fenil]-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(4-fluor-3-jodfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-[3-(1,1,2,2-tetrafluoretoksi)fenil]acetamīds,
- N-[3-(difluorometil)-4-fluorfenil]-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2,2-difluor-N-(4-fluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3,4-difluorfenil)-2-[1-metil-4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[2-(2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-3-metil-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- N-(3-brom-4-fluorfenil)-2-[1-metil-4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-[4-fluor-3-(hidroksimetil)fenil]-2-[1-metil-4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-ciklopropilfenil)-2-[1-metil-4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(4-fluor-3-metoksifenil)-2-[1-metil-4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[1-metil-4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-fenilacetamīds,
- N-(3-ciklopropil-4-fluorfenil)-2-[1-metil-4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- N-(3-fluor-2-hidroksifenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[2-(4-fluor-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-(4-hlor-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- N-(3-etinil-4-fluorfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[2-(4-hidroksi-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-(4,6-difluor-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- N-(4-fluor-3-jodfenil)-2-(1-metil-4-morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[2-(4,5-difluor-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-(6-fluor-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,

- 2-[2-(2-metil-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- N-[3-(difluormetil)-4-fluorfenil]-2-[1-metil-4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[1-metil-4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-(3,4,5-trifluorfenil)acetamīds,
- N-(1-metil-1H-indol-4-il)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[2-(4-metil-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-(3-metil-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-(4-fluor-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-3-metil-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-(5-fluor-2,3-dihidroindol-1-il)-2-oksoetil]-6-morfolin-4-il-3H-pirimidin-4-ons,
- 2-[2-(4-hlor-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-3-metil-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- N-(1-benziofen-4-il)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[2-(2-(hidroksimetil)-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-[2-(2-piperidin-1-il)etoksi]fenil]acetamīds,
- N-[2-(2-metoksietoksi)fenil]-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[2-(4-hidroksi-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-3-metil-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-(4-metoksi-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-3-metil-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-(3,4-dihidroizohinolin-2(1H)-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-[2-(2-pirolidin-1-il)etoksi]fenil]acetamīds,
- 2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-[2-(piridin-3-ilmetoksi)fenil]acetamīds,
- 3-metil-2-[2-(4-metil-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-(2-[3-[(dimetilamino)metil]-2,3-dihidro-1H-indol-1-il]-2-oksoetil)-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-(4-brom-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-3-metil-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-[(2S)-2-metil-2,3-dihidro-1H-indol-1-il]-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-[(2R)-2-metil-2,3-dihidro-1H-indol-1-il]-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 3-metil-2-[2-(3-metil-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-(2-(metoksimetil)-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-(4-etoksi-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 1-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetil]-2,3-dihidro-1H-indol-2-karboksamīds,
- 3-metil-2-[2-(2-metil-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-(6-fluor-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-3-metil-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-[(3S)-3-metil-2,3-dihidro-1H-indol-1-il]-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-[(3R)-3-metil-2,3-dihidro-1H-indol-1-il]-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-(5,6-difluor-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-3-metil-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-(4,5-difluor-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-3-metil-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-(1,3-dihidro-2H-izoindol-2-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- N-(1-benziofen-4-il)-2-[1-metil-4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
- 2-[2-(5-hlor-3,4-dihidrohinolin-1(2H)-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
- 2-[2-[4-(hidroksimetil)-2,3-dihidro-1H-indol-1-il]-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,

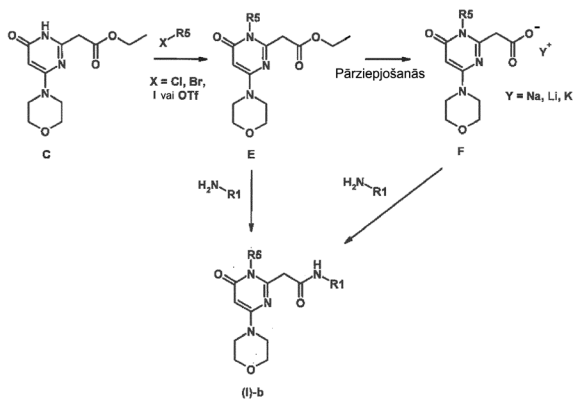
- N-[4-fluor-2-(piperidin-4-ilmetoksi)fenil]-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
 - 2-[2-(5-hlor-2,3-dihidroindol-1-il)-2-oksoetil]-6-morfolin-4-il-3H-pirimidin-4-ons,
 - 2-[2-(4-brom-2,3-dihidroindol-1-il)-2-oksoetil]-6-morfolin-4-il-3H-pirimidin-4-ons,
 - 2-(2-[(3S)-3-[(dimetilamino)metil]-2,3-dihidro-1H-indol-1-il]-2-oksoetil)-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
 - 2-(2-[(3R)-3-[(dimetilamino)metil]-2,3-dihidro-1H-indol-1-il]-2-oksoetil)-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
 - N-[4-fluor-2-(2-metoksietoksi)fenil]-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
 - N-(1H-benzimidazol-4-il)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
 - metil-2-hidroksi-3-[[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetil]amino]benzoāts,
 - 2-[2-(4-metoksi-2,3-dihidroindol-1-il)-2-oksoetil]-6-morfolin-4-il-3H-pirimidin-4-ons,
 - N-(3-brom-2-hidroksifenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
 - N-(3,4-dihidro-2H-1,4-benzoksazin-8-il)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
 - metil-5-fluor-2-[[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetil]amino]benzoāts,
 - 2-(2-[3-[(diethylamino)metil]-2,3-dihidro-1H-indol-1-il]-2-oksoetil)-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
 - 2-[2-(2,3-dihidro-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
 - 2-[2-(5,6-difluor-2,3-dihidroindol-1-il)-2-oksoetil]-6-morfolin-4-il-3H-pirimidin-4-ons,
 - 2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]-N-(1,2,3,4-tetrahydrohinolin-8-il)acetamīds,
 - 2-[2-(8-hlor-2,3-dihidro-4H-1,4-benzoksazin-4-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons,
 - N-(2-hidroksi-3-metilfenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
 - N-(2-hidroksi-3-nitrofenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
 - N-(3-ciano-2-hidroksifenil)-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
 - N-[2-hidroksi-3-(trifluormetil)fenil]-2-[4-(morfolin-4-il)-6-okso-1,6-dihidropirimidin-2-il]acetamīds,
 - 2-[2-(3,3-dimetil-2,3-dihidro-1H-indol-1-il)-2-oksoetil]-6-(morfolin-4-il)pirimidin-4(3H)-ons
- un arī minēto produktu ar formulu (I) neorganisku un organisku skābju vai neorganisku un organisku bāzu pievienošanās sējā.
4. Paņēmiens produktu ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 3. pretenzijai, iegūšanai, atbilstoši shēmai 1A, kā definēts zemāk:



kurā aizvietotajam R1 ir nozīmes, kas norādītas jebkurā no 1. un 2. pretenzijas.

5. Paņēmiens produktu ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 3. pretenzijai, iegūšanai atbilstoši shēmai 1B, kā definēts zemāk:

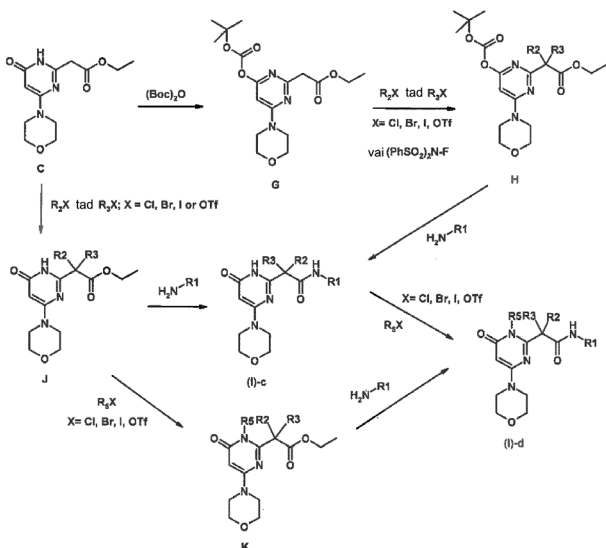
Shēma 1B:



kurā aizvietotājiem R1 un R5 ir nozīmes, kas norādītas jebkurā no 1. un 2. pretenzijas.

6. Paņēmiens produktu ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 3. pretenzijai, iegūšanai atbilstoši shēmai 1C, kā definēts zemāk:

Shēma 1C:



kurā aizvietotājiem R1, R2, R3 un R5 ir nozīmes, kas norādītas jebkurā no 1. un 2. pretenzijas.

7. Produkti ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 3. pretenzijai, un arī farmaceitiski pieņemami minēto produktu ar formulu (I) neorganisku un organisku skābju vai neorganisku un organisku bāzu pievienošanās sāļi to izmantošanai par medikamentiem.

8. Produkti ar formulu (I), kā definēts 3. pretenzijā, un arī farmaceitiski pieņemami minēto produktu ar formulu (I) neorganisku un organisku skābju vai neorganisku un organisku bāzu pievienošanās sāļi to izmantošanai par medikamentiem.

9. Farmaceutiskas kompozīcijas, kas kā aktīvo sastāvdaļu satur vismaz vienu no produktiem ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 3. pretenzijai, vai šī produkta farmaceitiski pieņemamu sāli un farmaceitiski pieņemamu nesēju.

10. Produkti ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 3. pretenzijai, to izmantošanai vēžu ārstēšanā.

11. Produkti ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 3. pretenzijai, to izmantošanai blīvu vai šķidru audzēju ārstēšanā.

12. Produkti ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 3. pretenzijai, to izmantošanai vēžu, kas ir rezistenti pret citotoksiskiem līdzekļiem, ārstēšanā.

13. Produkti ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 3. pretenzijai, to izmantošanai sākotnējo audzēju un/vai metastāžu ārstēšanā, sevišķi, kuņģa, aknu, nieru, olnīcu, resnās zarnas, prostatas, endometrija un plaušu (NSŠPV un SŠPV) vēžu, glioblasto-

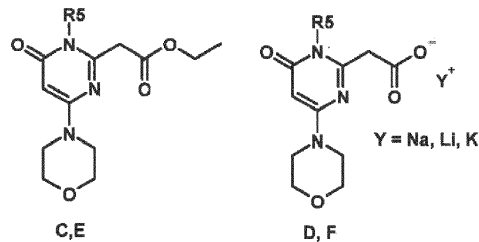
mas, vairogdziedzera, urīnpūšļa, krūts dziedzera vēžu, melanomas, limfoido vai mioīdo hemapoētisko audzēju, sarkomas, smadzeņu, balsenes un limfātiskās sistēmas vēžu, kaulu un aizkuņģa dziedzera vēžu un hamartomu ārstēšanā.

14. Produkti ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 3. pretenzijai, to izmantošanai vēža ķīmijterapijā.

15. Produkti ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 3. pretenzijai, to izmantošanai vēža ķīmijterapijā, atsevišķi vai kombinācijā.

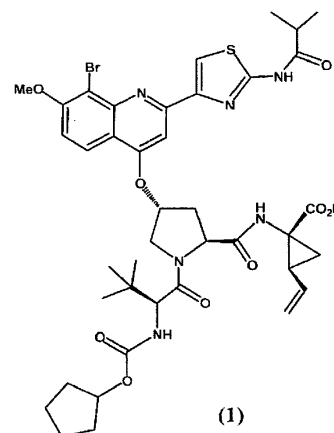
16. Produkti ar formulu (I), kā definēts jebkurā no 1. līdz 3. pretenzijai, kā AKT (PKB) fosforilēšanas inhibitori.

17. Sintēzes starpprodukti ar formulām C, D, E un F, kā definēts 4. pretenzijā un attēlots zemāk:



kurā R5 ir definīcija, kas norādīta jebkurā no 1. un 2. pretenzijas.

- (51) **A61K 9/107**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2451438**
- A61K 9/48**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- A61K 31/427**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- A61K 47/10**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- A61K 47/12**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- A61K 47/14**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- A61K 47/44**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 10731685.3 (22) 01.07.2010
- (43) 16.05.2012
- (45) 26.02.2014
- (31) 223507 P (32) 07.07.2009 (33) US
- (86) PCT/US2010/040734 01.07.2010
- (87) WO2011/005646 13.01.2011
- (73) Boehringer Ingelheim International GmbH, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim, DE
- (72) CHEN, Feng-Jing, US
SCHWABE, Robert J., US
- (74) Simon, Elke Anna Maria, et al, Boehringer Ingelheim GmbH, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
- (54) **FARMACEITISKA KOMPOZĪCIJA C HEPATĪTA VĪRUSA PROTEĀZES INHIBITORAM**
PHARMACEUTICAL COMPOSITION FOR A HEPATITIS C VIRAL PROTEASE INHIBITOR
- (57) 1. Šķidra farmaceitiska kompozīcija, kas ietver:
 - (a) savienojumu ar formulu (1):



- vai tā farmaceitiski pieņemamu sāli,
- (b) vienu vai vairākus farmaceitiski pieņemamus lipīdus un

(c) vienu vai vairākas farmaceitiski pieņemamas hidrofilas virsmaktīvās vielas.

2. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur savienojums ar formulu (1) ir nātrija sāls veidā.

3. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā savienojums ar formulu (1) vai tā farmaceitiski pieņemamais sāls ir no 1 līdz 50 masas %.

4. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā farmaceitiski pieņemamais lipīds ir no 20 masas % līdz 70 masas %.

5. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā farmaceitiski pieņemamais lipīds ir izvēlēts no rindas: taukskābes, vidējo vai garo ķēžu mono-, di- vai triglicerīdi, propilēnglikols, taukskābes esterī, sorbīta taukskābes esterī, ūdenī nešķīstošie vitamīni un to maisījumi.

6. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā farmaceitiski pieņemamā hidrofilā virsmaktīvā viela ir līdz 70 masas % no kopējās masas.

7. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur farmaceitiski pieņemamā hidrofilā virsmaktīvā viela ir izvēlēta no rindas: polietoksilētas augu eļļas, polietoksilēti tokoferoli, polietoksilēti sorbīta un taukskābju esterī, žultsskābes sāļi, lecitīni un to maisījumi.

8. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas papildus satur farmaceitiski pieņemamu hidrofilu šķīdinātāju.

9. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 8. pretenziju, kur farmaceitiski pieņemamais hidrofilais šķīdinātājs ir izvēlēts no rindas: propilēnglikols, polipropilēnglikols, polietilēnglikols, glicerīns, etanols, dimetilzorsorbīts, glikofurols, propilēnkarbonāts, dimetilacetamīds, ūdens vai to maisījumi.

10. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 8. vai 9. pretenziju, kur farmaceitiski pieņemamais hidrofilais šķīdinātājs ir līdz 30 masas %.

11. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur pēc atšķaidīšanas ar ūdens šķīdumu, kur ūdens šķīduma un kompozīcijas masas attiecība ir 100:1, kompozīcija veido ūdens dispersiju, kuras absorbcija ir vairāk nekā 1,0 pie viļņu garuma 400 nm.

12. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas ietver:

(A)
(a) savienojumu ar formulu (1) vai tā farmaceitiski pieņemamu sāli no 5 līdz 30 masas %,
 (b) farmaceitiski pieņemamu lipīdu no 30 līdz 60 masas %,
 (c) farmaceitiski pieņemamu hidrofilu virsmaktīvu vielu no 20 līdz 50 masas %,
 (d) neobligāti farmaceitiski pieņemamu hidrofilu šķīdinātāju līdz 30 masas %;

vai
(B)
(a) savienojumu ar formulu (1) vai tā farmaceitiski pieņemamu sāli,
 (b) farmaceitiski pieņemamu lipīdu no 40 līdz 50 masas %,
 (c) farmaceitiski pieņemamu hidrofilu virsmaktīvu vielu no 25 līdz 35 masas %,
 (d) farmaceitiski pieņemamu hidrofilu šķīdinātāju no 5 līdz 15 masas %;

vai
(C)
(a) savienojumu ar formulu (1) vai tā farmaceitiski pieņemamu sāli no 5 līdz 30 masas %,
 (b) farmaceitiski pieņemamu lipīdu no 30 līdz 60 masas %, kas izvēlēts no rindas: taukskābes, vidējo vai garo ķēžu mono-, di- vai triglicerīdi, propilēnglikols, taukskābes esterī, sorbīta taukskābes esterī, ūdenī nešķīstošie vitamīni un to maisījumi,
 (c) farmaceitiski pieņemamu hidrofilu virsmaktīvu vielu no 20 līdz 50 masas %, kas izvēlēta no rindas: polietoksilētas augu eļļas, polietoksilēti tokoferoli, polietoksilēti sorbīta un taukskābju esterī, žultsskābes sāļi, lecitīni un to maisījumi,
 (d) neobligāti līdz 30 % farmaceitiski pieņemamu hidrofilu šķīdinātāju, kas izvēlēts no rindas: propilēnglikols, polipropilēnglikols, polietilēnglikols, glicerols, etanols, dimetilzorsorbīts, glikofurols, propilēnkarbonāts, dimetilacetamīds, ūdens vai to maisījumi, vai

(D)

(a) savienojumu ar formulu (1) no 10 līdz 20 masas %, kas ir nātrija sāls veidā;

(b) farmaceitiski pieņemamu lipīdu no 40 līdz 50 masas %, kas izvēlēts no rindas: kaprīlskābes un kaprīnskābes monoglicerīdi, alifātiskas kaprīlskābes un kaprīnskābes diglicerīdi un to maisījumi;

(c) farmaceitiski pieņemamu hidrofilu virsmaktīvu vielu no 25 līdz 35 masas %, kas izvēlēta no rindas: tokoferilpolietilēnglikola sukcināts, polioksil-40 hidroģenēta rīcinēļa un polioksil-35 rīcinēļa un to maisījumi;

(d) farmaceitiski pieņemamu hidrofilu šķīdinātāju no 5 līdz 10 masas %, kas izvēlēts no rindas: propilēnglikols, polietilēnglikols, etanols, ūdens un to maisījumi.

(51) C07D 243/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 401/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 401/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 403/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 407/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 409/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 409/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 413/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 417/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 491/048⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 495/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 401/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 403/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 403/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 405/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 413/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 413/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 519/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 471/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 215/227⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(21) 10751720.3

(43) 27.06.2012

(45) 16.04.2014

(31) 235973 P

235981 P

235983 P

359686 P

(86) PCT/JP2010/064545

(87) WO2011/021726

(73) Otsuka Pharmaceutical Co., Ltd., 9, Kanda-Tsukasa-machi 2-chome Chiyoda-ku, Tokyo 101-8535, JP

(72) OSHIMA, Kunio, JP

MATSUMURA, Shuuji, JP

YAMABE, Hokuto, JP

ISONO, Naohiro, JP

TAKEMURA, Noriaki, JP

TAIRA, Shinichi, JP

OSHIYAMA, Takashi, JP

MENJO, Yasuhiro, JP

NAGASE, Tsuyoshi, JP

UEDA, Masataka, JP

KOGA, Yasuo, JP

NAKAYAMA, Sunao, JP

TSUJIMAE, Kenji, JP

ONOGAWA, Toshiyuki, JP

TAI, Kuninori, JP

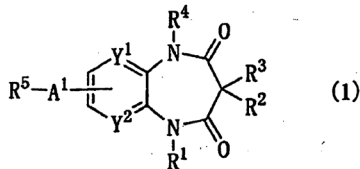
ITOTANI, Motohiro, JP

(74) HOFFMANN EITL, Patent- und Rechtsanwälte, Arabellastraße 4, 81925 München, DE
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV

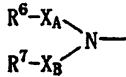
(54) SLĀPEKĻA ATOMU SATUROŠI SAVIENOJUMI UN TO FARMACEITISKAS KOMPOZĪCIJAS ATRĪĀLAS FIBRILĀCIJAS ĀRSTĒŠANAI

NITROGEN-CONTAINING COMPOUNDS AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS THEREOF FOR THE TREATMENT OF ATRIAL FIBRILLATION

(57) 1. Diazepīna savienojums, kas attēlots ar vispārīgo formulu (I)



vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kurā R¹, R², R³ un R⁴ katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, C₁₋₆alkilgrupa, ciklo-C₃₋₈alkilgrupa vai C₁₋₆alkoksi-C₁₋₆alkilgrupa; R² un R³ var būt saistīti, lai veidotu C₁₋₆alkilēngrupu; A¹ ir C₁₋₆alkilēngrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām hidroksilgrupām; Y¹ un Y² katrs neatkarīgi ir N= vai -CH=; R⁵ ir grupa, attēlota ar



kur R⁶ un R⁷ katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai C₁₋₆alkilgrupa, ciklo-C₃₋₈alkilgrupa, arilgrupa vai heterocikliska grupa, no kurām katra ir neobligāti aizvietota;

R⁶ un R⁷ var būt saistīti, lai veidotu gredzenu kopā ar blakusesošu grupu -X_A-N-X_B-;

X_A un X_B katrs neatkarīgi ir saite, alkilēngrupa, alkenilēngrupa, -CO-, -SO₂- vai -CONH-, kurā katra no alkilēngrupas un alkenilēngrupas virknēm var neobligāti saturēt vienu vai vairākus aizvietotājus, kas izvēlēti no grupas, kas sastāv no -S-, -C(=S)-, -SO₂-, -CO-, -O-, -NH-, -CONH- un -SO₂NH-, un ūdeņraža atoms (H), kas sasaistīts ar X_A un X_B slāpekļa atomu (N), ir neobligāti aizvietots ar aizvietotāju, izvēlētu no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas, fenil-C₁₋₆alkilgrupas un fenilgrupas.

2. Diazepīna savienojums vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R⁶ un R⁷ katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, C₁₋₆alkilgrupa, ciklo-C₃₋₈alkilgrupa, arilgrupa vai heterocikliska grupa, no kurām katra ir neobligāti aizvietota, un X_A un X_B katrs neatkarīgi ir saite, C₁₋₆alkilēngrupa, C₂₋₆alkenilēngrupa, -CO-, -SO₂-, -C₁₋₆alkilēn-SO₂-, -C₁₋₆alkilēn-CO-, -C₂₋₆alkenilēn-CO-, -C₁₋₆alkilēn-CO-N(C₁₋₆alkil)-C₁₋₆alkilēn-, -N(C₁₋₆alkil)-C₁₋₆alkilēn-, -CO-N(C₁₋₆alkil)-C₁₋₆alkilēn-, -O-C₁₋₆alkilēn-, -N(fenil)-C₁₋₆alkilēn-, -C₁₋₆alkilēn-, -CO-C₁₋₆alkilēn-CO-, -CO-NH-C₁₋₆alkilēn-, -C₁₋₆alkilēn-N(C₁₋₆alkil)-C₁₋₆alkilēn-, -C₁₋₆alkilēn-N(C₁₋₆alkil)-C₁₋₆alkilēn-O-, -C₁₋₆alkilēn-NH-C₁₋₆alkilēn-, -C₁₋₆alkilēn-SO₂-NHC₁₋₆alkilēn-, -N(C₁₋₆alkil)-CO-C₁₋₆alkilēn-, -N(C₁₋₆alkil)-C₁₋₆alkilēn-CO-, -N(C₁₋₆alkil)-C₁₋₆alkilēn-N(C₁₋₆alkil)-C₁₋₆alkilēn-, -N(fenil)-C₁₋₆alkilēn-CO-, -N(fenil)-C₁₋₆alkilēn-CO-, -NH-CO-, -NH-COC₁₋₆alkilēn-, -NH-C₁₋₆alkilēn-, -O-C₁₋₆alkilēn-CO-N(C₁₋₆alkil)-C₁₋₆alkilēn-, -O-C₁₋₆alkilēn-CO-, -NHC₁₋₆alkilēn-CO-N(C₁₋₆alkil)-C₁₋₆alkilēn-, -S-C₁₋₆alkilēn-CO-N(C₁₋₆alkil)-C₁₋₆alkilēn-, -SO₂-N(C₁₋₆alkil)-C₁₋₆alkilēn-, -SO₂-NH-C₁₋₆alkilēn-, -C₂₋₆alkenilēn-CO-N(C₁₋₆alkil)-C₁₋₆alkilēn-, C₁₋₆alkilēn-N(fenil)-C₁₋₆alkilēn-, -N(fenil)-C₁₋₆alkilēn-, N(fenil)-C₁₋₆alkilēn-CO-N(C₁₋₆alkil)-C₁₋₆alkilēn- vai -CO-C₁₋₆alkilēn-O-CO-C₁₋₆alkilēn-O-.

3. Diazepīna savienojums vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar 2. pretenziju, kur R⁵ un R⁷ katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, C₁₋₆alkilgrupa, ciklo-C₃₋₈alkilgrupa, arilgrupa vai piesātinātas vai nepiesātinātas monocikliskas vai policikliskas, heterocikliskas grupas, kas satur vismaz vienu heteroatomu, izvēlētu no grupas, kas sastāv no skābekļa atoma, sēra atoma un slāpekļa atoma, no kuriem katrs ir neobligāti aizvietots.

4. Diazepīna savienojums vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar 3. pretenziju, kur R⁶ un R⁷ katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, C₁₋₆alkilgrupa, ciklo-C₃₋₈alkilgrupa, fenilgrupa, naftilgrupa, piperidilgrupa, piperazinilgrupa, pirolidilgrupa, morfolinilgrupa, furilgrupa, tienilgrupa, pirazolilgrupa, oksazolilgrupa, izoksazolilgrupa, tiazolilgrupa, izotiazolilgrupa, pirolilgrupa, triazolilgrupa, imidazolilgrupa, piridilgrupa, pirimidinilgrupa, piridazinilgrupa, pirazinilgrupa, imidazo[2,1-b]tiazolilgrupa, tieno[2,3-b]pirazinilgrupa, 2,3-dihidroimidazo[2,1-b]tiazolilgrupa, benzotiazolilgrupa, indolilgrupa, imidazo[1,2-a]piridilgrupa, imidazo[1,5-a]piridilgrupa, benztienilgrupa, benzimidazolilgrupa, 2,3-dihidrobenzimidazolilgrupa, 2,3-dihidrobenzo[b]furilgrupa, benzfurilgrupa, indazolilgrupa, furo[2,3-c]piridilgrupa, 6,7-dihidrofuro[2,3-c]piridilgrupa,

furo[3,2-c]piridilgrupa, 4,5-dihidrofuro[3,2-c]piridilgrupa, furo[2,3-b]piridilgrupa, 6,7-dihidrofuro[2,5-b]piridilgrupa, tieno[2,3-c]piridilgrupa, 6,7-dihidrotieno[2,3-c]piridilgrupa, tieno[3,2-c]piridilgrupa, 4,5-dihidrotieno[3,2-c]piridilgrupa, tieno[2,3-b]piridilgrupa, 6,7-dihidrotieno[2,3-b]piridilgrupa, benzo[1,3]dioksolilgrupa, benzizoksazolilgrupa, pirazolo[2,3-a]piridilgrupa, indolizinilgrupa, 2,3-dihidroindolilgrupa, izohinolilgrupa, 1,2-dihidroizohinolilgrupa, 1,2,3,4-tetrahidro-1H-izohinolilgrupa, karbostirilgrupa, 3,4-dihidrokarbostirilgrupa, hinolilgrupa, 1,4-dihidrohinolilgrupa, 1,2-dihidrohinolilgrupa, 3,4-dihidrohinolilgrupa, 1,2,3,4-tetrahidrohinolilgrupa, pirido[3,4-d]imidazolilgrupa, pirido[2,3-d]imidazolilgrupa, hromanilgrupa, 5,6,7,8-tetrahidroizohinolilgrupa, 3,4-dihidro-1H-izohinolilgrupa, 3,4-dihidroizohinolilgrupa, naftiridinilgrupa, 1,4-benzdioksanilgrupa, cinnolinilgrupa, hinoksalinilgrupa, 2,3-dihidrobenz-1,4-oksazinilgrupa, azetidilgrupa, 1,2,4-oksadiazolilgrupa un azepanilgrupa, no kurām katra ir neobligāti aizvietota.

5. Diazepīna savienojums vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar 4. pretenziju, kur R⁶ un R⁷ katrs neatkarīgi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no šādiem aizvietotājiem (1) līdz (54):

- (1) ūdeņraža atoma;
- (2) C₁₋₆alkilgrupas;
- (3) ciklo-C₃₋₈alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām fenil-C₁₋₆alkoksigrupām;
- (4) fenilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no sekojošiem (4-1) līdz (4-27):
 - (4-1) ciāngrupas;
 - (4-2) hidroksilgrupas;
 - (4-3) halogēna atoma;
 - (4-4) C₁₋₆alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, hidroksilgrupas, C₁₋₆alkoksigrupas, imidazolilgrupas, 2-okso-1,2,3,4-tetrahidrohinolilgrupas un morfolinilgrupas;
 - (4-5) C₁₋₆alkoksigrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no aminogrupas un C₁₋₆alkilaminogrupas;
 - (4-6) piridilgrupas;
 - (4-7) tienilgrupas;
 - (4-8) piperazinilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;
 - (4-9) fenilgrupas;
 - (4-10) pirazolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;
 - (4-11) pirimidinilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;
 - (4-12) piperidilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;
 - (4-13) furilgrupas;
 - (4-14) karboksilgrupas;
 - (4-15) C₁₋₆alkoksikarbonilgrupas;
 - (4-16) aminogrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas, C₁₋₆alkanoilgrupas un C₁₋₆alkilsulfonilgrupas,
 - (4-17) C₁₋₆alkiltiogrupas;
 - (4-18) triazolilgrupas;
 - (4-19) imidazolilgrupas;
 - (4-20) pirolidilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām oksogrupām;
 - (4-21) C₁₋₆alkilsulfonilgrupas;
 - (4-22) C₁₋₄alkilēndioksigrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem;
 - (4-23) nitrogrupas;
 - (4-24) oksazolilgrupas;
 - (4-25) tiazolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;
 - (4-26) C₁₋₆alkanoilgrupas; un
 - (4-27) morfolinilgrupas;
- (5) naftilgrupas;
- (6) furilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar halogēna atomu, karboksilgrupu, sulfogrupu, piridiloksigrupu, C₁₋₆alkoksikarbonilgrupu un fenilgrupu;
- (7) tienilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas,

C₁₋₄alkilēndioksigrupas, karboksilgrupas, halogēna atoma, piridilgrupas, C₁₋₆alkoksigrupas, C₁₋₆alkoksikarbonilgrupas, oksazolilgrupas un furilgrupas;

(8) imidazolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no fenilgrupas, C₁₋₆alkilgrupas un halogēna atoma;

(9) pirazolilgrupas, katjona formā neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar halogēna atomu vai C₁₋₆alkoksigrupu; ciklo-C₃₋₆alkilgrupas; halogēna atoma; fenilgrupas, neobligāti aizvietotas ar C₁₋₆alkoksigrupu; furilgrupas un tienilgrupas;

(10) oksazolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas un fenilgrupas;

(11) izoksazolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no fenilgrupas, C₁₋₆alkilgrupas, tienilgrupas un furilgrupas;

(12) tiazolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar halogēna atomu vai C₁₋₆alkoksigrupu; fenilgrupas; fenoksigrupas un C₁₋₆alkanoilaminogrupas;

(13) pirolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas un C₁₋₆alkoksikarbonilgrupas;

(14) triazolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(15) piridilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no sekojošiem (15-1) līdz (15-14):

(15-1) halogēna atoma;

(15-2) ciāngrupas;

(15-3) aminogrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkanoilgrupas un C₁₋₆alkilsulfonilgrupas;

(15-4) C₁₋₆alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, C₁₋₆alkoksigrupas, C₁₋₆alkanoiloksigrupas, ciklo-C₃₋₆alkilaminogrupas, C₁₋₆alkilaminogrupas, C₁₋₆alkanoilaminogrupas, hidroksilgrupas un pirolidinilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām hidroksilgrupām;

(15-5) oksogrupas;

(15-6) hidroksilgrupas;

(15-7) C₁₋₆alkoksigrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām fenilgrupām;

(15-8) pirolidinilgrupas;

(15-9) C₁₋₆alkanoilgrupas;

(15-10) morfolinilgrupas;

(15-11) fenoksigrupas;

(15-12) pirazolilgrupas;

(15-13) tienilgrupas; un

(15-14) N-oksīda;

(16) pirimidinilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas un fenilgrupas;

(17) piridazinilgrupas;

(18) pirazinilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām fenil-C₁₋₆alkoksigrupām;

(19) imidazo[2,1-b]tiazolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem;

(20) tieno[2,3-b]pirazinilgrupas;

(21) 2,3-dihidroimidazo[2,1-b]tiazolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām fenilgrupām;

(22) benzotiazolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(23) indolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas, C₁₋₆alkanoilgrupas un halogēna atoma;

(24) imidazo[1,2-a]piridilgrupas vai imidazo[1,5-a]piridilgrupas, no kurām katrā ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(25) benztienilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(26) benzimidazolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(27) 2,3-dihidrobenzo[b]furilgrupas;

(28) benzofurilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem;

(29) indazolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(30) furo[2,3-c]piridilgrupas vai 6,7-dihidrofuro[2,3-c]piridilgrupas, katrā no tām ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no oksogrupas un C₁₋₆alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar C₁₋₆alkoksigrupu;

(31) furo[3,2-c]piridilgrupas vai 4,5-dihidrofuro[3,2-c]piridilgrupas, katrā no tām ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no oksogrupas, C₁₋₆alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar halogēna atomu vai C₁₋₆alkoksigrupu, halogēna atoma, furilgrupas, piridilgrupas un fenilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no aminogrupas un C₁₋₆alkoksigrupas;

(32) tieno[2,3-c]piridilgrupas vai 6,7-dihidrotieno[2,3-c]piridilgrupas, no kurām katrā ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no oksogrupas un C₁₋₆alkilgrupas;

(33) tieno[3,2-c]piridilgrupas vai 4,5-dihidrotieno[3,2-c]piridilgrupas, no kurām katrā ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no oksogrupas un C₁₋₆alkilgrupas;

(34) tieno[2,3-b]piridilgrupas;

(35) benzo[1,3]dioksolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem;

(36) benzizoksazolilgrupas;

(37) pirazolo[2,3-a]piridilgrupas;

(38) indolizinilgrupas;

(39) 2,3-dihidroindolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no oksogrupas, C₁₋₆alkilgrupas un C₁₋₆alkanoilgrupas;

(40) izohinolilgrupas vai 1,2-dihidroizohinolilgrupas, katrā no kurām ir neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas, halogēna atoma un oksogrupas;

(41) 1,2,3,4-tetrahydroizohinolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām oksogrupām;

(42) hinolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no aminogrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai divām C₁₋₆alkilgrupām, C₁₋₆alkoksigrupām, C₁₋₆alkilgrupām un oksogrupām;

(43) 1,2,3,4-tetrahydrohinolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas, piridil-C₁₋₆alkilgrupas, aralkilgrupas, C₁₋₆alkoksigrupas un oksogrupas;

(44) 1,2-dihydrohinolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no aminogrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai divām C₁₋₆alkilgrupām, C₁₋₆alkoksigrupām, C₁₋₆alkilgrupām un oksogrupām;

(45) hromanilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(46) 5,6,7,8-tetrahydroizohinolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām oksogrupām;

(47) 3,4-dihidroizohinolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām oksogrupām;

(48) naftiridinilgrupas;

(49) 1,4-benzdioksanilgrupas;

(50) cinnolinilgrupas;

(51) hinoksalinilgrupas;

(52) 2,3-dihidrobenz-1,4-oksazinilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas un oksogrupas;

(53) 2,3-dihidro-1H-benzo[d]imidazolilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas un oksogrupas; un

(54) piperidilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām arilkarbonilgrupām.

6. Diazepīna savienojums vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar 5. pretenziju, kur R⁶ un R⁷ katrs neatkarīgi ir (1), (4a), (6a), (7a), (8a), (9a), (10a), (11a), (12a), (15a), (16a), (17), (18), (23a), (24a), (24b), (26), (29), (30a), (30b), (31a), (31b), (32a), (32b), (33a), (33b), (35), (40a), (40b), (42a), (43a), (44a) un (53):

(1) ūdeņraža atoms;

(4a) fenilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no (4-1), (4-2), (4-4), (4a-5), (4-10), (4a-16), (4-18), (4-19), (4-23), (4-26) un (4-27):

(4-1) ciāngrupa;

(4-2) hidroksilgrupa;

(4-4) C₁₋₆alkilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no halogēna atomiem, hidroksilgrupas, 2-okso-1,2,3,4-tetrahidrohinoilgrupas, C₁₋₆alkoksigrupas, imidazolilgrupas un morfolinilgrupas;

(4a-5) C₁₋₆alkoksigrupa;

(4-10) pirazolilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(4a-16) aminogrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilsulfonilgrupām;

(4-18) triazolilgrupa;

(4-19) imidazolilgrupa;

(4-23) nitrogrupa;

(4-26) C₁₋₆alkanoilgrupa; un

(4-27) morfolinilgrupa;

(6a) furilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām, neobligāti aizvietotām ar halogēna atomu;

(7a) tienilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(8a) imidazolilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(9a) pirazolilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām, neobligāti aizvietotām ar C₁₋₆alkoksigrupu;

(10a) oksazolilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(11a) izoksazolilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(12a) tiazolilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām, neobligāti aizvietotām ar halogēna atomu;

(15a) piridilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no sekojošiem (15-1) līdz (15-5), (15a-7), (15-9), (15-11), (15-12) un (15-14):

(15-1) halogēna atoma;

(15-2) ciāngrupas;

(15-3) aminogrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkanoilgrupas un C₁₋₆alkilsulfonilgrupas;

(15-4) C₁₋₆alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, C₁₋₆alkoksigrupas, C₁₋₆alkanoiloksigrupas, ciklo-C₃₋₈alkilaminogrupas, C₁₋₆alkilaminogrupas, C₁₋₆alkanoilaminogrupas, hidroksilgrupas un pirodinilgrupas, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām hidroksilgrupām;

(15-5) oksogrupas;

(15a-7) C₁₋₆alkoksigrupas;

(15-9) C₁₋₆alkanoilgrupas;

(15-11) fenoksigrupas;

(15-12) pirazolilgrupas; un

(15-14) N-oksīda,

(16a) pirimidinilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(17) piridazinilgrupa;

(18) pirazinilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām fenilgrupām, C₁₋₆alkoksigrupām;

(23a) indolilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(24a) imidazo[1,2-a]piridilgrupa;

(24b) imidazo[1,5-a]piridilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(26) benzimidazolilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(29) indazolilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām C₁₋₆alkilgrupām;

(30a) furo[2,3-c]piridilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no oksogrupas un C₁₋₆alkilgrupas;

(30b) 6,7-dihidrofuro[2,3-c]piridilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no oksogrupas un C₁₋₆alkilgrupas;

(31a) furo[3,2-c]piridilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no oksogrupas un C₁₋₆alkilgrupas;

(31b) 4,5-dihidrofuro[3,2-c]piridilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no oksogrupas un C₁₋₆alkilgrupas, neobligāti aizvietotas ar halogēna atomu vai C₁₋₆alkoksigrupu;

(32a) tieno[2,3-c]piridilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no oksogrupas un C₁₋₆alkilgrupas;

(32b) 6,7-dihidrotieno[2,3-c]piridilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no oksogrupas un C₁₋₆alkilgrupas;

(33a) tieno[3,2-c]piridilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no oksogrupas un C₁₋₆alkilgrupas;

(33b) 4,5-dihidrotieno[3,2-c]piridilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no oksogrupas un C₁₋₆alkilgrupas;

(35a) benzo[1,3]dioksolilgrupa;

(40a) izohinolilgrupa, neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām oksogrupām;

(40b) 1,2-dihidroizohinolilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no oksogrupas un C₁₋₆alkilgrupas;

(42a) hinolilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām oksogrupām;

(43a) 1,2,3,4-tetrahidrohinoilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no aralkilgrupas (piemēram, fenil-C₁₋₆alkilgrupas, utt.), piridil-C₁₋₆alkilgrupas un oksogrupas;

(44) 1,2-dihidrohinoilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākām oksogrupām; un

(53) 2,3-dihidrobenu[d]imidazolilgrupa, neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no C₁₋₆alkilgrupas un oksogrupas.

7. Diazepīna savienojums vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar 6. pretenziju, kur R⁶ un R⁷ katrs neatkarīgi ir fenilgrupa, piridilgrupa, pirazolilgrupa, indolilgrupa, 4,5-dihidrofuro[3,2-c]piridilgrupa un 1,2-dihidroizohinolilgrupa, katra no tām neobligāti ir aizvietota ar vienu vai diviem aizvietotājiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no oksogrupas, C₁₋₆alkilgrupas, C₁₋₆alkoksi-C₁₋₆alkilgrupas un C₁₋₆alkilsulfonilaminogrupas.

8. Diazepīna savienojums vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar 7. pretenziju, kurš ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no šādiem savienojumiem:

1-etil-3,3,5-trimetil-7-(3-{N-[2-(2-metil-4-okso-4H-furo[3,2-c]piridin-5-il)etil]-N-(piridin-4-ilmetil)amino}propil)-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona,

1-etil-3,3,5-trimetil-7-(2-{N-[2-(2-metil-4-okso-4H-furo[3,2-c]piridin-5-il)etil]-N-(piridin-4-ilmetil)amino}etil)-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona,

1-etil-3,3,5-trimetil-7-(2-{N-(2-metilpiridin-3-ilmetil)-N-[2-(4-okso-4H-furo[3,2-c]piridin-5-il)etil]amino}etil)-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona,

1-etil-3,3,5-trimetil-7-{2-[N-[2-(2-metil-4-okso-4H-furo[3,2-c]piridin-5-il)etil]-N-(4-metilpiridin-3-ilmetil)amino]etil}-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona,

1-etil-3,3,5-trimetil-7-([N-(2-metilpiridin-3-ilmetil)-N-[2-(1-okso-1H-izohinolīn-2-il)etil]amino]metil)-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona,

N-(1-etil-3,3,5-trimetil-2,4-dioksido-2,3,4,5-tetrahidro-1H-benzo[b][1,4]diazepīn-7-ilmetil)-4-metil-N-(2-piridin-3-iletīl)benzamīda,

N-(1-etil-3,3,5-trimetil-2,4-dioksido-2,3,4,5-tetrahidro-1H-benzo[b][1,4]diazepīn-7-ilmetil)-N-(2-piridin-3-iletīl)benzolsulfonamīda,

7-([N-benzil-N-(2-piridin-3-iletīl)amino]metil)-1-etil-3,3,5-trimetil-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona,

N-(2-[[1-etil-3,3,5-trimetil-2,4-dioksido-2,3,4,5-tetrahidro-1H-benzo[b][1,4]diazepīn-7-ilmetil]-2-piridin-3-iletīl]amino]metil)fenil]metānsulfonamīda,

7-[[N-[2-(2,7-dimetil-4-okso-4H-furo[3,2-c]piridin-5-il)etil]-N-(2,5-dimetil-2H-pirazol-3-ilmetil)amino]metil]-1-etil-3,3,5-trimetil-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona,

1-etil-7-([N-(2-metoksimetilpiridin-3-ilmetil)-N-[2-(2-metil-4-okso-4H-furo[3,2-c]piridin-5-il)etil]amino]metil)-3,3,5-trimetil-1,5-dihidro-

benzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona, 1-etil-7-((N-(2-metoksimetilpiridin-3-ilmetil)-N-[2-(7-metil-4-okso-4H-furo[3,2-c]piridin-5-il)etil]amino)metil)-3,3,5-trimetil-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona, N-(1-etil-3,3,5-trimetil-2,4-dioksa-2,3,4,5-tetrahidro-1H-benzo[b][1,4]diazepin-7-ilmetil)-2-(1-metil-1H-indol-3-il)-N-(2-piridin-3-iletīl)acetamīda.

9. Diazepīna savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar 8. pretenziju, kurš ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no šādiem savienojumiem:

1-etil-3,3,5-trimetil-7-(3-{N-[2-(2-metil-4-okso-4H-furo[3,2-c]piridin-5-il)etil]-N-(piridin-4-ilmetil)amino}propil)-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona dihidrohlorīda,

1-etil-3,3,5-trimetil-7-(2-{N-[2-(2-metil-4-okso-4H-furo[3,2-c]piridin-3-il)etil]-N-(piridin-4-ilmetil)amino}etil)-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona dihidrohlorīda,

1-etil-3,3,5-trimetil-7-(2-{N-(2-metilpiridin-3-ilmetil)-N-[2-(4-okso-4H-furo[3,2-c]piridin-5-il)etil]amino}etil)-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona dihidrohlorīda,

1-etil-3,3,5-trimetil-7-{2-[N-[2-(2-metil-4-okso-4H-furo[3,2-c]piridin-5-il)etil]-N-(4-metilpiridin-3-ilmetil)amino]etil}-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona dihidrohlorīda,

1-etil-3,3,5-trimetil-7-((N-(2-metilpiridin-3-ilmetil)-N-[2-(1-okso-1H-izohinolīn-2-il)etil]amino)metil)-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona dihidrohlorīda,

N-(1-etil-3,3,5-trimetil-2,4-dioksa-2,3,4,5-tetrahidro-1H-benzo[b][1,4]diazepin-7-ilmetil)-4-metil-N-(2-piridin-3-iletīl)benzamīda hidrohlorīda,

N-(1-etil-3,3,5-trimetil-2,4-dioksa-2,3,4,3-tetrahidro-1H-benzo[b][1,4]diazepin-7-ilmetil)-N-(2-piridin-3-iletīl)benzolsulfonamīda, 7-[[N-benzil-N-(2-piridin-3-iletīl)amino]metil]-1-etil-3,3,5-trimetil-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona hidrohlorīda,

N-(2-[[1-etil-3,3,5-trimetil-2,4-dioksa-2,3,4,5-tetrahidro-1H-benzo[b][1,4]diazepin-7-ilmetil](2-piridin-3-iletīl)amino]metil)fenil)metānsulfonamīda dihidrohlorīda,

7-[[N-[2-(2,7-dimetil-4-okso-4H-furo[3,2-c]piridin-5-il)etil]-N-(2,5-dimetil-2H-pirazol-3-ilmetil)amino]metil]-1-etil-3,3,5-trimetil-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona,

1-etil-7-((N-(2-metoksimetilpiridin-3-ilmetil)-N-[2-(2-metil-4-okso-4H-furo[3,2-c]piridin-5-il)etil]amino)metil)-3,3,5-trimetil-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona,

1-etil-7-((N-(2-metoksimetilpiridin-3-ilmetil)-N-[2-(7-metil-4-okso-4H-furo[3,2-c]piridin-5-il)etil]amino)metil)-3,3,5-trimetil-1,5-dihidrobenzo[b][1,4]diazepīn-2,4-diona, un

N-(1-etil-3,3,5-trimetil-2,4-dioksa-2,3,4,5-tetrahidro-1H-benzo[b][1,4]diazepin-7-ilmetil)-2-(1-metil-1H-indol-3-il)-N-(2-piridin-3-iletīl)acetamīda hidrohlorīda.

10. Diazepīna savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kurā Y¹ un Y² katrs ir -CH=.

11. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur diazepīna savienojumu vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai un farmakoloģiski pieņemamu nesēju.

12. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 11. pretenziju izmantošanai aritmijas profilaksē un/vai ārstēšanā.

13. Diazepīna savienojums vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai izmantošanai aritmijas profilaksē un/vai ārstēšanā.

14. Diazepīna savienojuma vai tā farmaceutiski pieņemama sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai izmantošana farmaceutiskas kompozīcijas ražošanai.

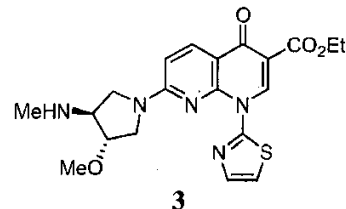
HASHASH, Ahmad, US
RITCHIE, Sean, US
CHENG, Hengqin, US

(74) Weber, Martin, Jones Day, Prinzregentenstraße 11, 80538 München, DE
Jevgeņija GAINUTDINOVA, Tomsona iela 24-15, Rīga, LV-1013, LV

(54) **STABILAS SNS-595 KOMPOZĪCIJAS UN IEGŪŠANAS METODES**

STABLE SNS-595 COMPOSITIONS AND METHODS OF PREPARATION

(57) 1. Paņēmiens SNS-595 vielas pagatavošanai, kas ietver:
(a) savienojuma 3:



reakciju ar pirmo bāzes ūdens šķīdumu ar sekojošu neitralizēšanu, lai iegūtu primāro SNS-595 hidrātu;

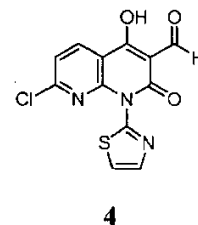
(b) primārā SNS-595 hidrāta no (a) stadijas dehidratāciju un dehidratētā produkta reakciju ar otro bāzes ūdens šķīdumu ar sekojošu neitralizēšanu, lai iegūtu sekundāro SNS-595 hidrātu; un

(c) sekundārā SNS-595 hidrāta, iegūta (b) stadijā, dehidratāciju, lai iegūtu SNS-595 vielu.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā pirmās un otrās bāzes ūdens šķīdumi ir izvēlēti no kālija hidroksīda, nātrija hidroksīda un litija hidroksīda; (a) un (b) stadiju neitralizācijas ir izpildītas ar etiķskābi; un (b) un (c) stadiju dehidratācijas ir paveiktas ar etanolu.

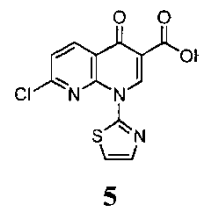
3. Paņēmiens saskaņā ar 2. pretenziju, kurā pirmās un otrās bāzes ūdens šķīdumi ir nātrija hidroksīds.

4. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kurā SNS-595 viela, kas iegūta no (c) stadijas, satur 0 līdz 0,01 % savienojumu 4:



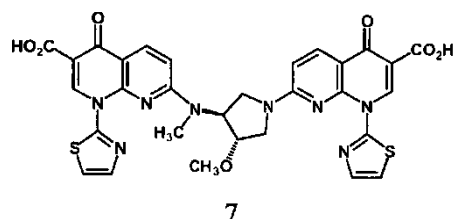
atbilstoši SNS-595 vielas kopējai masai.

5. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kurā SNS-595 viela, kas iegūta no (c) stadijas, satur 0 līdz 0,02 % savienojumu 5:



atbilstoši SNS-595 vielas kopējai masai.

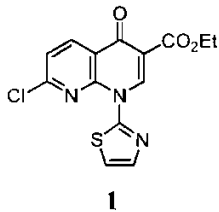
6. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kurā SNS-595 viela, kas iegūta no (c) stadijas, satur 0 līdz 0,1 % savienojumu 7:



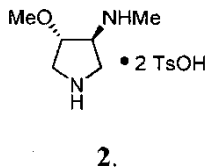
atbilstoši SNS-595 vielas kopējai masai.

- (51) **C07D 417/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2473507**
C07D 417/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 10759761.9 (22) 03.09.2010
(43) 11.07.2012
(45) 19.03.2014
- (31) 240161 P (32) 04.09.2009 (33) US
(86) PCT/US2010/047776 03.09.2010
(87) WO2011/028979 10.03.2011
- (73) Sunesis Pharmaceuticals, Inc., 395 Oyster Point Blvd., Suite 400, South San Francisco, CA 94080, US
(72) SUDHAKAR, Anantha, US
JACOBS, Jeff, US

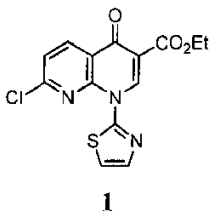
7. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā savienojums 3 ir iegūts savienojuma 1



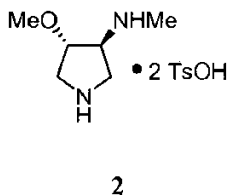
reakcijā ar savienojumu 2



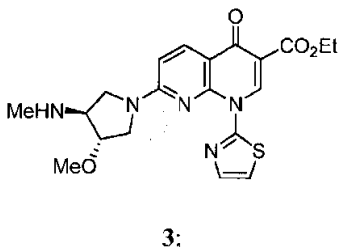
8. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver:
(a) savienojuma 1



reakciju ar savienojumu 2



DIPEA un ūdens klātbūtnē, lai iegūtu savienojumu 3



(b) savienojuma 3 reakciju ar pirmo bāzes ūdens šķīdumu ar sekojošu neitralizēšanu, lai iegūtu primāro SNS-595 hidrātu;

(c) primārā SNS-595 hidrāta, iegūta (b) stadijā, dehidratāciju, lai veidotu SNS-595 vielu;

(d) SNS-595 vielas no (c) stadijas reakciju ar otro bāzes ūdens šķīdumu ar sekojošu neitralizēšanu, lai iegūtu sekundāro SNS-595 hidrātu; un

(e) sekundārā SNS-595 hidrāta, iegūta (d) stadijā, dehidratāciju, lai iegūtu SNS-595 vielu.

(51)	A61K 31/135 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾	(11)	2488170
	A61K 31/415 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾		
	A61K 45/06 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾		
	A61P 29/00 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾		
(21)	10765762.9	(22)	15.10.2010
(43)	22.08.2012		
(45)	22.01.2014		
(31)	09384004	(32)	16.10.2009 (33) EP
(86)	PCT/EP2010/006317		15.10.2010
(87)	WO2011/045075		21.04.2011

(73) Laboratorios del. Dr. Esteve, S.A., Avda Mare de Deu de Montserrat 221, 08041 Barcelona, ES

(72) PORTILLO SALIDO, Enrique, ES
VIDELA CES, Sebastià, ES

(74) Peters, Hajo, et al, ZACCO GmbH Bayerstrasse 83, 80335 München, DE

Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV

(54) **TRAMADOLU UN CELEKOKSIBU SATUROŠAS KOMPOZĪCIJAS SĀPJU ĀRSTĒŠANAI**
COMPOSITIONS COMPRISING TRAMADOL AND CELECOXIB IN THE TREATMENT OF PAIN

(57) 1. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur (*rac*)-tramadola·HCl un celekoksiba vai tā farmaceutiski pieņemama sāls vai hidrāta kombināciju, turklāt (*rac*)-tramadola·HCl molekulārā attiecība pret celekoksibu ir molārā attiecība no 1:1 līdz 1:5 vai no 1:1 līdz 5:1.

2. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt celekoksibs ir neitrālā formā.

3. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt (*rac*)-tramadola·HCl molekulārā attiecība pret celekoksibu ir molārā attiecība no 1:1.

4. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai lietošanai par analgētiķi vai lietošanai sāpju, galvenokārt akūtu sāpju, hronisku sāpju, neiropatisku sāpju, nociceptīvu sāpju, vieglu un stipru līdz mērenu sāpju, hiperalgēzijas, ar centrālu sensibilizāciju saistītu sāpju, alodīnijas vai vēža sāpju, ietverot diabētisko neiropatiju vai diabētisko perifēro neiropatiju un osteoartrītu, fibromialģijas, reimatoīdā artrīta, ankilizējošā spondilīta, pleca-lāpstiņas periartīta vai iēšias ārstēšanā.

(51) **C07C 217/80**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2488497**
(21) 10765586.2 (22) 14.10.2010

(43) 22.08.2012
(45) 12.03.2014

(31) 09382212 (32) 16.10.2009 (33) EP

(86) PCT/EP2010/006283 14.10.2010

(87) WO2011/045059 21.04.2011

(73) Almiral S.A., Ronda del General Mitre, 151, 08022 Barcelona, ES

(72) BOIX BERNARDINI, Maria, Carmen, ES

(74) Srinivasan, Ravi Chandran, et al, JAKemp, 14 South Square, Gray's Inn, London WC1R 5JJ, GB

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

(54) **PROCESS 2-[(3,5-DIFLUOR-3'-METOKSI-1,1'-BIFENIL-4-IL)AMINO]NIKOTĪNSKĀBES RAŽOŠANAI**
PROCESS FOR MANUFACTURING 2-[(3,5-DIFLUORO-3'-METHOXY-1,1'-BIPHENYL-4-YL)AMINO]NICOTINIC ACID

(57) 1. Process 2-[(3,5-difluor-3'-metoksi-1,1'-bifenil-4-il)amino]nikotīnskābes ražošanai, kas ietver šādus posmus:

a) 3,5-difluor-3'-metoksibifenil-4-amīna sagatavošanu,

b) 3,5-difluor-3'-metoksibifenil-4-amīna amīnija sāls iegūšanu un atdalīšanu, un

c) b) posmā iegūtā 3,5-difluor-3'-metoksibifenil-4-amīna amīnija sāls papildu reakciju, lai iegūtu 2-[(3,5-difluor-3'-metoksi-1,1'-bifenil-4-il)amino]nikotīnskābi.

2. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kurā a) posmā 3,5-difluor-3'-metoksibifenil-4-amīns tiek iegūts, 4-brom-2,6-difluoranilīnam reaģējot ar 3-metoksibifenilboronskābi.

3. Process saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā c) posms ietver c1) posmu, kurā b) posmā iegūtais 3,5-difluor-3'-metoksibifenil-4-amīna amīnija sāls reaģē ar 2-hlornikotīnskābi, vai c2) posmu, kurā, lai iegūtu 3,5-difluor-3'-metoksibifenil-4-amīnu, tiek hidrolizēts b) posmā iegūtais 3,5-difluor-3'-metoksibifenil-4-amīna amīnija sāls, un šādā veidā iegūtais 3,5-difluor-3'-metoksibifenil-4-amīns reaģē ar 2-hlornikotīnskābi.

4. Process saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā b) posmā amīnija sāls veidojas, samaisot minerālskābi vai organisku skābi ar 3,5-difluor-3'-metoksibifenil-4-amīna šķīdumu vai suspensiju, šķīdinātājā, kas tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no C₅-C₈ alkāniem, C₁-C₈ halogēnalkāniem, alkoholiem, esteriem un ēteriem, ūdens un to maisījumiem.

5. Process saskaņā ar 4. pretenziju, kur
- minerālskābe tiek izvēlēta no rindas, kas sastāv no bromūdeņražskābes, hlorūdeņražskābes, fluorūdeņražskābes, slāpekļskābes, fosforskābes, sērskābes un to maisījumiem; un/vai

- organiskā skābe tiek izvēlēta no rindas, kas sastāv no ciklāmskābes, etān-1,2-disulfonskābes, metānsulfonskābes, nāftalīn-1,5-disulfonskābes, naftalīn-2-sulfonskābes, tiociānskābes, skudrskābes, etiķskābes, *p*-toluolsulfonskābes, 4-hlorbenzolsulfonskābes, 4-brombenzolsulfonskābes un to maisījumiem; un/vai

- šķīdinātājs tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no pentāna, *n*-heksāna, *n*-heptāna, *n*-oktāna, hlormetāna, dihlormetāna, tetrahlormetāna, etanola, *n*-propanola, izopropanola, *n*-butanola, izobutanola, *sek*-butanola, *t*-butanola, *n*-pentanola, *terc*-pentilalkohola (*terc*-amilalkohola), etilēnglikola, propilēnglikola, dipropilēnglikola, glicerīna, dietilēnglikola monoetilētera, *n*-propilacetāta, izopropilacetāta, butilglikolacetāta, ūdens un to maisījumiem, labāk no *n*-heksāna, dihlormetāna, etilēnglikola, propilēnglikola, *n*-propilacetāta, izopropilacetāta, ūdens un to maisījumiem.

6. Process saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 5. pretenzijai, kur attiecība b) posma šķīdinātāja tilpumam pret a) posma 4-brom-2,6-difluoranilīna masu ir no 2:1 līdz 50:1, labāk no 5:1 līdz 25:1.

7. Process saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 6. pretenzijai, kur c1) vai c2) posms norit šķīdinātājā vai šķīdinātāju maisījumā.

8. Process saskaņā ar 7. pretenziju, kurā šķīdinātājs tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no etanola, *n*-propanola, izopropanola, *n*-butanola, izobutanola, *sek*-butanola, *t*-butanola, *n*-pentanola, *terc*-pentilalkohola (*terc*-amilalkohola), etilēnglikola, propilēnglikola, dipropilēnglikola, glicerīna, dietilēnglikola monoetilētera, tetrahidrofurāna, 1,4-dioksāna, 1,2-dioksāna, 1,3-dioksāna un to maisījumiem.

9. Process saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 8. pretenzijai, kurā c1) vai c2) posmā 4. vai 5. pretenzijā definētā minerālskābe vai 4. vai 5. pretenzijā definētā organiskā skābe tiek pievienota reakcijas maisījumam.

10. Process saskaņā ar 9. pretenziju, kur skābe tiek pievienota ūdens šķīduma veidā; un/vai kur šķīdinātāja un skābes tilpumu attiecība ir no 1:5 līdz 1:15, labāk no 1:2 līdz 1:10.

11. Process saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur šādus posmus:
a) 4-brom-2,6-difluoranilīna reakcija ar 3-metoksifenilborskābi, lai iegūtu 3,5-difluoro-3'-metoksibifenil-4-amīnu,

b) a) posmā iegūtā 3,5-difluoro-3'-metoksibifenil-4-amīna amīnija sāls veidošana un atdalīšana, samaisot skābi, kas izvēlēta no rindas, kas sastāv no hlorūdeņražskābes, slāpekļskābes, fosforskābes, sērskābes, *p*-toluolsulfonskābes un to maisījumiem, ar 3,5-difluoro-3'-metoksibifenil-4-amīna šķīdumu vai suspensiju, šķīdinātājā, kurš tiek izvēlēts no rindas, kas sastāv no *n*-heksāna, dihlormetāna, etilēnglikola, propilēnglikola, *n*-propilacetāta, izopropilacetāta un to maisījumiem, un

c1) b) posmā iegūtā 3,5-difluoro-3'-metoksibifenil-4-amīna amīnija sāls reakcija ar 2-hlornikotīnskābi.

12. Process saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 11. pretenzijai, kurā a) posms tiek katalizēts ar Pd/C katalizatoru.

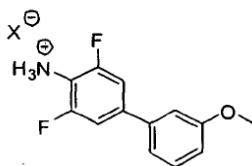
13. Process 2-[(3,5-difluoro-3'-metoksi-1,1'-bifenil-4-il)amino]nikotīnskābes ražošanai, kas satur šādus posmus:

i) 4-brom-2,6-difluoranilīna reakcija ar 3-metoksifenilboronskābi Pd/C katalizatoru klātbūtnē, lai iegūtu 3,5-difluoro-3'-metoksibifenil-4-amīnu, un

ii) i) posmā iegūtā 3,5-difluoro-3'-metoksibifenil-4-amīna papildu reakcija, lai iegūtu 2-[(3,5-difluoro-3'-metoksi-1,1'-bifenil-4-il)amino]nikotīnskābi.

14. Process saskaņā ar 13. pretenziju, kur ii) posms satur b) un c) posmus, kā definēts jebkurā no 1. un 3. līdz 12. pretenzijai.

15. Savienojums ar formulu (I):



(I)

kurā X⁻ ir minerālās vai organiskās skābes anjons.

(51) **A61K 38/01**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 38/03⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 38/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 9/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 11/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 17/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 25/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 31/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 37/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(11) **2489361**

(21) 12000663.0

(22) 02.06.2009

(43) 22.08.2012

(45) 16.04.2014

(31) PCT/EP2008/004341 (32) 30.05.2008 (33) WO

(62) EP09753692.4 / EP2296684

(73) Xigen Inflammation Ltd., Arch. Makariou III, 195 Neocleous House, 3030 Limassol, CY

(72) BONNY, Christophe, CH

(74) Graf von Stosch, Andreas, et al, Graf von Stosch Patent-anwalts-gesellschaft mbH, Prinzregentenstrasse 22, 80538 München, DE

Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga, LV-1010, LV

(54) **ŠŪNĀ IEKĻŪT SPĒJĪGU JNK SIGNĀLU TRANSDUKCIJAS CEĻA PEPTĪDU INHIBITORU IZMANTOŠANA DAŽĀDU SLIMĪBU ĀRSTĒŠANAI**
USE OF CELL-PERMEABLE PEPTIDE INHIBITORS OF THE JNK SIGNAL TRANSDUCTION PATHWAY FOR THE TREATMENT OF VARIOUS DISEASES

(57) 1. JNK inhibitora peptīds, kas sastāv no aminoskābju sekvences saskaņā ar SEQ ID NO: 2, vai himērs peptīds, kas sastāv no pirmā domēna un otrā domēna, kas ir saistīti ar kovalentu saiti, turklāt pirmais domēns satur transportsekvenci un otrais domēns sastāv no JNK inhibitora sekvences saskaņā ar SEQ ID NO: 2, turklāt pirmais domēns ir saistīts pie otrā domēna C-gala, izmantošanai neironālas vai neiroleģeneratīvas slimības, kas izvēlēta no distonijas, epilepsijas, redzes nerva saslimšanas, glaukomas, acs infekcijas, akstomijas, sāpēm, neiropatiskām sāpēm un vīrusu encefalopātijas, ārstēšanas metodē.

2. Himērais peptīds izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, turklāt pirmais un otrais domēns ir saistīti ar savienotāja sekvenci, kas satur 1 līdz 10 aminoskābes.

3. Himērais peptīds izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, turklāt transportsekvence satur cilvēka imūndeficīta vīrusa TAT polipeptīda aminoskābju sekvenci.

4. Himērais peptīds izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, turklāt transportsekvence sastāv no SEQ ID NO: 5, 6, 7, 8, 21 vai 22 aminoskābju sekvences vai satur to.

5. Himērais peptīds izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, turklāt transportsekvence pastiprina peptīda uzkrāšanos šūnās un/vai vada peptīda lokalizēšanu kodolā.

6. Himērais peptīds izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, turklāt himērais peptīds sastāv no SEQ ID NO: 11 aminoskābju sekvences.

7. JNK inhibitora peptīds izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju vai himērais peptīds saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt JNK inhibitora peptīds vai himērais peptīds ir jāievada, izmantojot ievadīšanas ceļu, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no parenterāliem ceļiem, ietverot intravenozo, intramuskulāro, subkutāno, intradermālo, transdermālo ceļu, enterāliem ceļiem, ietverot perorālo, rektālo ceļu, topiskiem ceļiem, ietverot ievadīšanu caur degunu, intranazālo ceļu, un citiem ceļiem, ietverot ievadīšanu caur epidermu vai ar plākstera palīdzību.

8. JNK inhibitora peptīds izmantošanai saskaņā ar 1. vai 7. pretenziju vai himērais peptīds saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, turklāt JNK inhibitora peptīda vai himēra peptīda deva (uz kg ķermeņa masas) ir robežās līdz 10 mmol/kg, labāk līdz 1 mmol/kg, vēl labāk līdz 100 μmol/kg, pat vēl labāk līdz 10 μmol/kg, pat vēl labāk līdz 1 μmol/kg, pat vēl labāk līdz 100 nmol/kg, vislabāk līdz 50 nmol/kg.

9. JNK inhibitora peptīds izmantošanai saskaņā ar 1., 7. vai 8. pretenziju vai himērais peptīds saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, turklāt JNK inhibitora peptīda vai himēra peptīda deva ir robežās no apmēram 1 μmol/kg līdz apmēram 1 mmol/kg, no apmēram 1 pmol/kg līdz apmēram 0,1 mmol/kg, no apmēram

10 pmol/kg līdz apmēram 0,01 mmol/kg, no apmēram 50 pmol/kg līdz apmēram 1 μmol/kg, no apmēram 100 pmol/kg līdz apmēram 500 nmol/kg, no apmēram 200 pmol/kg līdz apmēram 300 nmol/kg, no apmēram 300 pmol/kg līdz apmēram 100 nmol/kg, no apmēram 500 pmol/kg līdz apmēram 50 nmol/kg, no apmēram 750 pmol/kg līdz apmēram 30 nmol/kg, no apmēram 250 pmol/kg līdz apmēram 5 nmol/kg, no apmēram 1 nmol/kg līdz apmēram 10 nmol/kg vai jebkuru divu minēto vērtību kombinācija.

- (51) **A61K 9/127**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2490671**
 (21) 10772956.8 (22) 25.10.2010
 (43) 29.08.2012
 (45) 05.03.2014
 (31) 200901150 (32) 23.10.2009 (33) DK
 (86) PCT/DK2010/050283 25.10.2010
 (87) WO2011/047689 28.04.2011
 (73) Bio-Bedst APS, Dandyvej 19, 7100 Vejle, DK
 (72) MADSEN, Mogens Winkel, DK
 PETERSEN, Sune Allan, DK
 VIKBJERG, Anders Falk, DK
 (74) Orsnes, Henrik Egede, Orsnes Patent Forskerparken 10, 5230 Odense M, DK
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
 (54) **SPLA2 HIDROLIZĒJAMAS LIPOSOMAS AR UZLABOTU UZGLABĀŠANAS STABILITĀTI**
SPLA2 HYDROLYSABLE LIPOSOMES WITH IMPROVED STORAGE STABILITY
 (57) 1. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur sPLA2 hidrolizējamu liposomu, kas satur šajā liposomā iekapsulētu cisplatīnu, ārējo šķīdumu un liposomas iekšējo šķīdumu, kur starpība starp iekšējo un ārējo šķīdumu (ārējā osmolīta koncentrācija ir atņemta no iekšējā osmolīta koncentrācijas) osmolīta koncentrācijā ir vairāk nekā 200 mM.
 2. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur vienīgais terapeitiskais līdzeklis ir cisplatīns.
 3. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur starpība starp iekšējo un ārējo šķīdumu (ārējā osmolīta koncentrācija ir atņemta no iekšējā osmolīta koncentrācijas) osmolīta koncentrācijā ir no 200 līdz 600 mM.
 4. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur starpība starp iekšējo un ārējo šķīdumu (ārējā osmolīta koncentrācija ir atņemta no iekšējā osmolīta koncentrācijas) osmolīta koncentrācijā ir no 280 līdz 320 mM.
 5. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur starpība starp iekšējo un ārējo šķīdumu (ārējā osmolīta koncentrācija ir atņemta no iekšējā osmolīta koncentrācijas) osmolīta koncentrācijā ir vismaz 275 mM.
 6. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur iekšējais šķīdums satur NaCl vai KCl koncentrācijā no 0,2 līdz 2,5 % w/w.
 7. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur ārējais šķīdums satur NaCl vai KCl koncentrācijā no 0,2 līdz 2,5 % w/w.
 8. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur iekšējais un ārējais šķīdums ir izvēlēti no rindas, kas sastāv no:
 a. iekšējā šķīduma, kas satur no 0,8 līdz 1,0 % NaCl un no 9 līdz 11 % saharozes, un ārējā šķīduma, kas satur no 8 līdz 12 mM fosfāta buferšķīduma (pH 6,5) un no 9 līdz 11 % saharozes,
 b. iekšējā šķīduma no 1,6 līdz 2,0 % NaCl un ārējā šķīduma, kas satur no 8 līdz 12 mM fosfāta buferšķīduma (pH 6,5) un no 9 līdz 11 % saharozes,
 c. iekšējā šķīduma no 0,8 līdz 1,0 % NaCl un no 9 līdz 11 % saharozes un ārējā šķīduma, kas satur no 8 līdz 12 mM fosfāta buferšķīduma (pH 6,5) un no 0,35 % līdz 0,55 % NaCl, un no 4 līdz 6 % saharozes,
 d. iekšējā šķīduma no 1,6 līdz 2,0 % NaCl un ārējā šķīduma, kas satur no 8 līdz 12 mM fosfāta buferšķīduma (pH 6,5) un no 0,8 līdz 1,0 % NaCl.

- (51) **A61K 45/06**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2560631**
A61K 31/137⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/445⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/138⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/185⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/195⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/197⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/42⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/64⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 25/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 12708113.1 (22) 01.03.2012
 (43) 27.02.2013
 (45) 15.01.2014
 (31) 11305217 (32) 01.03.2011 (33) EP
 201161468658 P 29.03.2011 US
 11305687 06.06.2011 EP
 201161493606 P 06.06.2011 US
 (86) PCT/EP2012/053570 01.03.2012
 (87) WO2012/117076 07.09.2012
 (73) Pharmext, 11 Rue des Peupliers, 92130 Issy-les-Moulineaux, FR
 (72) COHEN, Daniel, FR
 CHUMAKOV, Ilya, FR
 NABIROCHKIN, Serguei, FR
 VIAL, Emmanuel, FR
 GUEDJ, Mickaël, FR
 (74) Becker, Philippe, et al, Cabinet Becker & Associés, 25, rue Louis le Grand, FR-75002 Paris, FR
 Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV
 (54) **UZ BAKLOFĒNA UN AKAMPROSĀTA BALSTĪTA NEIROLOĢISKU SLIMĪBU ĀRSTĒŠANA**
BACLOFEN AND ACAMPROSATE BASED THERAPY OF NEUROLOGICAL DISORDERS
 (57) 1. Kompozīcija, kas satur baklofēnu un akamprosātu vai to farmaceutiski pieņemamus sāļus, izmantošanai Alcheimera slimības vai radniecisku slimību, kas izvēlētas no AD tipa senilās demences (SDAT), Levi ķermenīšu demences, nelielas kognitīvas pavājināšanās (MCI) un atmiņas pavājināšanās vecuma dēļ (AAMI), ārstēšanai.
 2. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kura papildus ietver vismaz vienu papildu savienojumu, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no sulfisoksazola, metimazola, prilokaīna, difilīna, hinakrīna (kvinakrīna), karbenoksolona, aminokaprnskābes, kabergolīna, dietilkarbamazīna, cinakalceta, cinnarizīna, eplerenona, fenoldopama, leflunomīda, levosimendāna, sulodeksīda, terbinafīna, zonisamīda, etomidāta, fenformīna, trimetazīdīna, meksiletīna, ifenprodila, moksifloksacīna, bromkriptīna vai torasemīda vai to farmaceutiski pieņemamiem sāļiem.
 3. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas ietver vismaz:
 baklofēnu un akamprosātu,
 baklofēnu un akamprosātu, un dietilkarbamazīnu,
 baklofēnu un akamprosātu, un cinakalcetu,
 baklofēnu un akamprosātu, un sulfisoksazolu,
 baklofēnu un akamprosātu, un torasemīdu,
 baklofēnu un akamprosātu, un ifenprodilu,
 baklofēnu un akamprosātu, un meksiletīnu,
 baklofēnu un akamprosātu, un eplerenonu,
 baklofēnu un akamprosātu, un levosimendānu,
 baklofēnu un akamprosātu, un terbinafīnu vai baklofēnu un akamprosātu, un leflunomīdu, vai to farmaceutiski pieņemamus sāļus.
 4. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver vismaz:
 baklofēnu, akamprosātu un donepezilu,
 baklofēnu, akamprosātu un rivastigmīnu vai baklofēnu, akamprosātu un mementīnu, vai to farmaceutiski pieņemamus sāļus.
 5. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver baklofēnu un akamprosātu kā vienīgās aktīvās vielas.
 6. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, pie kam savienojumi ir sajaukti ar farmaceutiski pieņemamu nesēju vai palīgvielu.

7. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, pie kam savienojumus gatavo vai ievada kopā, atsevišķi vai secīgi.

8. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, pie kam savienojumus subjektam (cilvēkam) ievada atkārtoti.

9. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, pie kam attiecība akamprosāts/baklofēns (masa/masa) ir robežās no 0,05 līdz 1000.

10. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, pie kam baklofēna deva ir mazāka par 100 mg dienā.

11. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, pie kam akamprosāta deva ir mazāka par 1000 mg dienā.

12. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, pie kam tiek izmantots akamprosāta kalcija sāls.

13. Baklofēns vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kombinācijā ar vismaz akamprosātu vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli, lietošanai Alcheimera slimības vai radniecisku slimību, kas izvēlētas no AD tipa senīlās demences (SDAT), Levi ķermenīšu demences, nelieas kognitīvas pavājināšanās (MCI) un atmiņas pavājināšanās vecuma dēļ (AAMI), ārstēšanai.

14. Baklofēns vai tā farmaceutiski pieņemams sāls kombinācijā ar vismaz akamprosātu vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli, lietošanai, lai uzlabotu kognitīvos simptomus subjektam, kas cieš no Alcheimera slimības, kas ir ar noslieci uz to, vai ir aizdomas, ka tas cieš no Alcheimera slimības.

15. Baklofēns vai tā farmaceutiski pieņemams sāls kombinācijā ar vismaz akamprosātu vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli lietošanai nervu šūnu aizsardzībai pret amiloīda beta un/vai glutamāta toksicitāti subjektam, kas cieš no Alcheimera slimības, kas ir ar noslieci uz to, vai ir aizdomas, ka tas cieš no Alcheimera slimības.

16. Kompozīcija, kas satur baklofēnu, akamprosātu un donepizilu vai to farmaceutiski pieņemamus sāļus.

17. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 11. pretenziju, pie kam akamprosāta deva ir robežās no 1 līdz 400 mg dienā, vēlams - no 1 līdz 200 mg dienā.

18. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 17. pretenziju, pie kam akamprosāta deva ir robežās no 1 līdz 50 mg dienā.

- signāla kadra veidošanu, kas balstās uz preambulas datu simboliem un pēc frekvences kompresētajiem PLP datu simboliem datu sekcijā, pie tam preambulas datu simboli satur slāņa 1, resp. slāņa L1, signalizācijas informāciju, lai signalizētu par datu sekciju;

- pilotsignālu iestarpināšanu (iespraušanu) signāla kadrā;
- signāla kadra modulēšanu, kurā ir iestarpināti pilotsignāli, izmantojot frekvences ortogonālās dalīšanas un multipleksēšanas (Orthogonal Frequency Division Multiplexing, OFDM) metodi;
- aizsardzības intervāla iestarpināšanu iekšā modulētajā signāla kadrā un

- signāla pārraidīšanu, kurš ietver signāla kadru ar tajā iestarpinātu aizsardzības intervālu.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam slāņa L1 signalizācijas informācija satur datu sekcijas ID informāciju, kas identificē datu sekciju.

3. Paņēmiens saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam datu sekcijas ID informācijas garums ir 8 biti.

4. Paņēmiens saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam slāņa L1 signalizācijas informācija papildus satur PLP PAYLOAD TYPE informāciju, kas norāda komercslodzes tipu datiem, ko nes asociētais PLP.

5. Paņēmiens digitālo plašsaziņas videodatu signāla uztveršanai kabeļu sistēmā, pie kam paņēmiens satur:

- signāla uztveršanu, kas nes signāla kadru, un aizsardzības intervāla dzēšanu no uztvertā signāla;

- signāla demodulēšanu, kuram ir signāla kadrs un no kura ir izdzēsts aizsardzības intervāls, izmantojot frekvences ortogonālās dalīšanas un multipleksēšanas metodi, resp., OFDM metodi;

- pilotsignālu dzēšanu no signāla kadra demodulētajā signālā;
- signāla kadra iegūšanu, no kura ir izdzēsti pilotsignāli, no demodulētā signāla, pie tam: signāla kadrs satur preambulas signālus un vismaz vienu datu sekciju, kura ietver fizikālā slāņa (Physical Layer Pipe, PLP) datus no viena vai vairākiem PLP; preambulas simboli satur slāņa 1, resp., slāņa L1, signalizācijas informāciju, lai signalizētu par datu sekciju;

- PLP datu simbolu datu sekcijā dekompresēšanu pēc frekvences;

- pēc frekvences dekompresēto PLP datu simbolu datu sekcijā dekompresēšanu pēc laika;

- pēc frekvences dekompresēto PLP datu simbolu dekartēšanu PLP datu bitos un

- PLP datu dekodēšanu, izmantojot zema blīvuma pārības kontroles, resp. LDPC, dekodēšanas shēmu.

6. Paņēmiens saskaņā ar 5. pretenziju, pie kam slāņa L1 signalizācijas informācija satur datu sekcijas ID informāciju, kas identificē datu sekciju.

7. Paņēmiens saskaņā ar 6. pretenziju, pie kam datu sekcijas ID informācijas garums ir 8 biti.

8. Paņēmiens saskaņā ar 6. pretenziju, pie kam slāņa L1 signalizācijas informācija papildus satur PLP PAYLOAD TYPE informāciju, kas norāda komercslodzes tipu datiem, ko nes asociētais PLP.

9. Raidītājs digitālā plašsaziņas videosignāla pārraidīšanai kabeļu sistēmā uz uztvērēju, pie kam raidītājs satur:

- kodētāju (303), kas ir konfigurēts fizikālā slāņa (Physical Layer Pipe, PLP) datu bitu kodēšanai, izmantojot zema blīvuma pārības kontroles shēmu, resp., LDPC shēmu;

- pirmo kartētāju (306), kas ir konfigurēts preambulas datu bitu kartēšanai iekšā preambulas datu simbolos;

- otro kartētāju (306-1), kas ir konfigurēts kodēto PLP datu bitu kartēšanai iekšā PLP datu simbolos;

- datu sekcijas formētāju, kas ir konfigurēts, lai veidotu vismaz vienu datu sekciju, balstoties uz PLP datu simboliem, pie tam datu sekcija nes vienu vai vairākus PLP;

- kompresētāju pēc laika, kas ir konfigurēts PLP datu simbolu datu sekcijā kompresēšanai pēc laika;

- kompresētāju pēc frekvences (403), kas ir konfigurēts, lai kompresētu pēc frekvences iepriekš pēc laika kompresētos PLP datu simbolus datu sekcijā;

- kadra formētāju (103), kas ir konfigurēts signāla kadra veidošanai, balstoties uz preambulas datu simboliem un pēc frekvences kompresētajiem datu simboliem datu sekcijā, pie tam preambulas datu simboli satur slāņa 1, resp. slāņa L1, signalizācijas informāciju, lai signalizētu par datu sekciju;

- (51) **H04L 1/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2568644**
H04L 5/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 12195559.5 (22) 05.08.2009
(43) 13.03.2013
(45) 25.12.2013
(31) 114069 P (32) 13.11.2008 (33) US
(62) EP09167280.8 / EP2187556
(73) LG Electronics, Inc., 20, Yeouido-dong Yeoungdeungpo-gu, Seoul, 150-721, KR
(72) KO, Woo Suk, KR
MOON, Sang Chul, KR
(74) Cabinet Plasseraud, 52, rue de la Victoire, 75440 Paris Cedex 09, FR
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga, LV-1084, LV
- (54) **APARĀTS UN PAŅĒMIENS SIGNĀLU PĀRRAIDĪŠANAI UN UZTVERŠANAI**
APPARATUS FOR TRANSMITTING AND RECEIVING A SIGNAL AND METHOD OF TRANSMITTING AND RECEIVING A SIGNAL
- (57) 1. Paņēmiens digitālā plašsaziņas videosignāla pārraidīšanai kabeļu sistēmā uz uztvērēju, pie kam paņēmiens satur:
- fizikālā slāņa (Physical Layer Pipe, PLP) datu bitu kodēšanu, izmantojot zema blīvuma pārības kontroles (resp. LDPC) kodēšanas shēmu;
- preambulas datu bitu kartēšanu iekšā preambulas datu simbolos un kodēto PLP datu kartēšanu iekšā PLP datu simbolos;
- vismaz vienas datu sekcijas, kas balstās uz PLP datu simboliem, veidošanu, pie kam datu sekcija nes vienu vai vairākus PLP;
- PLP datu simbolu datu sekcijā kompresēšanu pēc laika;
- pēc laika kompresēto datu simbolu datu sekcijā kompresēšanu pēc frekvences;

- pilotsignālu iestarpinātāju (404), kas ir konfigurēts, lai iestarpinātu pilotsignālus iekšā signāla kadrā;

- modulatoru (104), kas ir konfigurēts, lai modulētu signāla kadru, kurā ir iestarpināti pilotsignāli, izmantojot frekvences ortogonālās dalīšanas un multipleksēšanas metodi, resp., OFDM metodi;

- aizsardzības intervāla iestarpinātāju (503), kas ir konfigurēts, lai iestarpinātu aizsardzības intervālu iekšā modulētajā signāla kadrā, un

- pārraidīšanas bloku, kas ir konfigurēts, lai pārraidītu signālu, kas ietver signāla kadru, kurā ir iestarpināts aizsardzības intervāls.

10. Raidītājs saskaņā ar 9. pretenziju, pie kam signalizācijas informācija satur datu sekcijas ID informāciju, kas identificē datu sekciju.

11. Raidītājs saskaņā ar 10. pretenziju, pie kam datu sekcijas ID informācijas garums ir 8 biti.

12. Raidītājs saskaņā ar 10. pretenziju, pie kam slāņa L1 signalizācijas informācija papildus satur PLP PAYLOAD TYPE informāciju, kas norāda komercslodzes tipu datiem, ko nes asociētais PLP.

13. Uztvērējs digitālā plašsaziņas videosignāla uztveršanai kabeļu sistēmā, pie kam uztvērējs satur:

- aizsardzības intervāla likvidēšanas moduli (r503), kas ir konfigurēts, lai uztvertu signālu, kas nes signāla kadru, un dzēstu aizsardzības intervālu no uztvertā signāla;

- demodulatoru (r104), kas ir konfigurēts, lai demodulētu signālu, kurš satur signāla kadru, no kura ir izdzēsts aizsardzības intervāls, izmantojot frekvences ortogonālās dalīšanas un multipleksēšanas metodi, resp., OFDM metodi;

- pilotsignāla likvidēšanas moduli (r404), kas ir konfigurēts, lai izdzēstu pilotsignālus no signāla kadra demodulētajā signālā;

- kadra parsētāju (r103), kas ir konfigurēts, lai iegūtu signāla kadru, no kura ir izdzēsti pilotsignāli, no demodulētā signāla, pie tam: signāla kadrs satur preambulas simbolus un vismaz vienu datu sekciju, kura ietver fizikālā slāņa (Physical Layer Pipe, PLP) datu simbolus no viena vai vairākiem PLP; preambulas simboli satur slāņa 1, resp., slāņa L1, signalizācijas informāciju, lai signalizētu par datu sekciju;

- frekvences dekompresētāju (r403), kas ir konfigurēts, lai dekompresētu pēc frekvences PLP datu simbolus datu sekcijā;

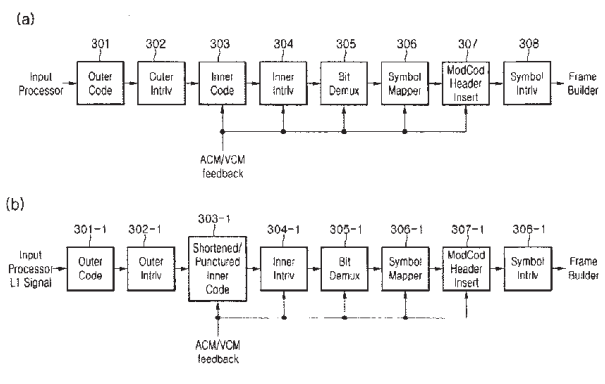
- laika dekompresētāju, kas ir konfigurēts, lai dekompresētu pēc laika iepriekš pēc frekvences dekompresētos PLP datu simbolus datu sekcijā;

- dekartētāju (r306), kas ir konfigurēts, lai dekartētu pēc frekvences dekompresētos datu simbolus iekšā PLP datu bitos, un

- dekoderi (r102), kas ir konfigurēts, lai dekodētu PLP datu bitus, izmantojot zema blīvuma pāriības kontroles, resp. LDPC, dekodēšanas shēmu.

14. Uztvērējs saskaņā ar 13. pretenziju, pie kam slāņa L1 signalizācijas informācija satur sekcijas ID informāciju, kas identificē datu sekciju.

15. Uztvērējs saskaņā ar 14. pretenziju, pie kam datu sekcijas ID informācijas garums ir 8 biti.



- (51) C07D 213/70⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) 2585437
 C07D 401/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 C07D 241/18⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 A61K 31/44⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 A61K 31/444⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 31/4965⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 9/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 9/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61P 19/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

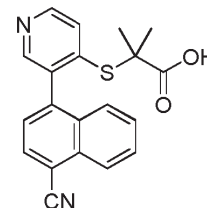
C07D 403/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 405/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

C07D 239/38⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

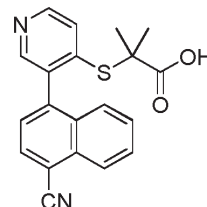
C07D 417/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

- (21) 11796396.7 (22) 15.06.2011
 (43) 01.05.2013
 (45) 12.02.2014
 (31) 355491 P (32) 16.06.2010 (33) US
 (86) PCT/US2011/040585 15.06.2011
 (87) WO2011/159839 22.12.2011
 (73) Ardea Biosciences, Inc., 4939 Directors Place, San Diego, CA 92121, US
 (72) OUK, Samedy, US
 GUNIC, Esmir, US
 VERNIER, Jean-Michel, US
 (74) Cole, William Gwyn, et al, avidity IP, Kestrel House, Falconry Court, Baker's Lane, Epping, Essex CM16 5DQ, GB
 Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga, LV-1050, LV
 (54) **THIOACETĀTA SAVIENOJUMI, KOMPOZĪCIJAS UN IZMANTOŠANAS PAŅĒMIENI**
THIOACETATE COMPOSITIONS, COMPOSITIONS AND METHODS OF USE
 (57) 1. Savienojums ar formulu:



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls vai solvāts.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir:



3. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai terapijā.
 4. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai urīnskābes līmeņa asins serumā pazemināšanai cilvēkam.
 5. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai hiperurikēmijas ārstēšanā cilvēkam.
 6. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai hiperurikēmijas ārstēšanā cilvēkam ar podagru.
 7. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai podagras ārstēšanā cilvēkam.
 8. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai stāvokļa ārstēšanai vai novēršanai, kas raksturīgs ar urīnskābes anormālu līmeni audos vai orgānos indivīdam.
 9. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai saskaņā ar 8. pretenziju, kur stāvoklis ir podagra, atkārtotas lēkmes podagra, podagras artrīts, hiperurikēmija, hipertensija, sirds un asinsvadu slimība, koronārā sirds slimība, Leša-Naihana (*Lesch-Nyhan*) sindroms, Kelija-Zigmillera (*Kelley-Seegmiller*) sindroms, nieru slimība, nierakmeņi, nieru mazspēja, locītavu iekaisums, artrīts, urīnkaņņu slimība, saindēšanās ar svīnu, hiperparatireoīdisms, psoriāze, sarkoidoze, hipoksantīn-guanīn-fosforiboziltransferāzes (HPRT) trūkums vai to kombinācijas.
 10. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 9. pretenzijai kombinācijā ar ksanīnoksidāzes inhibitoru.

11. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai saskaņā ar 10. pretenziju, kur ksantīnoksidāzes inhibitors ir alopurinols.

12. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai saskaņā ar 10. pretenziju, kur ksantīnoksidāzes inhibitors ir febeksostāts.

13. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

14. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 13. pretenziju, kas papildus satur ksantīnoksidāzes inhibitoru.

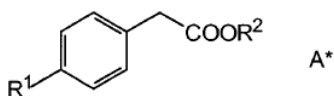
15. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 14. pretenziju, kur ksantīnoksidāzes inhibitors ir alopurinols vai febeksostāts.

- (51) **C07D 417/12**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2598501**
A61K 31/4402⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 31/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 31/22⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 12762300.7 (22) 26.09.2012
(43) 05.06.2013
(45) 12.03.2014
(31) 11007823 (32) 26.09.2011 (33) EP
(86) PCT/EP2012/068938 26.09.2012
(87) WO2013/045479 04.04.2013
(73) AiCuris GmbH & Co. KG, Friedrich-Ebert-Strasse 475, 42117 Wuppertal, DE
(72) SCHWAB, Wilfried, DE
BIRKMANN, Alexander, DE
VÖGTLI, Kurt, CH
HAAG, Dieter, CH
LENDER, Andreas, DE
GRUNENBERG, Alfons, DE
KEIL, Birgit, DE
REHSE, Joachim, DE
(74) Arth, Hans-Lothar, ABK Patent Attorneys Jasminweg 9, 14052 Berlin, DE
Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
(54) **N-[5-(AMINOSULFONIL)-4-METIL-1,3-TIAZOL-2-IL]-N-METIL-2-[4-(2-PIRIDINIL)FENIL]JACETAMĪDA MEZILĀTA MONOHIDRĀTS**
N-[5-(AMINOSULFONYL)-4-METHYL-1,3-THIAZOL-2-YL]-N-METHYL-2-[4-(2-PYRIDINYL)PHENYL]JACETAMIDE MESYLATE MONOHYDRATE

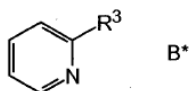
(57) 1. Metode N-[5-(aminosulfonil)-4-metil-1,3-tiazol-2-il]-N-metil-2-[4-(2-piridinil)fenil]acetamīda sintēzei saskaņā ar sekojošām stadijām:

stadija A:

savienojums A ar sekojošu vispārīgu formulu A*



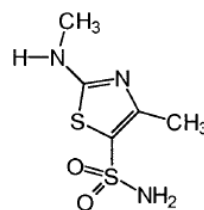
raksturīgs ar to, ka R¹ pārstāv aizejošo grupu un R² ir alkilatlikums ar 1-6 oglekļa atomiem vai cikloalkilatlikums ar 3-6 oglekļa atomiem, reaģē ar boronskābes atvasinājumu, borolānu, borinānu vai diboronskābes reaģentu, ar R¹-H vai R¹-B(OR)₂ atšķelšanu un boronskābes atvasinājuma starpsavienojuma ar A veidošanos, raksturīga ar to, ka boronskābes starpsavienojums tad reaģē ar piridīna savienojumu B ar sekojošu vispārēju formulu B*



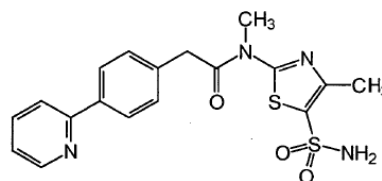
raksturīgu ar to, ka R³ pārstāv aizejošo grupu bāziskos apstākļos, lai iegūtu tieši (4-piridin-2-ilfenil)etiķskābi, kuru pēc tam attīra.

Stadija B:

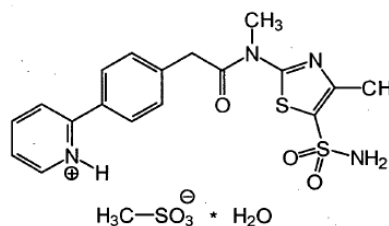
(4-piridin-2-ilfenil)etiķskābe, kas iegūta stadijā A, reaģē ar 4-metil-2-(metilamino)-1,3-tiazol-5-sulfonamīdu



lai iegūtu N-(5-aminosulfonil)-4-metil-1,3-tiazol-2-il]-N-metil-2-[4-(2-piridinil)fenil]acetamīdu ar formulu

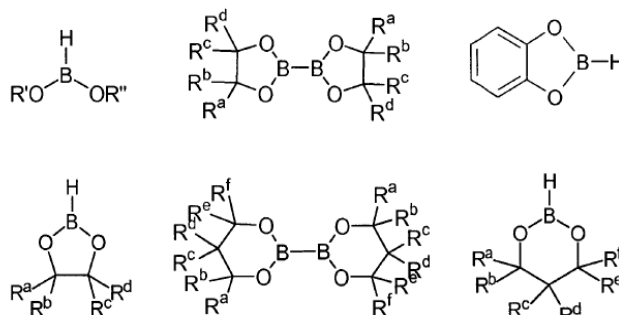


2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, ietverot papildu stadiju C: N-[5-(aminosulfonil)-4-metil-1,3-tiazol-2-il]-N-metil-2-[4-(2-piridinil)fenil]acetamīds kopā ar metānsulfonskābi organiska šķīdinātāja un ūdens maisījumā tiek pārvērst kristāliskā N-[5-(aminosulfonil)-4-metil-1,3-tiazol-2-il]-N-metil-2-[4-(2-piridinil)fenil]acetamīda metānsulfonskābes monohidrātā ar formulu



3. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīga ar to, ka R¹ un R² neatkarīgi viens no otra tiek izvēlēti no -F, -Cl, -Br, -I, -OMs, -OTf un -OTs.

4. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīga ar to, ka boronskābes atvasinājums, borolāns, borināns vai diboronskābes reaģents ir izvēlēts no:



raksturīgi ar to, ka R¹, R², R^a, R^b, R^c, R^d, R^e un R^f neatkarīgi viens no otra ir aizvietota vai neaizvietota, lineāra vai sazaroata alkilgrupa ar 1-10 oglekļa atomiem vai cikloalkilgrupa ar 3-10 oglekļa atomiem.

5. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīga ar to, ka boronskābes atvasinājuma vai borolāna reaģenta kā starpsavienojuma iegūšanai tiek lietoti reaģenti – pallādija acetāts, trietilamīns un trifenilfosfīns vai PdCl₂(PPh₃)₂ un trietilamīns.

6. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, raksturīga ar to, ka stadiju B veic ar kondensējošo aģentu EDC x HCl šķīdinātāju maisījumā THF/NMP.

7. Metode saskaņā ar 2. pretenziju, raksturīga ar to, ka N-[5-(aminosulfonil)-4-metil-1,3-tiazol-2-il]-N-metil-2-[4-(2-piridinil)fenil]acetamīda maisījums organiskā šķīdinātājā un ūdenī veido pārsātinātu šķīdumu, ja paaugstinātā temperatūrā tiek pievienota metānsulfonskābe, un no maisījuma pēc paildzinātas maisīšanas,

aizmetņu kristālu pievienošanas vai dzesēšanas kristalizējas N-[5-(aminosulfonil)-4-metil-1,3-tiazol-2-il]-N-metil-2-[4-(2-piridinil)fenil]acetamīda metānsulfonskābes monohidrāts.

8. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kura papildus ietver stadiju D: N-[5-(aminosulfonil)-4-metil-1,3-tiazol-2-il]-N-metil-2-[4-(2-piridinil)fenil]acetamīda metānsulfonskābes monohidrāta farmaceitiskas kompozīcijas iegūšana ar vismaz vienu farmaceitiski pieņemamu nesēju, palīgvielu, šķīdinātāju un/vai atšķaidītāju.

Latvijā apstiprināto Eiropas patentu publikācijas

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

- (51) **A61K 9/20**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1781260**
A61K 9/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/428⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/4745⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 05777774.0 (22) 25.07.2005
(43) 09.05.2007
(45) 03.11.2010
(45) 02.04.2014 (publikācija pēc iebilduma)
(31) 04019248 (32) 13.08.2004 (33) EP
(86) PCT/EP2005/053602 25.07.2005
(87) WO2006/015942 16.02.2006
(73) Boehringer Ingelheim International GmbH, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE
(72) FRIEDL, Thomas, DE
EISENREICH, Wolfram, DE
(74) HOFFMANN EITLÉ, et al, Patent- und Rechtsanwälté, Arabellastrasse 4, 81925 München, DE
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, Raiņa bulv. 19, Rīga, LV-1159, LV
- (54) **PRAMIPEKSOLU VAI TĀ FARMACEITISKI PIENĒMAMU SĀLI SATUROŠA ILGSTOŠAS DARBĪBAS TABLETE, TĀS IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS UN PIELIETOJUMS EXTENDED RELEASE TABLET FORMULATION CONTAINING PRAMIPEXOLE OR A PHARMACEUTICALLY ACCEPTABLE SALT THEREOF, METHOD FOR MANUFACTURING THE SAME AND USE THEREOF**
- (57) 1. Ilgstošas darbības tabletes sastāvs, kas satur pramipeksolu vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli matricē, kura satur vismaz divus ūdenī uzbriestošus polimērus, kas nav želatinizēta ciete, un kurā vismaz viens no vismaz diviem polimēriem ir anjonisks polimērs.
2. Ilgstošas darbības tabletes sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju, kurā anjoniskais polimērs ir izvēlēts no rindas: neobligāti šķērssašūti akrilskābes polimēri, metakrilskābes polimēri, algināti un karboksimetilceluloze.
3. Ilgstošas darbības tabletes sastāvs saskaņā ar 2. pretenziju, kurā anjoniskais polimērs neobligāti ir šķērssašūts akrilskābes polimērs un kurā šķērssašūtais akrilskābes polimēra saturs matricē neobligāti ir apmēram no 0,25 masas % līdz 25 masas % no kompozīcijas masas, labāk apmēram no 0,5 masas % līdz 15 masas % no kompozīcijas masas, bet vēl labāk apmēram no 1 masas % līdz 10 masas % no kompozīcijas masas.
4. Ilgstošas darbības tabletes sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju, kurā vismaz viens no vismaz diviem polimēriem ir būtībā neitrāls polimērs, kas nav želatinizēta ciete.
5. Ilgstošas darbības tabletes sastāvs saskaņā ar 4. pretenziju, kurā būtībā neitrālais polimērs ir izvēlēts no hidroksipropilcelulozes un hidroksipropilmetilcelulozes.
6. Ilgstošas darbības tabletes sastāvs saskaņā ar 4. pretenziju, kurā būtībā neitrālais polimērs ir hidroksipropilmetilceluloze un kurā hidroksipropilmetilcelulozes saturs matricē ir apmēram no 10 masas % līdz 75 masas % no kompozīcijas masas, labāk – apmēram no 25 masas % līdz 65 masas % no kompozīcijas masas.
7. Ilgstošas darbības tabletes sastāvs saskaņā ar 4. pretenziju, kurā matricē satur apmēram:
- | | |
|---|-------------------------|
| (a) pramipeksolu vai tā sāli | no 0,05 līdz 5 masas % |
| (b) anjonisku(-us) ūdenī uzbriestošu(-us) polimēru(-us) | no 0,25 līdz 25 masas % |
| (c) neitrālu(-us) ūdenī uzbriestošu(-us) polimēru(-us) | no 10 līdz 75 masas % |
| (d) palīgvielas, kas tiek pievienotas tādā daudzumā, lai kompozīcijas masas kopējais apjoms atbilstu 100 %. | |
8. Ilgstošas darbības tabletes sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur pramipeksola dihidrochlorīda monohidrātu, hipromelo-

zi 2208, graudu cieti, karbomēru 941, koloidālā silikona dioksīdu un magnija stearātu.

9. Ilgstošas darbības tabletes sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur vismaz vienu ūdenī uzbriestošu polimēru, kas nav želatinizēta ciete, ūdenī uzbriestošu anjonisku polimēru un neobligāti palīgvielas, turklāt iegūtā tablete nodrošina no pH atkarīgu darbības raksturojumu ar ātrāku darbību pie pH < 4,5 un lēnāku, no pH neatkarīgu darbības raksturojumu pie pH robežās no 4,5 līdz 7.

10. Ilgstošas darbības tabletes sastāvs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā pramipeksola vai tā farmaceutiski pieņemama sāls daudzums ir pietiekams, lai nodrošinātu dienas devas ievadīšanu vienā reizē.

11. Ilgstošas darbības tabletes sastāva saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai iegūšanas paņēmieni tiešā presēšanas procesā, kas satur šādus soļus:

- (1) aktīvās vielas sabēršana pulverī, kurā aktīvā viela ir pramipeksols vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, to iepriekš maisītājā sajaucot ar daļu no ūdenī uzbriestoša(-iem) polimēra(-iem) un/vai ar palīgvielu(-ām), turklāt pramipeksols vai tā farmaceutiski pieņemamais sāls pirms tam tiek samalts, labāk – sabērztis;
- (2) solī (1) iegūtās pulverī sabērztās aktīvās vielas piemaisīšana maisītājā ūdenī uzbriestoša(-u) polimēra(-u) galvenajai daļai un/vai palīgvielām, lai iegūtu to priekšmaisījumu;
- (3) priekšmaisījuma neobligāta sausa sijāšana ar sietu, lai atdalītu saistīties spējīgās daļiņas un paaugstinātu satura viendabīgumu;
- (4) solī (2) vai (3) iegūtā priekšmaisījuma samaisīšana maisītājā, neobligāti maisījumam pievienojot pārējās palīgvielas un turpinot maisīšanu, un
- (5) gala maisījuma tablelēšana, to sapresējot piemērotā tablešu presē, lai iegūtu matricē tabletes.

12. Ilgstošas darbības tabletes sastāva saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai iegūšanas paņēmieni mitrā granulēšanas procesā, kas satur šādus soļus:

- (1) pulverī sabērztas aktīvās vielas iegūšana, kurā aktīvā viela ir pramipeksols vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, to maisītājā sajaucot ar daļu palīgvielu, turklāt pramipeksols vai tā farmaceutiski pieņemamais sāls pirms tam tiek samalts, labāk – sabērztis;
- (2) solī (1) iegūtās pulverī sabērztās aktīvās vielas granulēšana, pievienojot granulēšanas šķidrums, labāk – ūdeni;
- (3) solī (2) iegūto granulu žāvēšana tvaika katlā ar verdoša slāņa kurtuvi vai žāvēšanas krāsnī;
- (4) solī (3) iegūto granulu samaisīšana maisītājā ar ūdenī uzbriestošu(-iem) polimēru(-iem) un/vai palīgvielām, lai iegūtu gala maisījumu;
- (5) solī (4) iegūtā gala maisījuma tablelēšana, to sapresējot piemērotā tablešu presē, lai iegūtu matricē tabletes.

13. Ilgstošas darbības tabletes sastāvs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai iegūšanas paņēmieni sausā granulēšanas procesā, kas satur šādus soļus:

- (1) aktīvās vielas pramipeksola vai tā farmaceutiski pieņemama sāls samaisīšana maisītājā vai nu ar daļu pildvielu, vai visām palīgvielām, turklāt pramipeksols vai tā farmaceutiski pieņemamais sāls pirms tam tiek samalts, labāk – sabērztis;
- (2) solī (1) iegūtā maisījuma saspiešana ar piemērotu presēšanas veltņi;
- (3) solī (1) iegūto lenšu sasmalcināšana nelielās granulās piemērotā samalšanas vai sijāšanas solī;
- (4) solī (3) iegūto granulu neobligāta samaisīšana maisītājā ar pārējām palīgvielām, lai iegūtu gala maisījumu;
- (5) solī (3) iegūto granulu vai solī (4) iegūtā gala maisījuma tablelēšana, to sapresējot piemērotā tablešu presē, lai iegūtu matricē tabletes.

14. Ilgstošas darbības tabletes sastāva saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai pielietojums ārstnieciskas kompozīcijas iegūšanai Pārkinsona slimības un tās komplikāciju vai ar to saistīto traucējumu ārstēšanai.

- (51) **H02G 3/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1973209**
(21) 07005979.5 (22) 22.03.2007
(43) 24.09.2008
(45) 25.01.2012
(45) 04.06.2014 (publikācija pēc iebilduma)

(73) Waldner Labor- und Schuleinrichtungen GmbH, Buchenstraße 12, 01097 Dresden, DE

(72) KEIBACH, Dieter, DE

(74) Kotitschke & Heurung Partnerschaft mbB, Eduard-Schmid-Str. 2, 81541 München, DE
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Tpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV

(54) **ENERGOPADEVES IEKĀRTA
DEVICE FOR SUPPLYING MEDIA**

(57) 1. Energopadeves iekārta vienas vai vairāku darbavietu (29) apgādei ar energoresursiem, kas satur energopadeves līnijas, kuras ir apgādātas ar atzarojumiem uz darbavietām (29), pie kam iekārtai ir moduļveida konstrukcija, kura sastāv no atsevišķiem elementiem, kas ir izveidoti tādā veidā, ka tos var samontēt pēc nepieciešamības, kas ir raksturīga ar to, ka iekārta satur savienojuma kanālus (3), kas ir izveidoti kā instalācijas kanāli un/vai gaisa izplūdes caurules (30), kuras ir paredzētas gāzes un ūdeni saturošai videi, turklāt instalācijas kanāli (10), kuri ir paredzēti gāzes un ūdeni saturošai videi, ir apgādāti ar savienojuma kanāliem (3).

2. Iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka atsevišķie elementi ir izveidoti tādā veidā, ka tie ir samontējami bez instrumentu izmantošanas.

3. Iekārta saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tai ir pamatelements papildu elementu pievienošanai.

4. Iekārta saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka pamatelementam ir kanālveida forma.

5. Iekārta saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka energopadeves līnijas ir instalētas pamatelementā.

6. Iekārta saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tai ir elektrobarošanas kopņu uztvērēji.

7. Iekārta saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tai ir atdalītie tiltiņi, lai atdalītu dažādas energopadeves līnijas.

8. Iekārta saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tai ir rullīša virzīšanas rievas, lai pievienotu horizontāli pārvietojamus akumulēšanas līmeņus.

9. Iekārta saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tai ir ierīces papildu elementu pievienošanai.

10. Iekārta saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka pamatelements ir apgādāts ar ierīcēm pie griestiem piekarināmu ietaišu pievienošanai.

11. Iekārta saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka elementi, kas ir izveidoti kā instalācijas kanāli un/vai gaisa izplūdes caurules, var tikt piestiprinātas pie pamatelementa.

12. Iekārta saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka salāgošanas profilam ir energopadeves līnijas, kuras var tikt piestiprinātas pie pamatelementa.

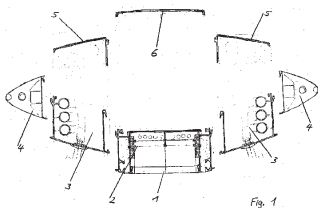
13. Iekārta saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka tai ir papildelements, kurā ir ievietoti apgaismes elementi.

14. Iekārta saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka tā ir konstruēta novietošanai pie telpas sienas vai energopadeves modulī.

15. Iekārta saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka tā satur vismaz vienu kanālveida elementu, kurā ir ievietots energopadeves līniju salāgošanas profils.

16. Iekārta saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka tā ir konstruēta tādā veidā, lai atbilstu darbavietas iekārtojumam izvīrtajām prasībām.

17. Iekārta saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka tā ir dimensionēta tādējādi, ka plešas pāri vairākām telpām.



Pieteikumi papildu aizsardzības sertifikātiem

(Eiropas Parlamenta un Padomes regulas (EK) Nr. 469/2009 (06.05.2009) par papildu aizsardzības sertifikātu zālēm 9. pants; un Eiropas Parlamenta un Padomes regulas (EK) Nr. 1610/96 (23.06.1996) par papildu aizsardzības sertifikāta ieviešanu attiecībā uz augu aizsardzības līdzekļiem 9. pants). Pieteikuma numurā „z” nozīmē zāles, bet „a” – augu aizsardzības līdzekli.

- (21) **C/LV2014/0020/z** (22) **16.06.2014**
 (54) Policikliskais karbamoilpiridona atvasinājums ar HIV integrāzes inhibitora iedarbību
 (71) VIIV HEALTHCARE COMPANY, Research Triangle Park, NC 27709, US;
 SHIONOGI & CO., Ltd., Osaka 541-0045, JP
 (74) Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
 (92) EU/1/13/892/001-002, 16.01.2014
 (93) EU/1/13/892/001-002, 16.01.2014
 (95) Dolutegravirs (TIVICAY)
 (96) 06758843.4, 28.04.2006
 (97) EP1874117, 28.08.2013

- (21) **C/LV2014/0021/z** (22) **19.06.2014**
 (54) Ārstniecisku vielu ievadīšanas kombinācijas un režīmi, un kombinācijas terapija
 (71) ABRAXIS BIOSCIENCE, LLC, 11755 Wilshire Boulevard/ Suite 2100, Los Angeles CA 90025, US
 (74) Jevgeņija GAINUTDINOVA, Juridiskā firma METIDA, Tomsona iela 24-15, Rīga, LV-1013, LV
 (92) EU/1/07/428/001-002, 20.12.2013
 (93) EU/1/07/428/001-002, 20.12.2013
 (95) Paklitaksels (ABRAXANE)
 (96) 06735710.3, 21.02.2006
 (97) EP1853250, 02.11.2011

- (21) **C/LV2014/0022/z** (22) **27.06.2014**
 (54) Kompozīcijas un to izmantošana multiplās sklerozes ārstēšanā
 (71) BIOGEN IDEC MA INC., 14 Cambridge Center, Cambridge, Massachusetts 02142, US
 (74) Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
 (92) EU/1/13/837/001-002, 30.01.2014
 (93) EU/1/13/837/001-002, 30.01.2014
 (95) Dimetilfumarāts (TECFIDERA)
 (96) 08725256.5, 02.07.2008
 (97) EP2137537, 29.05.2013

- (21) **C/LV2014/0023/z** (22) **27.06.2014**
 (54) Dialkilmumarāti autoimūno slimību ārstēšanai
 (71) BIOGEN IDEC INTERNATIONAL GmbH, Landis+Gyr-Strasse 3, 6300 Zug, CH
 (74) Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
 (92) EU/1/13/837/001-002, 30.01.2014
 (93) EU/1/13/837/001-002, 30.01.2014
 (95) Dimetilfumarāts (TECFIDERA)
 (96) 99972532.8, 29.10.1999
 (97) EP1131065, 06.11.2003

- (21) **C/LV2014/0024/z** (22) **03.07.2014**
 (54) Izoksazolīni bezmugurkaulnieku tipa kaitēkļu apkarošanai
 (71) E.I.DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY, 1007 Market Street, Wilmington, DE 19898, US
 (74) Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
 (92) EU/2/13/159/001-012, 11.02.2014
 (93) EU/2/13/159/001-012, 11.02.2014
 (95) Afoksilaners (NEXGARD)
 (96) 06848263.7, 28.12.2006
 (97) EP1973888, 26.01.2011

- (21) **C/LV2014/0025/z** (22) **10.07.2014**
 (54) C-arilglikozīdu SGLT2 inhibitori un metode
 (71) AstraZeneca AB, SE-15185 Sodertelje, SE
 (74) Vladimirs ANOHINS, Aģentūra TRIA ROBIT, Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
 (92) EU/1/13/900, 16.01.2014
 (93) EU/1/13/900, 16.01.2014
 (95) Dapagliflozīna un metformīna kombinācija (XIGDUO)
 (96) 03736643.2, 15.05.2003
 (97) EP1506211, 07.02.2007

Papildu aizsardzības sertifikāti

(Eiropas Parlamenta un Padomes regulas (EK) Nr. 469/2009 (06.05.2009) par papildu aizsardzības sertifikātu zālēm 11. panta pirmā daļa; un Eiropas Parlamenta un Padomes regulas (EK) Nr. 1610/96 (23.06.1996) par papildu aizsardzības sertifikāta ieviešanu attiecībā uz augu aizsardzības līdzekļiem 11. pants). Sertifikāta numurā „z” nozīmē zāles, bet „a” – augu aizsardzības līdzekli.

- | | |
|---|------------------------|
| (21) C/LV2014/0010/z | (22) 06.03.2014 |
| (54) Jauni medikamenti hronisku obstruktīvu plaušu slimību ārstēšanai | |
| (73) BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA GmbH&CO.KG,
55216 Ingelheim am Rhein, DE | |
| (74) Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga, LV-1050, LV | |
| (92) LV 13-0232, | 06.11.2013 |
| (93) EEZ-MT MA211/00401, | 18.09.2013 |
| (94) 18.09.2028 | |
| (95) Olodaterols, tā pievienotas skābes sāls ar farmaceitiski pieņemamu skābi, īpaši olodaterola hidrohlorīds (STRIVERDI) | |
| (96) 03778312.3, | 11.11.2003 |
| (97) EP1562603, | 06.05.2009 |
-

Pieteicēju, izgudrotāju un īpašnieku alfabētiskais rādītājs

(71) Pieteicējs (72) Izgudrotājs (73) Īpašnieks	(21) Pieteikuma numurs	(51) Klase	(71) Pieteicējs (72) Izgudrotājs (73) Īpašnieks	(21) Pieteikuma numurs	(51) Klase	(71) Pieteicējs (72) Izgudrotājs (73) Īpašnieks	(21) Pieteikuma numurs	(51) Klase
Izgdrojumu pieteikumu publikācijas			RĪGAS TEHNISKĀ UNIVERSITĀTE - ROZENBERGA, Santa - RUCIŅŠ, Mārtiņš			Izgdrojumu patentu publikācijas		
A			S			A		
AMERIĶS, Uldis	P-14-41	E02B11/00	SALENIECE, Kristīne	P-13-16	C12P19/34	AUZIŅŠ, Pēteris	P-12-137	B28B1/08
B			SKRUPSKIS, Imants	P-13-223	A23L3/44	B		
BĒRZIŅŠ, Andrejs	P-13-16	C12P19/34	SOČNEVS, Artūrs	P-14-33	G01N33/50	BOROVĪKA, Diāna	P-12-172	C07D495/04
BLIJA, Anita	P-13-223	A23L3/44	STOČKA, Emīls	P-13-223	A23L3/44	-	-	C07D333/38
C			STŪRE, Gunta	P-14-33	G01N33/50	-	-	A61K31/55
CINKMANIS, Ingmārs	P-13-226	C12C7/053	Š			BRINKS, Jānis	P-14-25	C10L1/02
Č			ŠĀKUNS, Sergejs	P-14-41	E02B11/00	-	-	C09F7/10
ČĀKSTE, Ilze	P-13-226	C12C7/053	ŠNEPS-ŠNEPE, Manfreds Leontijs	P-13-13	G01K17/00	BUTIKOVA, Jeļena	P-13-179	H01L31/02
D			T			-	-	H01L31/04
DONIŅA, Simona	P-14-35	G01N33/52	TETERE, Zenta	P-14-52	C07D319/04	Č		
E			-	-	A61P17/18	ČERNOBROVIJS, Aleksandrs	P-12-172	C07D495/04
EGLĪTE, Jeļena	P-14-33	G01N33/50	V			-	-	C07D333/38
F			VĪKSNA, Ludmila	P-14-33	G01N33/50	-	-	A61K31/55
FELDMANE, Guna	P-13-16	C12P19/34	VUCĀNE, Sanita	P-13-226	C12C7/053	D		
FELDMANIS, Roberts	P-13-16	C12P19/34	Z			DABARE, Līga	P-14-28	C04B38/00
FOKINS, Vladimirs	P-14-34	A61B17/34	ZĒBERGA, Sindija	P-14-52	C07D319/04	DIRBA, Jānis	P-14-38	H02K19/10
J			-	-	A61P17/18	-	-	H02K7/09
JAKOVIČS, Andris	P-13-17	E04C1/41	ZICĀNE, Daina	P-14-52	C07D319/04	DREMAKOVŠ, Vladislavs	P-12-180	F25B21/02
JASINSKIS, Vladislavs	P-14-33	G01N33/50	-	-	A61P17/18	-	-	F25B27/00
JURE, Māra	P-14-52	C07D319/04	F			-	-	H01H35/30
-	-	A61P17/18	FIZIKĀLĀS ENERĢĒTIKAS INSTITŪTS			-	-	
K			-	-	C07D319/04	P-14-38	H02K19/10	
KASJKO, Diana	P-14-33	G01N33/50	G			-	-	H02K7/09
KĻAVIŅŠ, Jānis	P-13-17	E04C1/41	GINOVKERS, Marks	P-12-180	F25B21/02	H		
KOĻESŅIKOVŠ, Andris	P-13-16	C12P19/34	-	-	F25B27/00	HOZVICKA, Jiri	P-13-214	C02F9/00
KUNKULBERGA, Daiga	P-13-224	A23G3/46	-	-	H01H35/30	-	-	C02F9/02
-	-	A23C21/00	H			-	-	C02F9/14
L			J			J		
LĀTVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE	P-13-217	B32B21/06	JEVMENOVŠ, Iļģors	P-13-206	B29B17/00	-	-	C08J11/10
-	P-13-223	A23L3/44	-	-	C08J11/10	K		
-	P-13-224	A23G3/46	K			KAMPARS, Valdis	P-14-25	C10L1/02
-	-	A23C21/00	KANCEVIČA, Viktorija	P-13-196	A61F2/06	-	-	C09F7/10
-	P-13-226	C12C7/053	KOTA-DOMBROVSKA, Irita	P-14-10	A01H4/00	KANCEVIČA, Viktorija	P-13-196	A61F2/06
LĀTVIJAS UNIVERSITĀTE	P-13-17	E04C1/41	-	-	A01H1/04	KOTA-DOMBROVSKA, Irita	P-14-10	A01H4/00
M			K			-	-	A01H1/04
MAČUKS, Ronalds	P-14-35	G01N33/52	KŪLIS, Pēteris	P-13-179	H01L31/02	KŪLIS, Pēteris	P-13-179	H01L31/02
MAKSIMENKO, Anatolijs	P-13-13	G01K17/00	-	-	H01L31/04	-	-	H01L31/04
MALOVŠ, Dmitrijs	P-13-13	G01K17/00	L			L		
METUMS, Juris	P-13-217	B32B21/06	LĀCIS, Gunārs	P-14-10	A01H4/00	-	-	A01H1/04
MIERIŅA, Inese	P-14-52	C07D319/04	-	-	A01H1/04	LĀTVIJAS ORGANISKĀS SINTĒZES INSTITŪTS	P-12-172	C07D495/04
-	-	A61P17/18	LĀTVIJAS UNIVERSITĀTES CIETVIELU FIZIKAS INSTITŪTS			-	-	C07D333/38
MUNDI, Māris Ralfs	P-13-14	B60G17/00	-	-	A61K31/55	-	-	A61K31/55
P			LĀTVIJAS UNIVERSITĀTES CIETVIELU FIZIKAS INSTITŪTS			LĀTVIJAS VALSTS AUGĻKOPĪBAS INSTITŪTS	P-14-10	A01H4/00
PUPELIS, Guntars	P-14-34	A61B17/34	-	-	A01H1/04	-	-	A01H1/04
R			LĀTVIJAS UNIVERSITĀTES CIETVIELU FIZIKAS INSTITŪTS			-	-	
RĀVIŅA, Iriša	P-14-52	C07D319/04	-	-	A01H4/00	L		
-	-	A61P17/18	LĀTVIJAS UNIVERSITĀTES CIETVIELU FIZIKAS INSTITŪTS			-	-	A01H1/04
RĪGALINS, Dmitrijs	P-13-13	G01K17/00	-	-	A01H1/04	LĀTVIJAS VALSTS AUGĻKOPĪBAS INSTITŪTS	P-14-10	A01H4/00
RĪGAS STRADIŅA UNIVERSITĀTE	P-14-33	G01N33/50	L			-	-	A01H1/04
-	P-14-34	A61B17/34	LĀCIS, Gunārs	P-14-10	A01H4/00	-	-	A01H1/04
-	P-14-35	G01N33/52	-	-	A01H1/04	LĀTVIJAS ORGANISKĀS SINTĒZES INSTITŪTS	P-12-172	C07D495/04

(71) Pieteicējs (72) Izgudrotājs (73) Īpašnieks	(21) Pieteikuma numurs	(51) Klase
LAZDINŠ, Anrijs	P-14-15	G01R23/16
LEPSE, Līga	P-14-10	A01H4/00
-	-	A01H1/04
LEŠČINSKIS, Oskars	P-14-28	C04B38/00
LEVINS, Nikolajs	P-14-38	H02K19/10
-	-	H02K7/09
LIEPKALNS, Didzis	P-14-15	G01R23/16
LORENCE, Sintija	P-13-214	C02F9/00
-	-	C02F9/02
-	-	C02F9/14
LORENCS, Ainars	P-13-214	C02F9/00
-	-	C02F9/02
-	-	C02F9/14
LUKJANČIKOVŠ, Andrejs	P-13-196	A61F2/06
L		
ĻEBEDEVŠ, Antons	P-12-172	C07D495/04
-	-	C07D333/38
-	-	A61K31/55
M		
MĀLIŅŠ, Kristaps	P-14-25	C10L1/02
-	-	C09F7/10
MĀRCIŅŠ, Guntis	P-13-179	H01L31/02
-	-	H01L31/04
MOROČKO-BIČEVSKA, Inga	P-14-10	A01H4/00
-	-	A01H1/04
O		
ORLOVA, Svetlana	P-14-38	H02K19/10
-	-	H02K7/09
P		
PEČERSKIS, Tims	P-14-15	G01R23/16
POĻAKOVŠ, Boriss	P-13-179	H01L31/02
-	-	H01L31/04
PONOMARJOVS, Jurijs	P-12-172	C07D495/04
-	-	C07D333/38
-	-	A61K31/55
PUGAČEVŠ, Vladislavs	P-14-38	H02K19/10
-	-	H02K7/09
R		
RIBICKIS, Leonīds	P-13-196	A61F2/06
RĪGAS TEHNISKĀ UNIVERSITĀTE	P-13-196	A61F2/06
-	P-14-25	C10L1/02
-	-	C09F7/10
-	P-14-28	C04B38/00
S		
SAF TEHNIKA, AS	P-14-15	G01R23/16
SAMSONE, Ineta	P-14-10	A01H4/00
-	-	A01H1/04
Š		
ŠVINKA, Ruta	P-14-28	C04B38/00
ŠVINKA, Visvaldis	P-14-28	C04B38/00
T		
TĀLE, Ivars	P-13-179	H01L31/02
-	-	H01L31/04
U		
UPĪTIS, Imants	P-14-32	A63B69/12

Izgudrojumu pieteikumu un patentu numuru rādītājs

(21) Pieteikuma numurs	(11) Publikācijas vai patenta numurs	(51) Klase	(21) Pieteikuma numurs	(11) Publikācijas vai patenta numurs	(51) Klase
Izgudrojumu patentu publikācijas			Izgudrojumu pieteikumu publikācijas		
P-13-13	14900	G01K17/00	P-12-137	14824	B28B1/08
P-13-14	14894	B60G17/00	P-12-172	14853	C07D495/04
P-13-16	14897	C12P19/34	-	-	C07D333/38
P-13-17	14899	E04C1/41	-	-	A61K31/55
P-13-217	14893	B32B21/06	P-12-180	14876	F25B21/02
P-13-223	14891	A23L3/44	-	-	F25B27/00
P-13-224	14890	A23G3/46	-	-	H01H35/30
-	-	A23C21/00	P-13-179	14879	H01L31/02
P-13-226	14896	C12C7/053	-	-	H01L31/04
P-14-33	14901	G01N33/50	P-13-196	14807	A61F2/06
P-14-34	14892	A61B17/34	P-13-206	14868	B29B17/00
P-14-35	14902	G01N33/52	-	-	C08J11/10
P-14-41	14898	E02B11/00	P-13-214	14838	C02F9/00
P-14-52	14895	C07D319/04	-	-	C02F9/02
-	-	A61P17/18	-	-	C02F9/14
			P-14-10	14835	A01H4/00
			-	-	A01H1/04
			P-14-15	14855	G01R23/16
			P-14-25	14871	C10L1/02
			-	-	C09F7/10
			P-14-28	14870	C04B38/00
			P-14-32	14865	A63B69/12
			P-14-38	14880	H02K19/10
			-	-	H02K7/09

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.

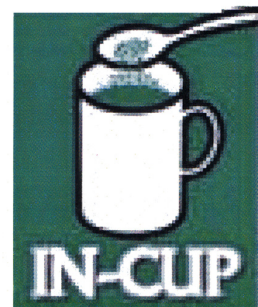
Preču zīmes reģistrācija ir spēkā 10 gadus, skaitot no pieteikuma datuma, ja tā netiek pirms šā termiņa dzēsta pēc preču zīmes īpašnieka iniciatīvas, atzīta par spēkā neesošu vai atcelta (likums „Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm”, 21. panta pirmā daļa). Ar dienu, kad publicēts paziņojums 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>(111) Reģistrācijas numurs
Registration number</p> <p>(116) Reģistrācijas atjaunojuma numurs, ja tas atšķiras no sākotnējā reģistrācijas numura
Renewal number where different from initial registration number</p> <p>(141) Reģistrācijas darbības pārtraukšanas datums
Date of the termination of the registration</p> <p>(151) Reģistrācijas datums
Registration date</p> <p>(210) Pieteikuma numurs
Application number</p> <p>(220) Pieteikuma datums
Filing date of the application</p> <p>(230) Izstādes prioritātes dati
Exhibition priority data</p> <p>(300) Konvencijas prioritātes dati:
pieteikuma numurs, pieteikuma datums, valsts kods
Convention priority data:
application number, filing date, code of country</p> <p>(350) Senioritātes dati (attiecībā uz Latviju):
reģistrācijas numurs, reģistrācijas datums
Seniority data (in relation to Latvia):
registration number, registration date</p> <p>(399) Ziņas par pārreģistrēto dokumentu, kas bija spēkā PSRS (pārreģistrētajām zīmēm)
Data relating to the registration previously in force in SU (for re-registered marks)</p> <p>(511) Preču un pakalpojumu starptautiskās klasifikācijas (Nicas klasifikācijas) indeksi; preču un/vai pakalpojumu saraksts
Indication of the International Classification of Goods and Services (Nice Classification); list of goods and/or services</p> <p>(526) Zīmes elementi, kas izslēgti no aizsardzības (disklamācija)
Elements excluded from protection (disclaimer)</p> <p>(531) Zīmju figurālo elementu starptautiskās klasifikācijas (Vīnes klasifikācijas - CFE) indeksi
Indication of the International Classification of the Figurative Elements of Marks (Vienna Classification - CFE)</p> <p>(540) Zīmes attēls
Reproduction of the mark</p> <p>(551) Norāde, ka šī zīme ir kolektīvā preču zīme
Indication that the mark is a collective mark</p> <p>(554) Telpiska zīme
Three-dimensional mark</p> <p>(555) Hologrāfiska zīme
Hologram mark</p> <p>(556) Skaņu zīme, tās raksturojums
Sound mark, including characteristics</p> <p>(571) Zīmes apraksts
Description of mark</p> | <p>(580) Reģistrācijas grozījumu ieraksta datums (īpašumtiesību pāreja, grozījumi vārdos, nosaukumos vai adresēs, reģistrācijas darbības pārtraukšana u.tml.)
Date of recording of a transaction in respect of the registration (change in ownership, change in name or address, termination of protection, etc.)</p> <p>(591) Norāde par zīmes aizsardzību krāsās
Indication concerning colours claimed</p> <p>(600) Juridiski saistītu pieteikumu dati, piemēram, dati par bij. PSRS pieteikumu, uz kuru saskaņā ar LR Ministru Padomes 1992. gada 28. februāra lēmumu Nr. 72 pamatots Latvijas pieteikums, vai Kopienas preču zīmes pieteikumu
References to legally related applications, e.g., data of the SU application, on which LV application is based according to the provisions of the Decision of the Council of Ministers of the Republic of Latvia No. 72, adopted on February 28, 1992, or a Community Trade Mark application</p> <p>(641) Sākotnējā pieteikuma dati (sadalīta pieteikuma gadījumā)
Initial application data (in case of divided application)</p> <p>(646) Sākotnējās reģistrācijas dati (sadalītas reģistrācijas gadījumā)
Initial registration data (in case of divided registration)</p> <p>(732) Zīmes īpašnieks, adrese, valsts kods
Name and address of the owner of the mark, code of country</p> <p>(740) Pārstāvis (patentpilnvarotais, preču zīmju aģents), adrese
Representative (patent attorney, trademark agent), address</p> <p>(791) Licenciāts, adrese, valsts kods
Name and address of the licensee, code of country</p> <p>(881) Nacionālās reģistrācijas, kas aizstāta ar starptautisko reģistrāciju, numurs un datums
Number and date of the national registration replaced by an international registration</p> <p>(885) Starptautiskās reģistrācijas, kas pārveidota par nacionālo reģistrāciju, numurs un datums
Number and date of the international registration transformed into a national registration</p> |
|---|--|

(111) **Reģ. Nr.** M 67 628 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
(210) **Pieteik.** M-11-455 (220) **Pieteik.dat.** 04.04.2011
(531) **CFE ind.** 11.1.2; 11.3.8; 26.4.2; 26.4.5; 26.4.16; 29.1.13



- (526) **Disklamācija** aizsardzība neattiecas uz vārdisko apzīmējumu 'IN-CUP'
 (591) **Krāsu salikums** tumši zaļš, melns, balts
 (732) **Īpašn.** MERRILD KAFFE APS; Nyvang 16, 5500 Middelfart, DK
 (740) **Pārstāvis** Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra 'KDK'; Dzērbenes iela 27, Rīga LV-1006
 (511) **30** kafijas ekstrakti; šķīstošā kafija; kafija; kafija filtru iepakojumā; kafijas dzērieni, arī ar pienu; kafijas aizvietotāji; kakao un kakao dzērieni; šokolāde un šokolādes ekstrakti pulvera, granulu vai šķidrā veidā; graudaugu izstrādājumi, kas ietverti šajā klasē; augļu tējas; cukurs; garšvielas vai garšaugi, vai to kombinācijas; tēja; tējas dzērieni; lapu tēja; zāļu tēja; tējas ekstrakti; šķīstošā tēja; tējas aizstājēji; tējas uzlējumi; kaltēti augi un to maisījumi augu tēju pagatavošanai; zāļu tēja ar žāvētiem augļiem; uzlējumi nemedicīniskiem nolūkiem, arī zāļu uzlējumi un novārījumi nemedicīniskiem nolūkiem

(111) **Reģ. Nr.** M 67 629 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-13-487 (220) **Pieteik.dat.** 23.04.2013

CardioChocolate

- (732) **Īpašn.** SISTĒMU INOVĀCIJAS, AS; Mazcenu aleja 6a, Jaunmārupe, Mārupes nov. LV-2166, LV
 (511) **5** farmaceitiskie un veterinārie preparāti; vitamīnu un minerālvielu preparāti; barības piedevas sirds un asinsvadu sistēmas slimību ārstēšanai un profilaksei; diētiskie produkti un vielas medicīniskiem vai veterināriem nolūkiem; uzturs zīdaiņiem un maziem bērniem; uztura bagātinātāji cilvēkam un dzīvniekiem; personiskās higiēnas līdzekļi, to skaitā medicīniskiem nolūkiem; medicīniskais uzturs invalīdiem un veciem cilvēkiem

(111) **Reģ. Nr.** M 67 630 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-13-1134 (220) **Pieteik.dat.** 08.10.2013
 (531) **CFE ind.** 5.7.10; 24.5.7; 25.1.17; 29.1.14



- (591) **Krāsu salikums** dzeltens, pelēks, melns, balts
 (300) **Prioritāte** 20131302; 29.07.2013; LT
 (732) **Īpašn.** UAB "ITALIANA LT"; A. Juozapavičiaus pr. 82, LT-45214 Kaunas, LT
 (740) **Pārstāvis** Māra UZULĒNA, Patentu birojs "ALFA-PATENTS"; Vīrānes iela 2, Rīga LV-1035
 (511) **33** alkoholiskie dzērieni, proti, muskatvīns

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 631 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-13-1211 (220) **Pieteik.dat.** 23.10.2013
 (531) **CFE ind.** 7.1.24; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** tumši pelēks, zaļš, gaiši zaļš, melns, pelēks
 (732) **Īpašn.** Normunds ZONDAKS; Drustu iela 1d, Rīga LV-1002, LV
 (511) **19** apstrādāti kokmateriāli; koka ēkas
35 reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi; apstrādātu kokmateriālu un koka ēku tirdzniecība
37 būvniecība; remonts; labiekārtošanas (iekārtu uzstādīšanas) darbi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 632 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-13-1349 (220) **Pieteik.dat.** 25.11.2013

B & Š PARTNERI

- (732) **Īpašn.** B & Š PARTNERĪBA, Juridiskais birojs, SIA; Vīlandes iela 6-4, Rīga LV-1010, LV
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010
 (511) **1** ķīmikālijas rūpnieciskiem, zinātniskiem, fotogrāfijas, kā arī lauksaimniecības, dārzkopības un mežkopības nolūkiem; neapstrādāti sintētiskie sveķi, neapstrādātas plastmasas; mēslojumi; ķīmiskie ugunsdzēsšanas līdzekļi; ķīmiskie līdzekļi metālu rūdīšanai un lodēšanai; ķīmiskās vielas pārtikas produktu konservēšanai; miecvielas; līmvielas rūpnieciskiem nolūkiem
2 krāsas, pernicas, lakas; pretkorozijas līdzekļi, koksnes konservēšanas līdzekļi; krāsvielas; kodnes; neapstrādāti dabiskie sveķi; lokšņveida un pulverveida metāli mākslinieciskiem un dekoratīviem nolūkiem un iespieddarbiem
3 mazgāšanas un balināšanas līdzekļi; tīrīšanas, pulēšanas, attaukošanas un abrazīvie līdzekļi; ziepes; parfimērijas izstrādājumi, ēteriskās eļļas, kosmētiskie un matu kopšanas līdzekļi; zobu kopšanas līdzekļi
4 tehniskās eļļas un ziedes; smērvielas; putekļu absorbcijas, mitrināšanas un piesaistīšanas līdzekļi; kurināmie (arī motoru degvielas) un vielas apgaismošanas nolūkiem; sveces un daktis apgaismošanai
5 farmaceitiskie un veterinārie preparāti; higiēnas līdzekļi medicīniskiem nolūkiem; diētiskā pārtika un vielas medicīniskiem vai veterināriem nolūkiem, uzturs zīdaiņiem un maziem bērniem; uztura bagātinātāji cilvēkam un dzīvniekiem; plāksteri, pārsienamie materiāli; materiāli zobu plombēšanai un zobu nospiedumu izgatavošanai; dezinfekcijas līdzekļi; preparāti kaitēkļu iznīcināšanai; fungicīdi, herbicīdi parasti metāli un to sakausējumi; būvmateriāli no metāla; pārvietojamas metāla būves; sliežu ceļu materiāli no metāla; metāla troses un stieples (ne elektriskiem nolūkiem); būvapakalumi, atslēdznieku izstrādājumi; metāla caurules; seifi; izstrādājumi no parastiem metāliem, kas nav ietverti citās klasēs; rūdas mašīnas un darbmašīnas; motori un dzinēji (izņemot sauszemes transporta līdzekļiem paredzētos); mašīnu sajūga un transmisijas elementi (izņemot sauszemes transporta līdzekļiem paredzētos); lauksaimniecības

- mehānismi (izņemot ar roku darbināmos); olu inkubatori; tirdzniecības automāti
- 8 rokas darbarīki, ar roku darbināmas ierīces; galda piederumi; aukstie ieroči; skuvekļi
- 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; magnētiskās informācijas vides, ieraksta diski; kompaktdiski, DVD diski un citi digitālie datu nesēji; mehānismi ar naudu iedarbināmiem aparātiem; kases aparāti, rēķināšanas mašīnas, informācijas apstrādes ierīces, datori; datoru programmatūra; ugunsdzēsības ierīces
- 10 ķirurģijas, medicīnas, zobārstniecības un veterinārijas aparāti, ierīces un instrumenti; locekļu, acu un zobu protēzes; ortopēdiskās preces; ķirurģiskie šuvju materiāli
- 11 apgaismošanas, apsildes, tvaika ražošanas, ēdiena termiskās apstrādes, dzesēšanas, žāvēšanas, vēdināšanas, ūdensapgādes un sanitārtehniskās ierīces un aparāti
- 12 transporta līdzekļi; pārvietošanās līdzekļi pa sauszemi, gaisu vai ūdeni
- 13 šaujamo ieroči; munīcija un šāviņi; sprāgstvielas; pirotehniskie līdzekļi
- 14 cēlmetāli un to sakausējumi, no cēlmetāliem izgatavoti vai ar tiem pārklāti izstrādājumi, kas nav ietverti citās klasēs; juvelierizstrādājumi, rotaslietas, dārgakmeņi; pulksteņi un hronometriskie instrumenti
- 15 mūzikas instrumenti
- 16 papīrs, kartons un izstrādājumi no šiem materiāliem, kas nav ietverti citās klasēs; iespiešanas produkcija; grāmatu iesiešanas materiāli; fotogrāfijas; rakstāmlietas; līmvielas kancelejas vai mājturības vajadzībām; materiāli māksliniekiem; otas; rakstāmmašīnas un kancelejas preces (izņemot mēbeles); mācību un uzskates līdzekļi (izņemot aparāturu); sintētiskie iesaiņojuma materiāli (kas nav ietverti citās klasēs); iespiedburti; klišejas
- 17 kaučuks, gutaperča, gumija, azbests, vizla un izstrādājumi no šiem materiāliem, kas nav ietverti citās klasēs; plastmasu pusfabrikāti; drīvēšanas, blīvēšanas un izolācijas materiāli; lokanas nemetāliskas caurules
- 18 āda un ādas imitācijas, izstrādājumi no šiem materiāliem, kas nav ietverti citās klasēs; dzīvnieku ādas, ceļasomas un čemodāni; lietussargi un saulesargi; spieķi; pātagas, zirglietas un seglinieku izstrādājumi
- 19 nemetāliski būvmateriāli; nemetāliskas cietas caurules celtniecības vajadzībām; asfalts, darva un bitums; pārvietojamas nemetāliskas būves; pieminekļi (izņemot metāla)
- 20 mēbeles, spoguļi, rāmji; izstrādājumi, kas nav ietverti citās klasēs, no koka, korķa, niedrēm, meldriem, klūgām, raga, kaula (arī zivju), ziloņkaula, vaļa vai bruņurupuča ragvielas, gliemežvākiem, dzintara, perlamutra, jūras putām, šo materiālu aizstājējiem vai no plastmasām
- 21 mājturības un virtuves piederumi, ierīces, tīrnes un trauki; ķemmes un sūkļi; sukas (izņemot otas); materiāli suku izstrādājumiem; tīrīšanas un apkopšanas rīki un ierīces; tērauda skaidas (tīrīšanai); neapstrādāts vai daļēji apstrādāts stikls (izņemot stiklu celtniecības vajadzībām); izstrādājumi no stikla, porcelāna, fajansa un keramikas, kas nav ietverti citās klasēs
- 22 virves, auklas, tīkli, teltis, nojumes, brezenti, buras, maisi un maisiņi (izņemot citās klasēs ietvertos šo preču veidus); polsterējamie materiāli (izņemot no gumijas un sintētiskām vielām); neapstrādāti tekstilšķiedru materiāli
- 23 dzijas un diegi tekstilizstrādājumiem
- 24 audumi un tekstilpreces, kas nav ietvertas citās klasēs; gultas pārklāji; galda pārklāji
- 25 apģērbi, apavi, galvassegas
- 26 mežģīnes un izšuvumi, lentes, pītas lentes; pogas, āķi un cilpiņas, adatas; mākslīgie ziedi
- 27 paklāji, grīdsegas, mašas un pīteņi, linolejs un citi grīdu pārklājumu materiāli; sienu tapsējuma materiāli (netekstila)
- 28 spēles un rotaļlietas; vingrošanas un sporta preces, kas nav ietvertas citās klasēs; egļišu rotājumi
- 29 gaļa, zivis, mājputni un medījumi; gaļas ekstrakti; konservēti, saldēti, žāvēti (kaltēti) un termiski apstrādāti augļi un dārzeņi; želejas, ievārtējumi, 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, dārzkopības, 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
- 33 alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)
- 34 tabaka; smēķēšanas piederumi; sērkokociņi
- 35 reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi
- 36 apdrošināšana; finanšu lietas; darījumi ar naudu; nekustamā īpašuma lietas
- 37 būvniecība; remonts; labiekārtošanas (iekārtu uzstādīšanas) darbi
- 38 telesakari
- 39 transports; preču iesaiņošana un uzglabāšana; ceļojumu organizēšana
- 40 materiālu apstrāde
- 41 audzināšana; apmācība; izpriecās; sporta un kultūras pasākumi
- 42 zinātniskie un tehnoloģiskie pakalpojumi, izpēte un projektēšana šajās jomās; rūpnieciskā izpēte un izstrādes; datoru aparātūras un programmatūras projektēšana, izstrāde un pilnveidošana
- 43 apgāde ar uzturu; viesu izmitināšana
- 44 ārstnieciskā aprūpe; veterinārie pakalpojumi; veselības un skaistumkopšanas pakalpojumi cilvēkam un dzīvniekiem; lauksaimniecības, dārzkopības un mežkopības pakalpojumi
- 45 juridiskie pakalpojumi; drošības pakalpojumi personu un īpašuma aizsardzībai; detektīvu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 633 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-13-1364 (220) **Pieteik.dat.** 28.11.2013
 (531) **CFE ind.** 5.5.20; 5.5.21; 27.5.4; 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** oranžs, tumši zils, melns
 (732) **Īpašn.** LATVIJAS ENERĢOCELTNIKS, SIA; Lubānas iela 43, Rīga LV-1073, LV
 (511) **37** būvniecība; remonts; labiekārtošanas (iekārtu uzstādīšanas) darbi; elektroenerģijas ražošanas un pārvades iekārtu, līniju un tīklu būvniecība, montāža, remonts un tehniskā apkope; sakaru iekārtu būvniecība, montāža, remonts un tehniskā apkope; torņu un mastu montāža

(111) **Reģ. Nr.** M 67 634 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-13-1367 (220) **Pieteik.dat.** 29.11.2013
 (531) **CFE ind.** 3.13.1; 26.1.2; 26.1.3; 26.1.20; 27.5.4; 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** sarkans, dzeltens, balts, pelēks
 (732) **Īpašn.** RĪGAS DZIRNAVNIKS, AS; Lizuma iela 5, Rīga LV-1006, LV
 (740) **Pārstāvis** Juris RAUDZEPS, Zvērinātu advokātu birojs "LEXTAL"; Grēcinieku iela 8, Rīga LV-1050
 (511) **30** milti un labības produkti, ieskaitot ātri pagatavojamās biežputras, musli, musli batoniņus un graudaugu pārslas; rīsi; maize, maizes un konditorejas izstrādājumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 635 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-13-1368 (220) **Pieteik.dat.** 29.11.2013
 (531) **CFE ind.** 5.11.11; 26.4.4; 26.4.22; 27.3.11



(591) **Krāsu salikums** sarkans, gaiši zaļš, zaļš, balts
 (732) **Īpašn.** RĪGAS DZIRNAVNIKS, AS; Lizuma iela 5, Rīga LV-1006, LV
 (740) **Pārstāvis** Juris RAUDZEPS, Zvērinātu advokātu birojs "LEXTAL"; Grēcinieku iela 8, Rīga LV-1050
 (511) **30** milti un labības produkti, ieskaitot ātri pagatavojamās biežputras, musli, musli batoniņus un graudaugu pārslas; rīsi; maize, maizes un konditorejas izstrādājumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 636 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-13-1405 (220) **Pieteik.dat.** 09.12.2013
 (531) **CFE ind.** 26.4.2; 26.4.9; 26.4.19; 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** sarkans, balts, melns
 (732) **Īpašn.** Eldars GEJUŠOVŠ; Stimu iela 4-15, Rīga LV-1082, LV
 (511) **20** mēbeles

(111) **Reģ. Nr.** M 67 637 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-13-1414 (220) **Pieteik.dat.** 14.12.2013

P&C

(732) **Īpašn.** PEEK & CLOPPENBURG KG; Berliner Allee 2, 40212 Düsseldorf, DE

(740) **Pārstāvis** Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra 'KDK'; Dzērbenes iela 27, Rīga LV-1006

(511) **18** āda un ādas imitācijas, un preces no tām; neizstrādātas un izstrādātas dzīvnieku ādas, ceļojumu lādes un ceļojumu somas, koferi, somas, rokassomas, kabatas portfeļi, maki, atslēgu maciņi, mugursomas, maisiņi; lietussargi un saulesargi; spieķi; pātagas, zirglietas un seglinieku izstrādājumi

25 apģērbi, apavi, galvassegas

35 reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi; reklāmas pasākumu un klientu lojalitātes programmu organizēšana un vadīšana; mazumtirdzniecības pakalpojumi, arī ar tīmekļa vietņu un televeikalu starpniecību, attiecībā uz šādām precēm: apģērbi, apavi, galvassegas; mazgāšanas un balināšanas līdzekļi; tīrīšanas, pulēšanas, attaukošanas un abrazīvie līdzekļi; ziepes; parfimērijas izstrādājumi, ēteriskās eļļas, kosmētiskie un matu kopšanas līdzekļi; zobu pulveri un pastas; saulesbrilles; cēlmetāli un to sakausējumi, no cēlmetāliem izgatavoti vai ar tiem pārklāti izstrādājumi, kas nav ietverti citās klasēs; juvelierizstrādājumi, rotaslietas, dārgakmeņi; pulksteņi un hronometriskie instrumenti; āda un ādas imitācijas, un preces no tām; neizstrādātas un izstrādātas dzīvnieku ādas; ceļojumu lādes un ceļojumu somas, koferi, somas, rokassomas, kabatas portfeļi, maki, atslēgu maciņi, mugursomas, maisiņi; lietussargi un saulesargi; spieķi; pātagas, zirglietas un seglinieku izstrādājumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 638 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-13-1415 (220) **Pieteik.dat.** 14.12.2013

PuC

(732) **Īpašn.** PEEK & CLOPPENBURG KG; Berliner Allee 2, 40212 Düsseldorf, DE

(740) **Pārstāvis** Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra 'KDK'; Dzērbenes iela 27, Rīga LV-1006

(511) **18** āda un ādas imitācijas, un preces no tām; neizstrādātas un izstrādātas dzīvnieku ādas, ceļojumu lādes un ceļojumu somas, koferi, somas, rokassomas, kabatas portfeļi, maki, atslēgu maciņi, mugursomas, maisiņi; lietussargi un saulesargi; spieķi; pātagas, zirglietas un seglinieku izstrādājumi

25 apģērbi, apavi, galvassegas

35 reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi; reklāmas pasākumu un klientu lojalitātes programmu organizēšana un vadīšana; mazumtirdzniecības pakalpojumi, arī ar tīmekļa vietņu un televeikalu starpniecību, attiecībā uz šādām precēm: apģērbi, apavi, galvassegas; mazgāšanas un balināšanas līdzekļi; tīrīšanas, pulēšanas, attaukošanas un abrazīvie līdzekļi; ziepes; parfimērijas izstrādājumi, ēteriskās eļļas, kosmētiskie un matu kopšanas līdzekļi; zobu pulveri un pastas; saulesbrilles; cēlmetāli un to sakausējumi, no cēlmetāliem izgatavoti vai ar tiem pārklāti izstrādājumi, kas nav ietverti citās klasēs; juvelierizstrādājumi, rotaslietas, dārgakmeņi; pulksteņi un hronometriskie instrumenti; āda un ādas imitācijas, un preces no tām; neizstrādātas un izstrādātas dzīvnieku ādas; ceļojumu lādes un ceļojumu somas, koferi, somas, rokassomas, kabatas portfeļi, maki, atslēgu maciņi, mugursomas, maisiņi; lietussargi un saulesargi; spieķi; pātagas, zirglietas un seglinieku izstrādājumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 639 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-13-1416 (220) **Pieteik.dat.** 14.12.2013

PEEK

- (732) **Īpašn.** PEEK & CLOPPENBURG KG; Berliner Allee 2, 40212 Düsseldorf, DE
- (740) **Pārstāvis** Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra 'KDK'; Dzērbenes iela 27, Rīga LV-1006
- (511) **18** āda un ādas imitācijas, un preces no tām; neizstrādātas un izstrādātas dzīvnieku ādas, ceļojumu lādes un ceļojumu somas, koferi, somas, rokassomas, kabatas portfeļi, maki, atslēgu maciņi, mugursomas, maisiņi; lietussargi un saulesargi; spieķi; pātagas, zirglietas un seglinieku izstrādājumi
- 25** apģērbi, apavi, galvassegas
- 35** reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi; reklāmas pasākumu un klientu lojalitātes programmu organizēšana un vadīšana; mazumtirdzniecības pakalpojumi, arī ar tīmekļa vietņu un televiķu starpniecību, attiecībā uz šādām precēm: apģērbi, apavi, galvassegas; mazgāšanas un balināšanas līdzekļi; tīrīšanas, pulēšanas, attaukošanas un abrazīvie līdzekļi; ziepes; parfimērijas izstrādājumi, ēteriskās eļļas, kosmētiskie un matu kopšanas līdzekļi; zobu pulveri un pastas; saulesbrilles; cēlmetāli un to sakausējumi, no cēlmetāliem izgatavoti vai ar tiem pārklāti izstrādājumi, kas nav ietverti citās klasēs; juvelierizstrādājumi, rotaslietas, dārgakmeņi; pulksteņi un hronometriskie instrumenti; āda un ādas imitācijas, un preces no tām; neizstrādātas un izstrādātas dzīvnieku ādas; ceļojumu lādes un ceļojumu somas, koferi, somas, rokassomas, kabatas portfeļi, maki, atslēgu maciņi, mugursomas, maisiņi; lietussargi un saulesargi; spieķi; pātagas, zirglietas un seglinieku izstrādājumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 640 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-13-1421 (220) **Pieteik.dat.** 17.12.2013
 (531) **CFE ind.** 26.4.4; 26.4.5; 26.4.19; 27.5.21; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** zils, balts, sarkans
- (732) **Īpašn.** Dmitrijs ŽAKS; Anniņmuižas bulvāris 46-34, Rīga LV-1069, LV
- (511) **35** reklāma

(111) **Reģ. Nr.** M 67 641 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-13-1444 (220) **Pieteik.dat.** 27.12.2013
 (531) **CFE ind.** 26.4.2; 26.4.5; 26.4.22; 29.1.14



- (591) **Krāsu salikums** zils, dzeltens, melns, balts
- (732) **Īpašn.** DLV, SIA; Maskavas iela 198a, Rīga LV-1019, LV
- (511) **9** ar naudu iedarbināmu spēļu automātu mehānismi
- 28** elektroniskai, magnētiskai vai biometriskai atmiņas videi pielāgoti elektroniskie un mehāniskie spēļu automāti (ar vai bez laimestu izmaksas funkcijām), kas iedarbināmi

- ar monētām, banknotēm, žetoniem vai taloniem un paredzēti izmantošanai kazino un spēļu zālēs; spēļu automātu korpusi; ar monētām iedarbināmi elektriskie, elektroniskie un mehāniskie bingo spēles un loteriju automāti, arī komerciāliem nolūkiem; spēļu galdi
- 41** azartspēļu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 642 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-13-1454 (220) **Pieteik.dat.** 28.12.2013

NYFA

- (732) **Īpašn.** NEW YORK FILM ACADEMY, INC.; 100 East 17th Street, New York 10003, US
- (740) **Pārstāvis** Rūta OLMANE; a/k 49, Rīga LV-1006
- (511) **41** akadēmiskās izglītības pakalpojumi; videoierakstu veidošana; informācijas pakalpojumi izglītības jomā; filmu studiju pakalpojumi; tālmācības kursi; kolokviju organizēšana un vadīšana; kongresu organizēšana un vadīšana; konferenču organizēšana un vadīšana; darba semināru (apmācību) organizēšana un vadīšana; semināru organizēšana un vadīšana; simpoziju organizēšana un vadīšana; izglītojošu vai izklaidējošu konkursu organizēšana; profesionālās pārkvalificēšanas pakalpojumi; videofilmu producēšana; filmu (izņemot reklāmas filmu) ražošana; apmācības pakalpojumi; scenāriju rakstīšanas pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 643 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-7 (220) **Pieteik.dat.** 03.01.2014

ATLANTIS

- (732) **Īpašn.** LIVIKO, SIA; Dunties iela 23a, Rīga LV-1005, LV
- (511) **33** alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

(111) **Reģ. Nr.** M 67 644 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-8 (220) **Pieteik.dat.** 03.01.2014

MY STYLE

- (732) **Īpašn.** LIVIKO, SIA; Dunties iela 23a, Rīga LV-1005, LV
- (511) **33** alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

(111) **Reģ. Nr.** M 67 645 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-9 (220) **Pieteik.dat.** 03.01.2014
 (531) **CFE ind.** 5.7.9; 25.1.15; 26.4.15; 26.7.5; 29.1.15



(591) **Krāsu salikums** sarkans, zaļš, zils, sudrabains, melns, balts
 (732) **Īpašn.** LIVIKO, SIA; Dunties iela 23a, Rīga LV-1005, LV
 (511) **33** alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

(111) **Reģ. Nr.** M 67 646 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-10 (220) **Pieteik.dat.** 03.01.2014
 (531) **CFE ind.** 5.7.11; 5.7.22; 25.1.15; 26.4.15; 26.7.5; 29.1.15



(591) **Krāsu salikums** sarkans, rozā, dzeltens, zaļš, zils, sudrabains, melns, balts
 (732) **Īpašn.** LIVIKO, SIA; Dunties iela 23a, Rīga LV-1005, LV
 (511) **33** alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

(111) **Reģ. Nr.** M 67 647 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-12 (220) **Pieteik.dat.** 03.01.2014

CĒSU NEFILTRĒTAIS LĒNALUS

(732) **Īpašn.** CĒSU ALUS, AS; Aldaru laukums 1, Cēsis, Cēsu nov. LV-4101, LV
 (511) **32** alus

(111) **Reģ. Nr.** M 67 648 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-13 (220) **Pieteik.dat.** 03.01.2014

CĒSU LĒNALUS

(732) **Īpašn.** CĒSU ALUS, AS; Aldaru laukums 1, Cēsis, Cēsu nov. LV-4101, LV
 (511) **32** alus

(111) **Reģ. Nr.** M 67 649 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-16 (220) **Pieteik.dat.** 06.01.2014

VISOMAX

(732) **Īpašn.** Viktors KARPOVS; Dzelzavas iela 35 k-1-57, Rīga LV-1084, LV
 (511) **5** farmaceitiskie un veterinārie preparāti; higiēnas līdzekļi medicīniskiem nolūkiem; diētiskā pārtika un vielas medicīniskiem vai veterināriem nolūkiem, uzturs

zīdaiņiem un maziem bērniem; uztura bagātinātāji cilvēkam un dzīvniekiem; plāksteri, pārsienamie materiāli; materiāli zobu plombēšanai un zobu nospiedumu izgatavošanai; dezinfekcijas līdzekļi; preparāti kaitēkļu iznīcināšanai; fungicīdi, herbicīdi
44 ārstnieciskā aprūpe; veterinārie pakalpojumi; veselības un skaistumkopšanas pakalpojumi cilvēkam un dzīvniekiem; lauksaimniecības, dārzkopības un mežkopības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 650 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-17 (220) **Pieteik.dat.** 06.01.2014

ORNISCIL

(732) **Īpašn.** PRIMEA, SIA; Ģertrūdes iela 7, Rīga LV-1010, LV
 (511) **5** farmaceitiskie un veterinārie preparāti; higiēnas līdzekļi medicīniskiem nolūkiem; diētiskā pārtika un vielas medicīniskiem vai veterināriem nolūkiem, uzturs zīdaiņiem un maziem bērniem; uztura bagātinātāji cilvēkam un dzīvniekiem; plāksteri, pārsienamie materiāli; materiāli zobu plombēšanai un zobu nospiedumu izgatavošanai; dezinfekcijas līdzekļi; preparāti kaitēkļu iznīcināšanai; fungicīdi, herbicīdi
44 ārstnieciskā aprūpe; veterinārie pakalpojumi; veselības un skaistumkopšanas pakalpojumi cilvēkam un dzīvniekiem; lauksaimniecības, dārzkopības un mežkopības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 651 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-18 (220) **Pieteik.dat.** 06.01.2014

CEREBROVIN

(732) **Īpašn.** PRIMEA, SIA; Ģertrūdes iela 7, Rīga LV-1010, LV
 (511) **5** farmaceitiskie un veterinārie preparāti; higiēnas līdzekļi medicīniskiem nolūkiem; diētiskā pārtika un vielas medicīniskiem vai veterināriem nolūkiem, uzturs zīdaiņiem un maziem bērniem; uztura bagātinātāji cilvēkam un dzīvniekiem; plāksteri, pārsienamie materiāli; materiāli zobu plombēšanai un zobu nospiedumu izgatavošanai; dezinfekcijas līdzekļi; preparāti kaitēkļu iznīcināšanai; fungicīdi, herbicīdi
44 ārstnieciskā aprūpe; veterinārie pakalpojumi; veselības un skaistumkopšanas pakalpojumi cilvēkam un dzīvniekiem; lauksaimniecības, dārzkopības un mežkopības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 652 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-19 (220) **Pieteik.dat.** 06.01.2014

Piena Partneri

(732) **Īpašn.** PIENA PARTNERI KS, Lauksaimniecības pakalpojumu piensaimnieku kooperatīvā sabiedrība; Mazcenu aleja 37, Jaunmārupe, Mārupes nov. LV-2166, LV
 (511) **29** piens un piena produkti

(111) **Reģ. Nr.** M 67 653 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-27 (220) **Pieteik.dat.** 07.01.2014
 (531) **CFE ind.** 5.5.20; 5.5.21; 29.1.15



- (591) **Krāsu salikums** violets, sarkans, rozā, oranžs, dzeltens, gaiši zaļš, zaļš, zils, balts
 (732) **Īpašn.** ELITERA, SIA; Turgus iela 6/8-3, Daugavpils LV-5401, LV
 (511) **20** spilveni
24 audumi, spilvendrānas, palagi, virspalagi, segas; gultas pārklāji; galda pārklāji
26 mežģīnes un izšuvumi, lentes

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 654 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-29 (220) **Pieteik.dat.** 08.01.2014
 (531) **CFE ind.** 24.17.2

• • • **HEAVENS** • • •
 ALL NIGHT LONG

- (732) **Īpašn.** MARKS M, SIA; Dūņu iela 9, Jelgava LV-3001, LV
 (740) **Pārstāvis** Māris SAULĪTIS; Elektrības iela 8b, Jelgava LV-3001
 (511) **20** mēbeles un matračī, kas ietverti šajā klasē

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 655 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-41 (220) **Pieteik.dat.** 10.01.2014

FRIŠS

- (732) **Īpašn.** VALMIERMUIŽAS ALUS, SIA; Dzirnau iela 2, Valmiermuiža, Valmieras pag., Burtnieku nov. LV-4219, LV
 (740) **Pārstāvis** Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010
 (511) **30** tējas dzērieni
32 alus; minerālūdeņi, gāzēti ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; limonādes, sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai
33 alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 656 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-47 (220) **Pieteik.dat.** 14.01.2014
 (531) **CFE ind.** 26.2.7; 26.2.8; 29.1.12



- (591) **Krāsu salikums** violets, balts
 (732) **Īpašn.** DOKTUS, Cēsu pilsētas zemnieku saimniecība; Pāvila iela 22, Cēsis, Cēsu nov. LV-4101, LV

- (511) **5** augu tējas ārstnieciskiem nolūkiem

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 657 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-59 (220) **Pieteik.dat.** 16.01.2014
 (531) **CFE ind.** 27.5.4; 29.1.12

INTERNATIONAL

- (591) **Krāsu salikums** melns, dzeltens, balts
 (732) **Īpašn.** Viktors RAVDIVE; Zolitūdes iela 46-84, Rīga LV-1029, LV
 (511) **43** apgāde ar uzturu; viesu izmitināšana

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 658 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-60 (220) **Pieteik.dat.** 16.01.2014
 (531) **CFE ind.** 2.1.8; 2.1.15; 26.1.1; 26.1.4; 26.1.6; 26.1.14; 26.1.16; 29.1.15



- (591) **Krāsu salikums** jūras zaļš, dzeltens, dzeltenīgi zaļš, sarkans, zils, balts, zaļš, pelēks, gaiši zils, melns, smilškrāsa, pelēcīgi zils
 (732) **Īpašn.** Sandis STIBE; Penkules iela 124, Mārupe, Mārupes nov. LV-2167, LV
 (511) **29** gaļas izstrādājumi, to skaitā gaļas konservi; zivju izstrādājumi, to skaitā zivju konservi; izstrādājumi, kas sastāv no dažādām jūras veltēm

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 659 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-64 (220) **Pieteik.dat.** 16.01.2014

BURGENFELS

- (732) **Īpašn.** ICA AB; Svetsarvāgen 16, SE-171 93 Sölna, SE
 (740) **Pārstāvis** Jānis LOZE, Zvērinātu advokātu birojs "LOZE & PARTNERS"; Krišjāņa Valdemāra iela 33, Rīga LV-1010
 (511) **32** alus; minerālūdeņi, gāzēti ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 660 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-67 (220) **Pieteik.dat.** 17.01.2014
 (531) **CFE ind.** 27.5.19; 27.7.11; 29.1.14



C A R G O

- (591) **Krāsu salikums** sarkans, tumši zils, balts, melns
 (732) **Īpašn.** AM2B, SIA; Pildas iela 8, Rīga LV-1035, LV
 (740) **Pārstāvis** Jurijs BAIBAKOVŠ; Ūdru iela 4, Mārupe, Mārupes novads LV-2167
 (511) **39** transporta pakalpojumi; loģistikas pakalpojumi; ekspedīcijas pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 661 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-70 (220) **Pieteik.dat.** 01.05.2004
 (531) **CFE ind.** 26.4.4; 26.4.5; 26.4.22



- (600) Kopienas preču zīmes 012177762 konversija
 (732) **Īpašn.** INTERNATIONAL BUSINESS MACHINES CORPORATION; New Orchard Road, Armonk NY 10504, US
 (740) **Pārstāvis** Vladimirs ANOHINS, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010
 (511) **9** datori

(111) **Reģ. Nr.** M 67 662 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-77 (220) **Pieteik.dat.** 20.01.2014

YOLO

- (732) **Īpašn.** ARTELS, SIA; Robežu iela 64, Jelgava LV-3004, LV
 (511) **43** apgāde ar uzturu; picēriju pakalpojumi; restorānu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 663 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-78 (220) **Pieteik.dat.** 21.01.2014

SoftekSim

- (732) **Īpašn.** AVIO SERVICES, SIA; Maskavas iela 227, Rīga LV-1019, LV
 (511) **9** zinātniskie, kuģniecības, ģeodēziskie, fotogrāfiskie, kinematogrāfiskie, optiskie, svēršanas, mērīšanas, signalizācijas, kontroles (pārbaudes), glābšanas un mācību aparāti, ierīces un instrumenti

(111) **Reģ. Nr.** M 67 664 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-81 (220) **Pieteik.dat.** 21.01.2014
 (531) **CFE ind.** 3.15; 29.1.14



- (591) **Krāsu salikums** sarkans, zaļš, dzeltenīgi zaļš, dzeltens, balts
 (732) **Īpašn.** FURSON ENTERPRISES LP; Suite 1380, 111 West George Street, Glasgow, Scotland G2 1QX, GB
 (740) **Pārstāvis** Natālija ANOHINA, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010
 (511) **31** dzīvnieki; dzīvnieku barība
35 zoopreču tirdzniecība

(111) **Reģ. Nr.** M 67 665 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-88 (220) **Pieteik.dat.** 22.01.2014

Beerville

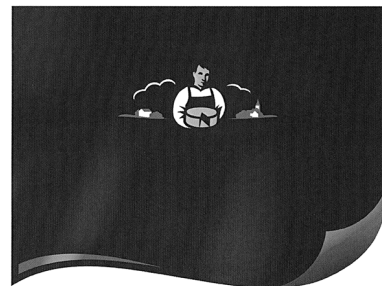
- (732) **Īpašn.** RIMI LATVIA, SIA; Augusta Deglava iela 161, Rīga LV-1021, LV
 (740) **Pārstāvis** Kristīne MIEŽĪTE-ZELTIŅA; Augusta Deglava iela 161, Rīga LV-1021
 (511) **32** alus, arī ingvera alus; alus kokteiļi; bezalkoholiskie dzērieni ar alus garšu

(111) **Reģ. Nr.** M 67 666 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-108 (220) **Pieteik.dat.** 28.01.2014

SilvaseptActive

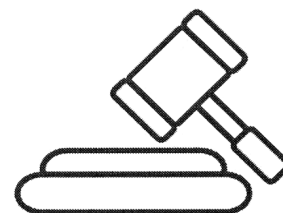
- (732) **Īpašn.** SILV EXPO, SIA; Ganību dambis 17-19, Rīga LV-1045, LV
 (740) **Pārstāvis** Ludmila IVANOVA, Patentu aģentūra TESIO; Kronvalda bulvāris 3, Rīga LV-1010
 (511) **5** dabas vielu līdzekļi mutes dobuma un kakla ārstēšanai un profilaksei; uztura bagātinātāji ar priežu ekstraktvielām medicīniskiem nolūkiem

(111) **Reģ. Nr.** M 67 667 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-113 (220) **Pieteik.dat.** 31.01.2014
 (531) **CFE ind.** 2.1.1; 2.1.11; 26.4.4; 26.4.5; 26.4.6; 26.4.14; 26.4.24



- (300) **Prioritāte** Z-419918; 07.10.2013; PL
 (732) **Īpašn.** MLECZARNIA TUREK SP ZOO; ul. Milewskiego 11, 62700 Turek, PL
 (740) **Pārstāvis** Svetlana MAKEJEVA, Intelektuālā īpašuma juridiskā firma 'LATISS'; Stabu iela 44-21, Rīga LV-1011
 (511) **29** piens, siers un piena produkti; pārtikas eļļas un tauki

(111) **Reģ. Nr.** M 67 668 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-133 (220) **Pieteik.dat.** 05.02.2014
 (531) **CFE ind.** 14.7.1



Izsoles Nams

- (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) **35** uzņēmumu un uzņēmējdarbības projektu pirkšanas un pārdošanas pakalpojumi; uzņēmumu akciju un daļu pirkšanas un pārdošanas pakalpojumi, arī ar izsoļu

starpniecību; intelektuālā īpašuma objektu pirkšanas un pārdošanas pakalpojumi
36 finanšu konsultāciju pakalpojumi; debitoru prasību pirkšanas un pārdošanas pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 672
 (210) **Pieteik.** M-14-162
 (531) **CFE ind.** 26.3.4; 26.3.7

(151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (220) **Pieteik.dat.** 11.02.2014

(111) **Reģ. Nr.** M 67 669
 (210) **Pieteik.** M-14-134
 (531) **CFE ind.** 14.7.1

(151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (220) **Pieteik.dat.** 05.02.2014



AUCTION HOUSE

(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) **35** uzņēmumu un uzņēmējdarbības projektu pirkšanas un pārdošanas pakalpojumi, arī ar izsoļu starpniecību; uzņēmumu akciju un daļu pirkšanas un pārdošanas pakalpojumi; intelektuālā īpašuma objektu pirkšanas un pārdošanas pakalpojumi
36 finanšu konsultāciju pakalpojumi; debitoru prasību pirkšanas un pārdošanas pakalpojumi



Rīgas Šķirētiesa

Mediācija. Šķirētiesa. Izsoles.

(732) **Īpašn.** LATVIJAS ŠĶĪRĒJTIESU ATBALSTA SABIEDRĪBA, SIA; E. Birznieka-Upīša iela 18-7, Rīga LV-1050, LV
 (511) **35** izsoļu pakalpojumi
45 juridiskie pakalpojumi; mediācijas pakalpojumi; šķirētiesu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 673
 (210) **Pieteik.** M-14-163
 (531) **CFE ind.** 26.3.4; 26.3.7

(151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (220) **Pieteik.dat.** 11.02.2014



Rīgas Šķirētiesa

Mediation. Arbitration. Auctions.

(111) **Reģ. Nr.** M 67 670
 (210) **Pieteik.** M-14-142

(151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (220) **Pieteik.dat.** 06.02.2014

NUSSBEISSER

(732) **Īpašn.** MONDELEZ EUROPE GMBH; Lindbergh-Allee 1, 8152 Glattpark, CH
 (740) **Pārstāvis** Vladimirs ANOHINS, Aģentūra 'TRIA ROBIT'; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010
 (511) **30** kakao, no kakao un šokolādes pagatavoti dzērieni un preparāti šo dzērienu pagatavošanai; šokolāde; nemedicīniski konditorejas izstrādājumi, it īpaši šokolādes izstrādājumi un cukura izstrādājumi; biskvīti, vafeles, kūkas, konditorejas izstrādājumi, maizes produkti un mīklas produkti; graudaugu izstrādājumi; pārtikas ledus, saldējums, saldējuma izstrādājumi, saldēti saldumi un deserti; atdzesēti saldumi un deserti; šokolādes ziežamā masa

(732) **Īpašn.** LATVIJAS ŠĶĪRĒJTIESU ATBALSTA SABIEDRĪBA, SIA; E. Birznieka-Upīša iela 18-7, Rīga LV-1050, LV
 (511) **35** izsoļu pakalpojumi
45 juridiskie pakalpojumi; mediācijas pakalpojumi; šķirētiesu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 674
 (210) **Pieteik.** M-14-176
 (531) **CFE ind.** 5.13.25; 24.1.15; 24.1.17; 24.9.7; 27.5.21

(151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (220) **Pieteik.dat.** 14.02.2014

(111) **Reģ. Nr.** M 67 671
 (210) **Pieteik.** M-14-147
 (531) **CFE ind.** 2.9.10; 26.4.1; 26.4.5; 26.4.16; 26.4.24; 29.1.12

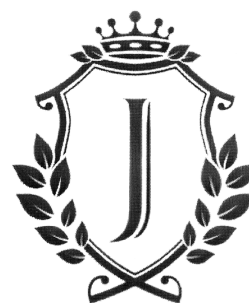
(151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (220) **Pieteik.dat.** 06.02.2014



Concordia

zobārstniecības klīnika

(591) **Krāsu salikums** violets, balts
 (732) **Īpašn.** MOLĀRS M G, SIA; Nākotnes iela 6-27, Ķekava, Ķekavas nov. LV-2123, LV
 (740) **Pārstāvis** Brigita TĒRAUDA; Dzirnau iela 60A-32, Rīga LV-1050
 (511) **44** zobārstniecības pakalpojumi



JURIGA

(732) **Īpašn.** JURIGA, SIA; Terēzes iela 1, Rīga LV-1012, LV
 (740) **Pārstāvis** Ķina DOLGICERE, Patentu aģentūra 'KDK'; Dzērbenes iela 27, Rīga LV-1006

(511) **34** tabaka; košļājamā tabaka; cigāri; cigaretes, kas satur tabakas aizstājējus, ne medicīniskiem nolūkiem; cigaretes, cigarillas; žāvēti augi un to daļas smēķēšanai; šņaucamā tabaka; grieztā tabaka; tabakas smalkumi; dzeltenā dzintara uzgaļi cigāru un cigarešu iemušiem; tabakmaki; filtrējošie cigarešu iemuši no korķa vai ēnā žāvētām tabakas augšējām lapām; pīpes; ierīces cigāru galu apgriešanai; cigāru un cigarešu portsigāri; cigāru iemuši; kabatas formāta ierīces cigarešu uztīšanai;

cigarešu iemuši; cigarešu uzgaļi; pīpju tīrītāji; pīpju paliktni; trauki tabakas glabāšanai; šņaucamās tabakas kastītes; pelnu trauki; sļaujamatruki smēķētājiem; koka vai akrila kārbas cigarešu, cigāru vai tabakas uzglabāšanai noteiktā mitrumā (humidori); sērkociņi; sērkociņu turētāji; sērkociņu kastītes; šķiltavas smēķētājiem; gāzes baloniņi cigāru šķiltavām; šķiltavu krami; butāna gāzes baloniņi šķiltavām; sašķidrinātas gāzes rezervuāri cigarešu šķiltavām; cigarešu filtri; cigarešu filtru komplekti no celulozes; cigarešu papīra grāmatīņas; absorbējošs papīrs pīpēm; cigarešu papīrs

(111) **Reģ. Nr.** M 67 675 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-196 (220) **Pieteik.dat.** 20.02.2014
 (531) **CFE ind.** 24.17.4; 27.5.1

The logo features the word 'Premia' in a stylized, cursive script font, with 'FRUIT!' in a bold, blocky, sans-serif font below it. A large exclamation mark is integrated into the end of the 'FRUIT!' text.

- (732) **Īpašn.** PREMIA TALLINNA KÜLMHOONE AS; Betooni 4, 11415 Tallinn, EE
 (740) **Pārstāvis** Jānis BĒRZS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010
 (511) **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

(111) **Reģ. Nr.** M 67 676 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-223 (220) **Pieteik.dat.** 21.06.2013

FOX SPORTS 1

- (600) Kopienas preču zīmes 011920998 konversija
 (732) **Īpašn.** TWENTIETH CENTURY FOX FILM CORPORATION; 10201 West Pico Boulevard, Los Angeles CA 90035, US
 (740) **Pārstāvis** Aleksandra FORTŪNA, "FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra", SIA; a/k 98, Rīga LV-1050
 (511) **9** zinātniskie, kuģniecības, ģeodēziskie, fotogrāfiskie, kinematogrāfiskie, optiskie, svēršanas, mērīšanas, signalizācijas, kontroles (pārbaudes), glabšanas 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; magnētiskās informācijas vides, ieraksta diski; kompaktdiski, DVD diski un citi digitālie datu nesēji; mehānismi ar naudu iedarbināmiem aparātiem; kases aparāti, rēķināšanas mašīnas, informācijas apstrādes ierīces, datori; datoru programmatūra; ugunsdzēsības ierīces; skaitāmie kauliņi; elektriskie akumulatori; skābes hidrometri; acidometri baterijām; akustiskie pārvadi; akustiskie saistelementi; aktinometri; skaitļošanas mašīnas; virszemes antenas; aerometri; gaisa analīzes aparāti; elektriskie trauksmes signālvani; signālierīces, ciktāl tās attiecas uz šo klasi; alkometri; alidādes; altimetri; ampēometri; pastiprinātāji; pastiprinātājlampas; anemometri; animācijas filmas; anodbaterijas; anodi; automātiskie atbildētāji; brilles, kas novērš apzīlšanu; aizklāji, kas novērš apzīlšanu; elektrības piegādes traucējumu novēršanas ierīces; pretaizdzīšanas ierīces; antikatori; apertometri; aparāti un iekārtas rentgena

staru ieguvei, kas nav paredzētas medicīniskiem nolūkiem; aparāti un instrumenti astronomijai; aparāti un instrumenti fizikai; ierīces skaņuplašu atskaņotāju adatiņu nomainīšanai; aparāti kinofilmu montēšanai; laboratorijas iekārtas fermentācijas procesiem; ierīces, kas paredzētas ādu biežuma mērīšanai; frankēšanas zīmju pārbaudes aparāti; ierīces, kas paredzētas izstrādātu ādas biežuma mērīšanai; enkuri (elektriskie); azbesta apģērbs aizsardzībai pret uguni; azbesta cimdi aizsardzībai pret nelaimes gadījumiem; azbesta aizsegi ugunsdzēsējiem; audiovizuālie uztvērēji; audiovizuālie mācību aparāti; bankas automāti; automātiskie pazemināta transportlīdzekļu riepu spiediena indikatori; instrumenti azimuta noteikšanai; klēpj datoriem paredzētas somas; bezmēni; līdzsvarošanas aparāti; svītrkodu nolasītāji; barometri; elektriskās baterijas; elektriskās baterijas transporta līdzekļiem; baterijas apgaismes ierīcēm; akumulatoru kārbas; akumulatoru uzlādēšanas ierīces; akumulatoru tvertnes; gaismas bākas (signālierīces); signālvani (brīdināšanas ierīces); betatroni; binokļi; mirgojošas signālierīces; gaismas kopēšanas aparāti; boileru kontroles ierīces; elektrības vadu nozarkārbas; elpošanas aparāti, izņemot aparātus mākslīgajai elpināšanai; elpošanas aparāti zemūdens peldēšanai; ložu necaurīdīgas vestes; elektriskie zimmeri; skaļruņu korpusi; elektriskie kabeļi; skaitļošanas diski; skaitļošanas mašīnas; kalibrēšanas gredzeni; bīdmēri; portatīvās videokameras; fotoaparāti; kondensatori; kapilārās caurulītes; leņķmēri galdniekiem; fotoplašu kasetes; futrāļi fotoaparātiem un fotopiederumiem; secēšanas instrumentu futrāļi mikroskopijai; kases aparāti; kasešu atskaņotāji; katodi; pretkorozijas apstrādes katodu ierīces; mobilo telefonu aukliņas; iekārtas diapozitīvu iecentrēšanai; centrālie procesori; elektrisko bateriju uzlādes ierīces; ķīmijas aparāti un instrumenti; mikroshēmas; droseles; hromatogrāfijas aparātu laboratorijas vajadzībām; hronogrāfi; kinokameras; eksponētas kinofilmas; jaudas slēdži; slēdži; aparātu skaņuplašu tīrīšanai; klinometri; apģērbi, kas īpaši paredzēti darbam laboratorijās; apģērbi aizsardzībai pret nelaimes gadījumiem, radiāciju un uguni; apģērbi aizsardzībai pret uguni; koaksiālie kabeļi; elektriskās spoles; ar monētām iedarbināmi mehānismi televizoriem; elektriskie kolektori; komutatori; kompaktdisku atskaņotāji; audio-video kompaktdiski; lasāmatmiņas kompaktdiski; komparatori; cirkuļi; datorspēļu programmas; datoru tastatūras; datoru atmiņas ierīces; ierakstītas datoru operētājprogrammas; datoru perifērijas ierīces; ierakstītas datorprogrammas; datorprogrammas (lejupielādējama programmatūra); ierakstīta datorprogrammatūra; datori; elektriskie vadi; savienojumi elektrolīnijām; elektriskie savienojumi; kontaktlēcas; elektriskie kontakti; konteineri kontaktlēcām; konteineri mikroskopu stikliņu glabāšanai; elektrības vadības paneļi; elektriskās enerģijas pārveidotāji; izolēti vara vadi; koriģējošās optiskās lēcas; kosmogāfiskie instrumenti; savienotājelementi informācijas apstrādes ierīcēm; elektriskie savienojumi; pārsegi kontaktlīdzdām; avāriju testu manekeni; laboratorijas tīģeļi; taisngrieži; ciklotroni; spuldzes aptumšotām telpām fotofilmu apstrādei; fotolaboratorijas; informācijas apstrādes ierīces; dekompresijas kameras; dekoratīvie magnēti; magnētisko lentu atmagnetizēšanas ierīces; blīvuma mērītāji; densimetri; densitometri; detektori; diagnostikas ierīces, kas nav paredzētas izmantošanai medicīnā; akustiskās diafragmas; diafragmas zinātniskajai aparātūrai; diafragmas fotogrāfijai; diktofoni; difrakcijas aparāti mikroskopijai; digitālo fotogrāfiju rāmji; kompasi; datoru diskdziņi; magnētiskie diski; attāluma mērīšanas aparāti; attāluma reģistrēšanas ierīces; destilācijas aparāti zinātniskiem nolūkiem; elektrības sadales paneļi; elektrības sadales kārbas; elektrības vadības pultis; nirēju sejas maskas; nirēju tērpi; DNS mikroshēmas;

svilpes komandu došanai suņiem; dozimetri; lejupielādējamas attēlu datnes (faili); lejupielādējamas mūzikas datnes (faili); lejupielādējami zvanu signāli mobilajiem telefoniem; drēbnieku mērlentes; žāvēšanas aparātūra fotogrāfijām; fotogrāfiju vai negatīvu žāvēšanas statīvi; kanāli elektrības vadiem; ciparvideodisku (DVD) atskaņotāji; dinamometri; ausu aizbāžņi nirējiem; ovoskopi; elektriskie aparāti komutācijai; elektriskā tālvadības aparātūra aizdedzes iedarbināšanai; elektriskās gāzizlādes caurules; elektriskie durvju zvani; elektroiekārtas ražošanas procesu tālvadībai; elektrības zuduma indikatori; izolēti elektriskie vadi; elektriskie žogi; elektrificētas kopnes prožektoru montāžai; elektrodinamiskie aparāti dzelzceļa pārmiju tālvadībai; elektrodinamiskie aparāti signālu tālvadībai; elektrolīzes aparāti; elektromagnētiskās spoles; elektroniskie plānotāji; elektroniskie informācijas stendi; elektroniskās pildspalvas (displeju elementi); elektroniskās kabatas formāta tulkošanas ierīces; lejupielādējamas elektroniskās publikācijas; elektroniskās preču etiķetes; kodētas magnētiskās identifikācijas aprocēs; kodētas magnētiskās kartes; fotogrāfiju palielināšanas aparāti; epidiaskopi; ergometri; fotometri; briļļu futrāji; briļļu ķēdītes; pensneju auklas; pensneju rāmji; okulāri; faksa aparāti; viltotu monētu detektori; optisko šķiedru kabeļi; filmu griešanas aparāti; eksponētas filmas; filtri respiratoriem; ultravioleto staru filtri fotogrāfijai; filtri fotogrāfijai; ugunsgrēka trauksmes signālierīces; ugunsdzēsības rīki liesmu sišanai; segas uguns slāpēšanai; ugunsdzēsības laivas; ugunsdzēsības automašīnas; kāpnes glābšanai no ugunsgrēka; ugunsdzēsāmie aparāti; ugunsdzēsšanas šļūtenes; ugunsdzēsšanas šļūteņu uzgaļi; ugunsdzēsības sūkņi; zibspuldzes fotografēšanai; disketes; fluorescejoši ekrāni; neeksplodzīvas miglas signālierīces; pārtikas produktu analīzes aparāti; diapozitīvu rāmji; frekvenču mērītāji; īpaši laboratorijām izgatavotas mēbeles; drošinātāju ieliktnu kustošās stieples; drošinātāji; galenīta kristāli (detektori); galvaniskās baterijas; galvaniskie elementi; galvanometri; apģērbs aizsardzībai pret uguni; gāzes testēšanas instrumenti; gazometri; mērinstrumenti; stikli ar strāvu vadošu pārklājumu; fotogrāfiju spoguļspodrināšanas aparāti; globālās pozicionēšanas sistēmas iekārtas; cimdi nirējiem; cimdi aizsardzībai pret nelaimes gadījumiem; cimdi aizsardzībai pret rentgena starojumu rūpnieciskiem nolūkiem; aizsargbrilles sportam; stikla mērtrauki; reģi baterijām; brīvroku sistēmas telefoniem; ierakstīšanas ierīču galviņu tīrīšanai paredzētas lentes; austiņas; siltuma regulēšanas iekārtas; heliogrāfi; ierīces apģērba apakšmalas marķēšanai; augstfrekvences aparāti; turētāji elektriskajām spolēm; hologrammas; rupori skaļruņiem; smilšu pulksteņi; hidrometri; higrometri; apvalki elektrības vadu identifikēšanai; pavedieni elektrības vadu identifikēšanai; magnētiskās identifikācijas kartes; inkubatori baktēriju kultūru audzēšanai; elektriskie induktori; instrumenti ar okulāriem; integrālshēmu kartes (viedkartes); čipi (integrētās shēmas); sakaru aparāti; datoru interfeisi; elektrības invertori; mašīnas rēķinu izrakstīšanai; jonizācijas aparāti (izņemot jonizācijas aparātus gaisa vai ūdens apstrādei); šabloni (mērierīces); ar monētām iedarbināmi mūzikas automāti; mūzikas automāti; elektrības savienojumu kārbas; elektrisko kabeļu savienotājumavas; ceļgalu sargi strādniekiem; laboratorijas centrifūgas; laboratoriju paplātes; laktodensimetri; laktometri; klēpjatori; lāzeri, kas nav paredzēti medicīniskiem nolūkiem; objektīvu saules blendes; objektīvi astrofotogrāfijai; vēstuļu svāri; nivelieri; līmeņrāži; drošības jostas; glābšanas bojas; glābšanas vestes; glābšanas tīkli; glābšanas aparātūra un iekārtas; glābšanas plosti; optiskās šķiedras; elektriskie gaismas regulatori; gaismas diodes (LED); elektroniskie rādāmie kociņi ar gaismas staru; balasta

pretestības elementi; zibensnovēdēji; strāvas ierobežotāji; elektriskās slēdzēnes; lagas; skaļruņi; "maģiskās laternas" (attēlu projektori); magnētiskie datu nesēji; magnētiskās kodēšanas ierīces; magnētisko leņšu bloki datoriem; magnētiskās lentes; magnētiskie vadi; magnēti; lupas; manometri; kuģu kompas; jūras dziļuma mērītāji; signālbojas; svītrvilči galdniecībai; masti bezvadu antenām; instrumenti un mašīnas materiālu testēšanai; materiāli elektrības maģistrālēm (vadi, kabeļi); matemātiskā aprēķina instrumenti; mērīšanas ierīces; mērīšanas aparātūra; elektriskās mērīšanas ierīces; mērinstrumenti; mērkarotes; mehāniskās izkārtnes; mehānismi ar monētām iedarbināmiem aparātiem; megafoni; dzīvsudraba līmeņrāži; metāla detektori rūpnieciskiem un militāriem nolūkiem; meteoroloģiskās zondes (baloni); meteoroloģiskie instrumenti; skaitītāji; metronomi; mikrometriskās skrūves optiskajiem instrumentiem; mikrometri; mikrofonu; mikroprocesori; mikroskopi; mikrotomi; attāluma reģistrēšanas ierīces; spoguļi kontroles darbiem; spoguļi (optiskie elementi); modemi; naudas skaitīšanas un šķirošanas mašīnas; elektriskie monitoringa aparāti; datoru monitori; monitorēšanas datorprogrammas; datoru peles; paliktni datoru pelēm; navigācijas aparāti un instrumenti; jūras signālierīces; navigācijas aparātūra sportlīdzekļiem (borta datori); navigācijas instrumenti; neona zīmes; drošības tīkli nelaimes gadījumu novēršanai; deguna spaiļes nirējiem un peldētājiem; piezīmjdatori; objektīvi (optiskās lēcas); novērošanas ierīces; oktanti (mērinstrumenti); ommetri; optiskie aparāti un instrumenti; optiskie rakstzīmju nolasītāji; optiskie kondensatori; optiskie datu nesēji; optiskie diski; optiskie stikli; optikas preces; optiskās lampas; optiskās lēcas; oscilogrāfi; laboratorijas krāsniņas; skābekļa pārliešanas aparātūra; ozonatori; stāvlaika skaitītāji automašīnu stāvvietām; elementārdaļiņu paātrinātāji; pedometri; durvju actiņas; periskopi; personiskie stereoatskaņotāji; Petri trauki; degvielas līmeņa rādītāji; fonogrāfa ieraksti; kopēšanas ierīces; žāvēšanas statīvi fotogrāfijām; fotometri; fototelegrāfijas ierīces; fotogalvaniskie elementi; pensneji; pipetes; Pīto caurules; ģeodēziskās planšetes (mērniecības rīki); planimetri; akumulatoru plates; ploteri; kontaktakšas, kontaktlīdzdas un citi elektriskie kontakti; atsvari; svērteņi; kabatas kalkulatori; polarimetri; portatīvie atskaņotāji; portatīvie telefonaparāti; precīzijas svāri; precīzijas mēraparāti; spiediena indikatoru tapas ventiļiem; spiediena indikatoru; ierīces spiediena mērīšanai; drukāto shēmu plates; drukātās shēmas; printeri, kas paredzēti lietošanai ar datoriem; optiskās prizmas; zondes zinātniskiem nolūkiem; projektori; projicēšanas ekrāni; ierīces aizsardzībai pret rentgenstariem (izņemot medicīniskiem nolūkiem paredzētas); personiskai lietošanai paredzētas ierīces aizsardzībai pret nelaimes gadījumiem; aizsargķiveres; aizsargķiveres sportam; aizsargmaskas, ciktāl tās attiecas uz šo klasi; aizsargtērpi lidotājiem; leņķmēri; perfokaršu mašīnas birojiem; zvanu pogas; pirometri; daudzuma indikatori; radari; peidžeri; radioloģiskā aparātūra rūpnieciskiem nolūkiem; radioloģijas ekrāni rūpnieciskiem mērķiem; radioaparāti; radiotelegrāfu aprīkojums; radiotelefonu aprīkojums; dzelzceļa kustības drošības ierīces; datu nolasīšanas ierīces; skaņuplašu atskaņotāji; elektriskie reduktori; atstarotāji, kurus nēsā satiksmes negadījumu novēršanai; refraktometri; refraktori; elektriskie regulēšanas aparāti; elektriskie releji; tālvadības aparāti; elektriskie rezistori; respiratori gaisa filtrēšanai; respiratori, izņemot maksīgajai elpināšanai paredzētos; manekeni pirmās palīdzības apmācības nolūkiem (mācību ierīces); retortes; retoršu statīvi; apgriezienu skaitītāji; reostati; aizsargķiveres jātniekiem; gaismas vai mehāniskas ceļazīmes; rīkstnieku rīkstes; ģeodēzijas latas; lineāli (mērīšanas instrumenti); mērlentes;

saharometri; drošības jostas, izņemot jostas, kas paredzētas transportlīdzekļu sēdekļiem vai sporta aprīkojumam; aizsargbrezenti; sāļmēri; satelīta navigācijas iekārtas; satelīti zinātniskiem mērķiem; svāri; skeneri (informācijas apstrādes ierīces); cinkogrāfijas rastrī; ekrāni fotogrāfijai; vītņmēri; pusvadītāji; sekstanti; elektrisko kabeļu apvalki; apavi aizsardzībai pret nelaimes gadījumiem, apstarošanu un uguni; fotoaparātu slēdži; ierīces fotoaparāta slēdža iedarbināšanai no attāluma; teleskopiskie tēmēkļi šaujamo ierīcēm; signālzvani; signāllaternas; signālbojas; gaismas vai mehāniskie signalizācijas paneļi; signālsvilpes; gaismas un mehāniskās signālierīces; gaismas zīmes; transportlīdzekļu stūrēšanas un vadīšanas simulatori; sirēnu ierīces; apvāki klēpj datoriem; bīdāmā; diapozitīvu projektori; logaritmiskie lineāli; diapozitīvi; dūmu detektori; elektriski apsildāmas zeķes; saules baterijas; metinātāju aizsargmaskas; solenoīdvārsti (elektromagnētiskie pārslēdzēji); sonāri; skaņas signālierīces; sonometri; skaņas ierakstīšanas aparātūra; skaņu ierakstu nesēji; skaņas ierakstīšanas lentēs; skaņas reproducēšanas aparātūra; skaņas pārraidīšanas aparātūra; ierīces un mašīnas zondēšanai; atsvari lotēm; auklas lotēm; dzirksteļaisargi; rupori; briļļu futrāļi; briļļu rāmji; briļļu stikli; optiskās brilles; spektrogrāfi; spektroskopu; transportlīdzekļu ātruma kontroles aparātūra; ātruma indikatori; ātruma mērīšanas ierīces izmantošanai fotogrāfijā; ātruma regulēšanas ierīces skaņuplašu atskaņotājiem; sferometri; līmeņrāži; fotofilmu spoles; smidzināšanas sistēmas sprinkleri ugunsdrošībai; skatuves apgaismojuma regulatori; statīvi fotoaparātiem; startera kabeļi motoriem; automātiskās stūrēšanas ierīces transportlīdzekļiem; paaugstinošie transformatori; stereoskopi; stereoskopiskā aparātūra; destilatori laboratorijas eksperimentiem; stroboskopi; adatas skaņuplašu atskaņotājiem; ierīces sulfītu daudzuma noteikšanai (vīnā); saulesbrilles; ģeodēzijas aparātūra un ierīces; ģeodēzijas ķēdes; ģeodēzijas instrumenti; nivelieri; elektrības sadales kārbas; elektisko slēdžu kārbas; elektriskie slēdži; tahometri; lenšu magnetofoni; taksometra skaitītāji; mācību aparātūra; zobu aizsargi; telegrāfa vadi; telegrāfa aparāti; telemetri; telefona aparāti; telefonu klausules; telefonu signāla raidītāji; telefona vadi; teletaipi; televīzijas suflēšanas ierīces; tālvadības pārtraucēji; teleskopi; televīzijas aparāti; uzlīmes temperatūras noteikšanai, ne medicīniskiem nolūkiem; temperatūras indikatori; elektriskās spailes; mēģenes; testēšanas aparātūra, ne medicīniskiem nolūkiem; elektriskās ierīces aizsardzībai pret zagļiem; teodolīti; termoelektroniskās lampas; termometri, ne medicīniskiem nolūkiem; termostati; termostati transportlīdzekļiem; biļešu tirdzniecības automāti; laika reģistrēšanas aparāti; automātiskie laika releji; adapteri (skaņas noņēmēji) atskaņotājiem; totalizatori; konusi satiksmes regulēšanai; luksofori; elektriskie transformatori; elektroniskie tranzistori; elektronisko signālu pārraidītāji; telekomunikāciju sistēmu raidītāji; telekomunikāciju pārraidīšanas aparāt; transponderi; triodes; fotokameru statīvi (trijkāji); urometri; USB zibatmiņas; vakuummētri; vakuuma elektronu lampas; variometri; transportlīdzekļu avārijas zīmes (trīsstūri); radiouztvērēji transportlīdzekļiem; vernjeri; videokasetes; videospēļu kasetnes; videomagnetofoni; videoekrāni; videotelefoni; videolentes; fotoaparātu skatmeklētāji; viskozimetri; sprieguma regulatori transportlīdzekļiem; pārsprieguma aizsargierīces; voltmētri; aparāti vēlēšanu balsu skaitīšanai; integrālskānu daudzslāņu plates; audēju lupas; portatīvie radoraidītāji-uztvērēji (walkie-talkie); trauki fotogrāfiju skalošanai; ūdens līmeņa indikatori; vilņmēri; platformsvāri; svēršanas aparāti un instrumenti; svēršanas iekārtas; atsvari; signalizācijas svilpes; vējraži; elektrisko vadu savienotāji; elektriskie vadi; sejas aizsargmaskas strādniekiem; plaukostas

locītavas paliktņi darbam ar datoru; rentgenstaru aparātūra, ne medicīniskiem nolūkiem; eksponētas rentgenstaru filmas; rentgenuzņēmumi, ne medicīniskiem nolūkiem; rentgenstaru lampas, ne medicīniskiem nolūkiem; lejupielādējamas lietojumprogrammas izmantošanai mobilo komunikāciju ierīcēs digitālo video, video datņu, videospēļu un multivides satura izplatīšanai; lejupielādējami audio un video ieraksti ar sporta tematiku; lejupielādējami televīzijas šovi un videoieraksti ar sporta tematiku telesakari; kabeļtelevīzijas apraide; mobilo telefonu sakari; sakari, izmantojot datoru terminālus; sakaru pakalpojumi, izmantojot optiskos tīklus; telegrāfa sakaru pakalpojumi; telefona sakaru pakalpojumi; datorizēta ziņojumu un attēlu pārraidīšana; elektronisko ziņojumu dēļu pakalpojumi; elektroniskā pasta pakalpojumi; faksimilpārraide; informācija par telesakariem; ziņojumu sūtīšana; peidžeru pakalpojumi, kas tiek sniegti ar radio, telefona vai citu elektronisko sakaru līdzekļu starpniecību; piekļuves nodrošināšana datu bāzēm; tiešsaistes tērzētavu (čata istabu) darbības nodrošināšana; tiešsaistes forumu darbības nodrošināšana; telekomunikāciju kanālu nodrošināšana preču iegādei no attāluma; telesakaru savienojumu nodrošināšana ar globālo datortīklu; lietotāju piekļuves nodrošināšana globālajiem datortīkliem; radioaprāide; pieejas laika noma globālajiem datortīkliem; faksimilaparātu noma; e-pastu sūtīšanas aparātu noma; modemu noma; telesakaru ierīču noma; telefonu noma; satelītsakari; maršrutēšanas un savienojumu veidošanas pakalpojumi; elektroniskā pasta pakalpojumi; telekonferenču pakalpojumi; telegrāfa pakalpojumi; telefona sakaru pakalpojumi; televīzijas apraides pakalpojumi; telesakaru pakalpojumi; digitālo datņu nosūtīšana; apsveikuma kartīšu nosūtīšana tiešsaistē; telegrammu pārraidīšana; videokonferenču rīkošanas pakalpojumi; balss pasta pakalpojumi; ziņu aģentūru pakalpojumi; bezvadu apraide; televīzijas apraides un televīzijas pārraides pakalpojumi; radioaprāide

41 audzināšanas pakalpojumi; apmācība; izpriecu pakalpojumi; sporta un kultūras pakalpojumi; augstāko vai speciālo vidējo mācību iestāžu pakalpojumi; atrakciju parku pakalpojumi; dzīvnieku apmācība; kolokviju organizēšana un vadīšana; koncertu rīkošana un vadīšana; konferenču organizēšana un vadīšana; kongresu organizēšana un vadīšana; semināru organizēšana un vadīšana; simpoziju organizēšana un vadīšana; radošo semināru organizēšana un vadīšana; skaistumkonkursu organizēšana; internātskolu pakalpojumi; vietu rezervēšana uz izklaides pasākumiem; pārvietojamo bibliotēku pakalpojumi; kaligrāfijas pakalpojumi; filmu demonstrēšana; cirku pakalpojumi; klubu pakalpojumi izklaides vai izglītības nolūkiem; apmācība (koučings); fitnesa nodarbību vadīšanas pakalpojumi; neklātienas apmācības kursu pakalpojumi; diskžokeju pakalpojumi; diskotēku pakalpojumi; dublēšanas pakalpojumi; informācija par izglītību; apmācības pakalpojumi, kas saistīti ar eksāmenu kārtošanu; elektronisko publikāciju sagatavošanas un publicēšanas pakalpojumi; viesu izklaides pakalpojumi; informācijas pakalpojumi par izklaides jautājumiem; filmu producēšana, izņemot reklāmfilmās; azartspēles; spēļu pakalpojumi, kas tiek nodrošināti tiešsaistē no datortīkla; spēļu piederumu noma; vingrošanas apmācība; veselības klubu pakalpojumi; brīvdienas nometņu pakalpojumi (izklaide); tulkus pakalpojumi; maketēšanas pakalpojumi, izņemot pakalpojumus reklāmas vajadzībām; bibliotēku pakalpojumi; mikrofilmēšana; modeļu pakalpojumi māksliniekiem; kinostudiju pakalpojumi; mūzikas komponēšana; variētē programmu veidošana; ziņu reportieru pakalpojumi; naktsklubu pakalpojumi; bērnu darzu pakalpojumi; loteriju un izložu organizēšana; orķestru pakalpojumi; baļļu

organizēšana; sacensību organizēšana (izglītības vai izklaides jomā); izstāžu organizēšana kultūras vai izglītības nolūkos; modes skašu rīkošana izklaides nolūkos; izrāžu organizēšana (impresāriju pakalpojumi); sporta sacensību organizēšana; atpūtas pasākumu programmu plānošana (izklaide); individuālo fitnesa treneru pakalpojumi; fotoreportāžu sagatavošana; fotografēšanas pakalpojumi; fiziskās audzināšanas pakalpojumi; apmācība praktisko iemaņu apgušanā (demonstrēšana); teatralizētu izrāžu pakalpojumi; mūzikas producēšana; radio un televīzijas programmu veidošana; šovu producēšana; spēļu zāļu pakalpojumu nodrošināšana; kazino un azartspēļu pakalpojumi; golfa spēles nodrošināšanas pakalpojumi; karaoke pakalpojumu nodrošināšana; muzeju pakalpojumi (prezentācijas, izstādes); nelejupielādējamu elektronisku publikāciju nodrošināšana tiešsaistes režīmā; izklaides pakalpojumu nodrošināšana; sporta pakalpojumu nodrošināšana; grāmatu izdošana; elektronisko grāmatu un žurnālu publicēšana tiešsaistes režīmā; tekstu publicēšana (izņemot reklāmas tekstus); izklaides pakalpojumi, izmantojot radio; ierakstu studiju pakalpojumi; informācijas sniegšana par atpūtas pasākumiem; reliģiskās izglītības pakalpojumi; audioiekārtu noma; digitālo videokameru noma; kinofilmu noma; teātra un televīzijas studiju apgaismes aparatūras noma; kinoprojektoru un to piederumu noma; radio un televīzijas aparātu noma; izrāžu dekorāciju noma; niršanas aprīkojuma noma; skaņu ierakstu noma; sporta inventāra noma (izņemot transportlīdzekļus); sporta laukumu noma; stadionu noma; skatuves dekorāciju noma; tenisa kortu noma; videomagnetofonu (ierakstīšanas ierīču) noma; videolenšu noma; scenāristu pakalpojumi; skolu pakalpojumi; zīmju valodas tulkošana; sporta nometņu pakalpojumi; subtitru izgatavošana; izklaides pakalpojumi televīzijas raidījumu veidā; teātra uzvedumu pakalpojumi; biļešu aģentūru pakalpojumi (izklaide); hronometrēšanas pakalpojumi sporta pasākumos; rotaļlietu noma; tulkošana; mācīšana; videoierakstu rediģēšana; videofilmu producēšana; videoierakstu veidošana; profesionālās orientācijas pakalpojumi (padomu sniegšana izglītības vai apmācības jautājumos); profesionālās pārkvalificēšanas pakalpojumi; tekstu rakstīšana (izņemot reklāmas tekstus); zooloģisko dārzu pakalpojumi; informācijas nodrošināšana tiešsaistē televīzijas, kinofilmu un videoizklaides jomā; televīzijas, kinofilmu un video izklaides nodrošināšana, izmantojot bezvadu sakaru ierīces; izklaides pakalpojumi nelejupielādējamu video un attēlu veidā, kas ietver tādus televīzijas šovus un izklaidi, kas tiek raidīti, izmantojot Internetu un bezvadu sakaru tīklus; datorspēļu nodrošināšana tiešsaistē izklaides nolūkos; žurnāli, proti, dienasgrāmatas tiešsaistē, kas satur privātu informāciju un viedokļus; izklaides un kultūras pasākumu organizēšanas pakalpojumi; izklaide sacensību, konkursu un spēļu veidā

(111) **Reģ. Nr.** M 67 677 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-228 (220) **Pieteik.dat.** 25.02.2014
 (531) **CFE ind.** 26.1.1; 26.1.24; 29.1.12



(591) **Krāsu salikums** brūns, balts
 (732) **Īpašn.** Ainars VLADIMIROVS; Kūdras iela 4-44, Rīga LV-1083, LV
 (740) **Pārstāvis** Mila KOHANA; Ceriņu iela 2, Liepupes pag., Salacgrīvas nov. LV-4023
 (511) **35** sabiedrisko attiecību, reklāmas un mārketinga pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 678 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-237 (220) **Pieteik.dat.** 26.02.2014
 (531) **CFE ind.** 27.5.4; 29.1.12



(591) **Krāsu salikums** sarkans, melns
 (732) **Īpašn.** Laila BĒRZIŅA; Avenņu iela 1, Cēsis, Cēsu nov. LV-4101, LV
 (511) **28** galda spēļu komplekti

(111) **Reģ. Nr.** M 67 679 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-241 (220) **Pieteik.dat.** 26.02.2014

The Banja

(732) **Īpašn.** BBH INVESTMENTS, SIA; Jūras iela 23/25, Jūrmala LV-2015, LV
 (511) **41** audzināšana; apmācība; izpriecās; sporta un kultūras pasākumi
43 apgāde ar uzturu; viesu izmitināšana
44 ārstnieciskā aprūpe; veterinārie pakalpojumi; veselības un skaistumkopšanas pakalpojumi cilvēkam un dzīvniekiem; lauksaimniecības, dārzkopības un mežkopības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 680 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-242 (220) **Pieteik.dat.** 27.02.2014

Gun-dene

(732) **Īpašn.** Georgijs KONKOVŠ; Aristīda Briāna iela 16-10, Rīga LV-1001, LV
 (511) **29** žāvēti (kaltēti) un termiski apstrādāti augļi un dārzeņi
30 tēja, fermentētas augu tējas un to maisījumi
35 pārtikas produktu tirdzniecība
40 lauksaimniecības un dārzkopības produktu kaltēšanas pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 681 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-252 (220) **Pieteik.dat.** 27.02.2014
 (531) **CFE ind.** 2.9.10; 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** ziils, melns, balts
 (732) **Īpašn.** BALTIC MEDICAL GROUP, SIA; Katrīnas dambis 24-6, Rīga LV-1045, LV
 (740) **Pārstāvis** Jeļena VAHTINA; Katrīnas dambis 24-6, Rīga LV-1045
 (511) **35** reklāma; darījumu vadīšana

(111) **Reģ. Nr.** M 67 682 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-253 (220) **Pieteik.dat.** 27.02.2014
 (531) **CFE ind.** 2.3.5; 2.3.16; 2.3.23; 5.5.2; 5.5.20; 5.5.21; 29.1.13



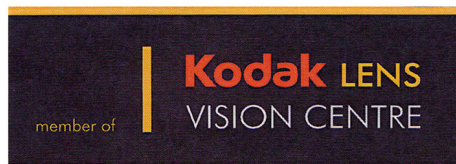
(591) **Krāsu salikums** violets, melns, balts
 (732) **Īpašn.** BALTIC MEDICAL GROUP, SIA; Katrīnas dambis 24-6, Rīga LV-1045, LV
 (740) **Pārstāvis** Jeļena VAHTINA; Katrīnas dambis 24-6, Rīga LV-1045
 (511) **35** reklāma; darījumu vadīšana

(111) **Reģ. Nr.** M 67 683 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-254 (220) **Pieteik.dat.** 27.02.2014
 (531) **CFE ind.** 27.7.1; 27.7.11; 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** zils, pelēks, melns, balts
 (732) **Īpašn.** BALTIC MEDICAL GROUP, SIA; Katrīnas dambis 24-6, Rīga LV-1045, LV
 (740) **Pārstāvis** Jeļena VAHTINA; Katrīnas dambis 24-6, Rīga LV-1045
 (511) **35** reklāma; darījumu vadīšana

(111) **Reģ. Nr.** M 67 684 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-256 (220) **Pieteik.dat.** 28.02.2014
 (531) **CFE ind.** 26.4.5; 26.4.12; 26.4.22; 26.4.24; 29.1.14



(591) **Krāsu salikums** sarkans, dzeltens, melns, balts
 (732) **Īpašn.** EASTMAN KODAK COMPANY; 343 State Street, Rochester NY 14650, US
 (740) **Pārstāvis** Anda BRIEDE, Aģentūra "INTELS Latvija"; Akadēmijas laukums 1, Rīga LV-1050
 (511) **9** oftalmiskās lēcas; briļļu lēcas, tostarp plastmasas lēcas, koriģējošās lēcas, progresīvās lēcas, saulesbriļļu lēcas, polarizējošās lēcas, tonētās lēcas, gaismjutīgās lēcas, fotohromatiskās lēcas, apstrādātas lēcas, lēcas ar pārklājumu, gaismu neatstarojošās lēcas, daļēji apstrādātas lēcas, briļļu lēcu sagataves, daļēji apstrādātas briļļu lēcu sagataves, visu minēto preču maki un futrāļi
44 optiķu pakalpojumi; optometrijas pakalpojumi; optometristu pakalpojumi; izrakstīto briļļu un kontaktlēcu pielāgošana un izsniegšana

(111) **Reģ. Nr.** M 67 685 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-257 (220) **Pieteik.dat.** 28.02.2014
 (531) **CFE ind.** 26.1.1; 26.1.3; 26.1.12; 29.1.14



(591) **Krāsu salikums** zils, sarkans, melns, balts
 (732) **Īpašn.** MEDIA CENTRS "KURZEME", SIA; Aizputes iela 10, Kuldīga, Kuldīgas novads LV-3301, LV
 (511) **38** telekomunikāciju pakalpojumi, to skaitā Interneta pieslēguma nodrošināšana un kabeļtelevīzijas apraide

(111) **Reģ. Nr.** M 67 686 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-265 (220) **Pieteik.dat.** 03.03.2014
 (531) **CFE ind.** 27.5.11; 27.5.19; 29.1.12



(591) **Krāsu salikums** gaiši zils, balts
 (732) **Īpašn.** BALTIC MOBILE, SIA; Jenotu iela 10, Rīga LV-1082, LV
 (740) **Pārstāvis** Valerijs SIKKO; a/k 23, Rīga LV-1025
 (511) **9** fotogrāfiskie un kinematogrāfiskie aparāti; aparāti skaņas vai attēlu ierakstam, pārraidei vai reproducēšanai; magnētiskās informācijas vides, ieraksta diski, digitālie datu nesēji; informācijas apstrādes ierīces, datori; datoru programmatūra
11 ēdiena termiskās apstrādes ierīces un aparāti
14 pulksteņi
15 mūzikas instrumenti
21 mājturības un virtuves piederumi un ierīces
28 spēles, kas ietvertas šajā klasē

(111) **Reģ. Nr.** M 67 687 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-266 (220) **Pieteik.dat.** 17.04.2014

BRASLAS KROGS

(732) **Īpašn.** Baiba SMILGA; "Braslas krasts", Straupes pag., Pārgaujas nov. LV-4152, LV
 (511) **43** apgāde ar uzturu; viesu izmitināšana

(111) **Reģ. Nr.** M 67 688 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-268 (220) **Pieteik.dat.** 04.03.2014
 (531) **CFE ind.** 11.7.3; 27.3.15; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** sarkans, zaļš, balts
 (732) **Īpašn.** ECONOM CLASS, SIA; Elizabetes iela 22-4, Rīga LV-1050, LV
 (740) **Pārstāvis** Aleksandrs LAUBERTS; Elizabetes iela 22-4, Rīga LV-1050
 (511) **35** apģērbu mazumtirdzniecības pakalpojumi, arī ar Interneta starpniecību

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 689 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-270 (220) **Pieteik.dat.** 04.03.2014
 (531) **CFE ind.** 2.3.1; 29.1.12



- (591) **Krāsu salikums** zils, balts
 (732) **Īpašn.** LIELMUIŽA, SIA; Ausekļa iela 18, Jūrmala LV-2008, LV
 (740) **Pārstāvis** Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010
 (511) **35** kosmētisko līdzekļu, matu kosmētisko līdzekļu, ķermeņa kopšanas līdzekļu, higiēnas līdzekļu, parfimērijas izstrādājumu un skaistumkopšanas līdzekļu vairumtirdzniecības un mazumtirdzniecības pakalpojumi, arī ar Interneta starpniecību; manikīra un pedikīra piederumu un instrumentu, frizieru piederumu, frizieriem paredzētu instrumentu un elektroierīču vairumtirdzniecības un mazumtirdzniecības pakalpojumi, arī ar Interneta starpniecību; skaistumkopšanas salonu un frizētavu aprīkojuma vairumtirdzniecības un mazumtirdzniecības pakalpojumi, arī ar Interneta starpniecību
37 manikīra un pedikīra piederumu un instrumentu apkope un remonts; frizieru instrumentu un frizieriem paredzētu elektroierīču apkope un remonts; skaistumkopšanas salonu un frizētavu aprīkojuma apkope un remonts
44 skaistumkopšanas salonu un frizētavu aprīkojuma, kā arī manikīra un pedikīra ierīču un iekārtu noma

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 690 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-273 (220) **Pieteik.dat.** 05.03.2014
 (531) **CFE ind.** 26.4.1; 26.4.22; 26.4.24; 27.5.4; 28.1



- (732) **Īpašn.** NATIONAL BISCUITS & CONFECTIONERY CO. LTD.; Jeddah, Industrial Area-Fourth Phase, P.O.Box 8680, 21492 Jeddah, SA
 (740) **Pārstāvis** Valentīna SERGEJEVA; a/k 16, Rīga LV-1083
 (511) **29** gaļa, zivis, mājputni un medījumi; gaļas ekstrakti; konservēti, žāvēti (kaltēti) un termiski apstrādāti augļi un

- dārzeni; ievārijumi, želejas, konservēti pārtikas produkti; kartupeļu čipsi un kartupeļu kraukšķi; putukrējums (piena produkts), piens, iebiezināts piens un citi piena produkti; olas; pārtikas eļļas un tauki; konservēti un marinēti dārzeni, kas ietverti šajā klasē
30 kafija, tēja, kakao, kafijas aizstājēji; rīsi; tapioka un sāgo; milti un labības produkti; maize, cepumi, kūkas un konditorejas izstrādājumi; pastas; saldējums; cukurs, medus, melases sīrups; raugs, cepamais pulveris; sāls; sinepes; pipari, etiķis, garšvielu mērces, garšvielas; pārtikas ledus; tomātu mērce, kečups, mērce (kas ietvertas šajā klasē), gaļas mērce; grauzdēti kukurūzas izstrādājumi (kas ietverti šajā klasē), arī popkorns

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 691 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-278 (220) **Pieteik.dat.** 05.03.2014
 (531) **CFE ind.** 25.3.1; 25.3.3; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** brūns, zeltains, oranžs
 (732) **Īpašn.** HRG-LUX, SIA; "Laidas", Priedaine, Kurmāles pag., Kuldīgas nov. LV-3301, LV
 (511) **35** pārtikas produktu, mājsaimniecības piederumu, sadzīves tehnikas, dārzkopības piederumu, dārzkopībai paredzētu līdzekļu, kancelejas preču, būvmateriālu, mēbeļu, tekstilizstrādājumu, tabakas izstrādājumu, alkoholisko un bezalkoholisko dzērienu vairumtirdzniecības un mazumtirdzniecības pakalpojumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 692 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-281 (220) **Pieteik.dat.** 06.03.2014
 (531) **CFE ind.** 18.3.21; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** zils, pelēks, balts
 (732) **Īpašn.** MARINE UNDERWRITING SERVICES, SIA; Baznīcas iela 4a, Rīga LV-1010, LV
 (740) **Pārstāvis** Jūlija KAZMINA; Baznīcas iela 4a, Rīga LV-1010
 (511) **36** apdrošināšana; darījumi ar naudu

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 693 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-285 (220) **Pieteik.dat.** 06.03.2014
 (531) **CFE ind.** 26.3.4; 29.1.12



- (591) **Krāsu salikums** sarkans, balts

- (732) **Īpašn.** MEGO, SIA; Krustpils iela 12, Rīga LV-1073, LV
 (740) **Pārstāvis** Aleksandrs AFANASJEVS; Krustpils iela 12, Rīga LV-1073
 (511) **35** lielveikalu mazumtirdzniecības pakalpojumi pārtikas un mājsaimniecības preču jomā; dažādu preču atlase un izvietošana citu personu labā, lai dotu patērētājiem iespēju šīs preces ērti aplūkot un iegādāties

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 694 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-290 (220) **Pieteik.dat.** 07.03.2014

SYNOTtip sporta bārs

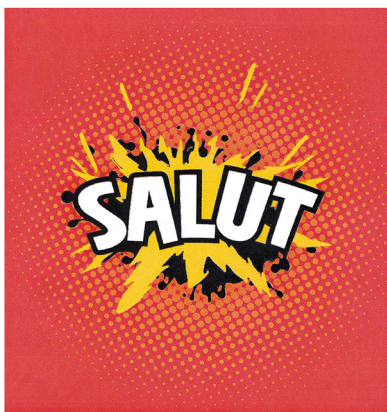
- (732) **Īpašn.** JOKER LTD, SIA; Katrīnas iela 12, Rīga LV-1045, LV
 (740) **Pārstāvis** Lelde MELĶE; Katrīnas iela 12, Rīga LV-1045
 (511) **43** bāru pakalpojumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 695 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-293 (220) **Pieteik.dat.** 10.03.2014
 (531) **CFE ind.** 27.5.4; 29.1.12

La Veranda
 RESTAURANT

- (591) **Krāsu salikums** tumši sarkans, balts
 (732) **Īpašn.** Natalia PERVAK; Jaunā iela 12, Jūrmala LV-2015, LV
 (511) **43** apgāde ar uzturu

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 696 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-298 (220) **Pieteik.dat.** 10.03.2014
 (531) **CFE ind.** 1.15.7; 25.7.7; 29.1.14



- (591) **Krāsu salikums** sarkans, dzeltens, melns, balts
 (732) **Īpašn.** LEVERSA, SIA; Augusta Dombrovska iela 42-51, Rīga LV-1015, LV
 (740) **Pārstāvis** Jevgeņijs FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA; a/k 98, Rīga LV-1050
 (511) **29** kartupeļu uzkodas, uzkodas uz kartupeļu bāzes, kartupeļu čipsi, kartupeļu salmiņi; popkorns; pārtikā lietojami rieksti, sāļīti rieksti, grauzdēti rieksti

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 697 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-299 (220) **Pieteik.dat.** 11.03.2014
 (531) **CFE ind.** 24.17.4; 26.1.1



- (732) **Īpašn.** Sanita GRIĶE; Konkordijas iela 38A, Jūrmala LV-2015, LV
 Sergejs IVANČENKO; Ieriķu iela 24, Rīga LV-1084, LV
 Jānis ELKSNINŠ; Bulduru prospekts 49, Jūrmala LV-2010, LV
 (740) **Pārstāvis** Anda BRIEDE, Aģentūra "INTELS LATVIJA"; Akadēmijas laukums 1, Rīga LV-1050
 (511) **16** iespiedprodukcija, tostarp dienasgrāmatas, kalendāri, burtnīcas, pierakstu klades, bloknoti; kancelejas preces (izņemot mēbeles); papīrs, kartons un izstrādājumi no šiem materiāliem, kas ietverti šajā klasē; fotogrāfijas; rakstāmlietas
45 sociālās tīklošanās pakalpojumi tiešsaistē

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 698 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-300 (220) **Pieteik.dat.** 11.03.2014
 (531) **CFE ind.** 29.1.12



- (591) **Krāsu salikums** gaiši zils, balts
 (732) **Īpašn.** Sergejs PASTERNAKS; Meldru iela 2, Langstiņi, Garkalnes nov. LV-2137, LV
 (511) **41** apmācība; izpriece; sporta un kultūras pasākumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 699 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-322 (220) **Pieteik.dat.** 17.03.2014

LR Capital

- (732) **Īpašn.** LR CAPITAL, SIA; Republikas laukums 2A, Rīga LV-1010, LV
 (511) **36** finanšu lietas; finanšu investīciju pakalpojumi; finanšu investīciju pakalpojumi rūpniecības un nekustamā īpašuma jomā; finanšu investīciju pakalpojumi vērtspapīru tirgū; finanšu investīciju pakalpojumi ar elektronisko sakaru līdzekļu starpniecību; finanšu investīciju pakalpojumi investīciju ar fiksētu ienesīguma likmi un investīciju ar mainīgu ikgadējo ienesīguma likmi jomā; investīcijas privātajos kapitāla fondos; finansēšana, pamatojoties uz aktīviem; investīciju pārvaldīšanas pakalpojumi; uzņēmumu konsultēšana par kapitāla struktūru un finanšu stratēģiju, kā arī par banku un finanšu darījumiem uzņēmumu apvienošanas un iegādes lietās; kapitāla pārvedumu pakalpojumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 700 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-324 (220) **Pieteik.dat.** 18.03.2014
 (531) **CFE ind.** 2.9.15; 19.7.12; 19.7.16; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** zils, zaļš, balts
 (732) **Īpašn.** CIDO GRUPA, SIA; Ostas iela 4, Rīga LV-1005, LV
 (740) **Pārstāvis** Santa KLEINŠMITE; Ostas iela 4, Rīga LV-1005
 (511) **21** pudeles, ūdens pudeles (tukšas), plastmasas pudeles, plastmasas ūdens pudeles (tukšas)
32 alus; minerālūdeņi, gāzēti ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 701 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-328 (220) **Pieteik.dat.** 18.03.2014
 (531) **CFE ind.** 2.1.11; 5.7.2; 25.1.6; 25.1.19; 29.1.15



- (591) **Krāsu salikums** zaļš, sarkans, brūns, melns, balts
 (732) **Īpašn.** DOBELES DZIRNAVNIĒKS, A/S; Spodriņas iela 4, Dobeles, Dobeles novads LV-3701, LV
 (511) **30** milti un labības produkti

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 702 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-331 (220) **Pieteik.dat.** 20.03.2014
 (531) **CFE ind.** 27.5.24



- (732) **Īpašn.** RAGOSA, SIA; Zirņu iela 3-6, Rīga LV-1013, LV
 (740) **Pārstāvis** Genadijs MEŠKAUSKAS; Strautu iela 23-27, Rīga LV-1073
 (511) **25** apģērbi, apavi, galvassegas

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 703 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-343 (220) **Pieteik.dat.** 24.03.2014
 (531) **CFE ind.** 27.5.1

Futura

- (732) **Īpašn.** NESTE OIL OYJ; Keilaranta 21, 02150 Espoo, FI
 (740) **Pārstāvis** Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA; p/k 98, Rīga LV-1050
 (511) **4** tehniskās eļļas un ziedes; smērvielas; kurināmie (arī motoru degvielas) un vielas apgaismošanas nolūkiem; motoreļļas, dīzeļmotoru eļļas, biodīzeļdegviela, benzīns, biodegviela, šķidrā gāze; transportlīdzekļu degvielas; akmeņogles kurināšanai; smēreļļas; biezas smērvielas; nafta, jēlnafta vai rafinēta nafta; smērvielas zobratu eļļošanai; smēreļļas, kas paredzētas transportlīdzekļu dzinējiem; automobiļu smērvielas
35 kurināmo, tehnisko eļļu, benzīna un dīzeļdegvielas mazumtirdzniecības un vairumtirdzniecības pakalpojumi
39 kurināmo piegāde un nosūtīšana

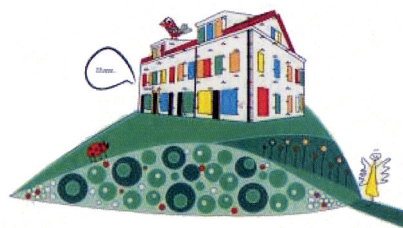
- (111) **Reģ. Nr.** M 67 704 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-346 (220) **Pieteik.dat.** 25.03.2014
 (531) **CFE ind.** 7.1.12; 7.1.24; 29.1.15



- (591) **Krāsu salikums** melns, sarkans, oranžs, dzeltens, zils, balts
 (732) **Īpašn.** RIGA HOSTEL, SIA; Institūta iela 5-4, Peltas, Siguldas pag., Siguldas nov. LV-2150, LV
 (740) **Pārstāvis** Egita ZALCMANE; Merķeļa iela 1, Rīga LV-1050
 (511) **43** viesu izmitināšanas pakalpojumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 705 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-347 (220) **Pieteik.dat.** 25.03.2014
 (531) **CFE ind.** 7.1.24; 29.1.15

CENTRAL HOSTEL



- (591) **Krāsu salikums** tumši zaļš, zaļš, gaiši zaļš, zils, sarkans, oranžs, dzeltens, melns, balts
 (732) **Īpašn.** CENTRAL HOSTEL, SIA; Priēžu iela 3, Baldone, Baldones nov. LV-2125, LV
 (740) **Pārstāvis** Egita ZALCMANE; Ernesta Birznieka-Upīša iela 20, Rīga LV-1050
 (511) **43** viesu izmitināšanas pakalpojumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 706 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-348 (220) **Pieteik.dat.** 25.03.2014
 (531) **CFE ind.** 27.5.4; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** zils, gaiši zils, balts
 (732) **Īpašn.** SALNA BALTIC, SIA; Lāčplēša iela 92-4, Rīga LV-1003, LV
 (740) **Pārstāvis** Ruslans BOGDANOVŠ; Tērbatas iela 6/8-54, Rīga LV-1051
 (511) **35** saldēšanas un gaisa kondicionēšanas iekārtu tirdzniecība

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 707 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-351 (220) **Pieteik.dat.** 26.03.2014
 (531) **CFE ind.** 27.5.6; 29.1.14



- (591) **Krāsu salikums** tumši pelēks, pelēks, gaiši pelēks, sarkans
 (732) **Īpašn.** STREAM NETWORKS, SIA; Cēsu iela 31 k-1, Rīga LV-1012, LV
 (511) **35** datu bāzu pārvaldība; uzņēmumu apgāde (preču un pakalpojumu sagāde trešo personu labā)
37 datortehnikas tehniskā apkope
38 elektronisko sakaru pakalpojumi; telekomunikāciju pakalpojumi; datu pārraides pakalpojumi ar interneta starpniecību
42 konsultācijas informācijas tehnoloģiju jomā; datortehnikas tehniskā apkope; tīmekļa vietņu izstrāde, tīmekļa mitināšanas pakalpojumi; zinātniskie un tehnoloģiskie pakalpojumi, izpēte un projektēšana šajās jomās; rūpnieciskā izpēte un izstrādes; datoru aparātūras un programmatūras projektēšana, izstrāde un pilnveidošana

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 708 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-381 (220) **Pieteik.dat.** 04.04.2014

PRIZMA

- (732) **Īpašn.** AUTOFAVORĪTS, SIA; Valgales iela 2a, Rīga LV-1029, LV
 (740) **Pārstāvis** Natālija ANOHINA, Aģentūra 'TRIA ROBIT'; Vīlandes iela 5, LV-1010 Rīga
 (511) **1** antifrīzi, kriogēnie preparāti; dzesēšanas sastāvi, arī sauszemes transporta līdzekļiem paredzētie
3 mazgāšanas, tīrīšanas, pulēšanas, attaukošanas un abrazīvie līdzekļi
4 tehniskās eļļas un ziedes; smērvielas; eļļošanas-dzesēšanas šķidrums
9 transportlīdzekļu akumulatori

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 709 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-382 (220) **Pieteik.dat.** 04.04.2014

Autoskola Auto Prieks

- (732) **Īpašn.** AUTO PRIEKS, SIA; Vaidavas iela 6 k-3-22, Rīga LV-1084, LV
 (511) **41** autoapmācība; autovadītāju kursu organizēšana; sporta un kultūras pasākumi; apmācības pakalpojumi; mācību programmu sastādīšanas pakalpojumi; teksta materiālu

publicēšana (izņemot reklāmas tekstus); praktisko iemaņu apgūšanas nodarbību organizēšana; zināšanu novērtēšanas pasākumu organizēšana un vadīšana; informācijas sniegšanas pakalpojumi un konsultācijas minētajās jomās

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 710 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-385 (220) **Pieteik.dat.** 07.04.2014

AUTOREPUBLIKA

- (732) **Īpašn.** AUTOPARKU VADĪBAS SISTĒMAS, SIA; Sporta iela 15, Rīga LV-1013, LV
 (740) **Pārstāvis** Ģirts KEHRIS; Tulpju iela 7-15, Carnikava, Carnikavas nov. LV-2163
 (511) **35** vieglo automašīnu, kravas automašīnu un motociklu tirdzniecība

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 711 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-386 (220) **Pieteik.dat.** 07.04.2014

Moments by Laima

- (732) **Īpašn.** LAIMA, AS; Miera iela 22, Rīga LV-1001, LV
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010
 (511) **30** šokolādes izstrādājumi, tai skaitā šokolādes tāfelītes, šokolādes batoniņi, šokolādes konfektes, zefīrs šokolādē; trifeles; zefīrs; pastilas; marcipāns; riekstu vai rozīņu dražejas, kas pārklātas ar cukura vai šokolādes glazūru; žāvēti augļi šokolādē; saldējums

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 712 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-387 (220) **Pieteik.dat.** 07.04.2014
 (531) **CFE ind.** 27.5.1; 29.1.11



- (591) **Krāsu salikums** zeltains
 (732) **Īpašn.** LAIMA, AS; Miera iela 22, Rīga LV-1001, LV
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010
 (511) **30** šokolāde un šokolādes izstrādājumi, tai skaitā šokolādes tāfelītes, šokolādes batoniņi, šokolādes konfektes, šokolādes konfektes ar alkohola pildījumu; saldumu tāfelītes; graudu pārslu batoniņi; konfektes; konfektes ar krēma, marmelādes, pomādes, pralinē un vafeļu pildījumu; trifeles; karameles; mīkstās karameles; ledenes; zefīrs; pastilas; marmelāde; šerbeti; marcipāns; riekstu vai rozīņu dražejas, kas pārklātas ar cukura vai šokolādes glazūru; žāvēti augļi šokolādē; cepumi; vafeles; vafeļu tortes; saldējums; konditorejas izstrādājumi; saldētas tortes; kakao; apstrādātas kakao pupiņas; kakao masa

- (111) **Reģ. Nr.** M 67 713 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-392 (220) **Pieteik.dat.** 09.04.2014
 (531) **CFE ind.** 26.11.2; 26.11.8; 29.1.11



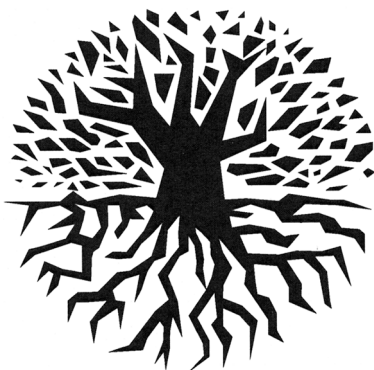
(591) **Krāsu salikums** gaiši brūns
 (732) **Īpašn.** BJB, SIA; Raiņa bulvāris 15, Rīga LV-1050, LV
 (511) **43** restorānu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 714 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-393 (220) **Pieteik.dat.** 09.04.2014

OZOLS IR

(732) **Īpašn.** OZOLS IR, SIA; Brīvības iela 111-5, Rīga LV-1001, LV
 (511) **35** reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 715 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-394 (220) **Pieteik.dat.** 09.04.2014
 (531) **CFE ind.** 5.1.3; 5.1.5; 5.1.11; 5.1.16



(732) **Īpašn.** OZOLS IR, SIA; Brīvības iela 111-5, Rīga LV-1001, LV
 (511) **35** reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 716 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-395 (220) **Pieteik.dat.** 09.04.2014
 (531) **CFE ind.** 27.5.1



(732) **Īpašn.** OZOLS IR, SIA; Brīvības iela 111-5, Rīga LV-1001, LV
 (511) **35** reklāma; darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 717 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-407 (220) **Pieteik.dat.** 11.04.2014
 (531) **CFE ind.** 26.5.1; 26.5.6; 26.5.8; 26.5.16; 26.11.3; 26.11.8; 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** gaiši zils, zils, balts
 (732) **Īpašn.** PENTA MARITIME AGENCIES LTD, SIA; Elizabetes iela 51-5, Rīga LV-1010, LV
 (511) **39** jūras transporta pakalpojumi, kuģu nomas pakalpojumi, kuģu transporta pakalpojumi, kuģu piestātņu pakalpojumi, baržu transporta pakalpojumi, kuģu vilkšanas pakalpojumi, kravu jūras pārvadājumi, transportēšanas pakalpojumi, preču piegādes un iepakojšanas pakalpojumi, starpniecība kravu pārvadājumos, kravu ekspedīcijas pakalpojumi; refrīžeratoru nomas pakalpojumi; kravu iekraušanas un izkraušanas pakalpojumi; pasažieru transporta pakalpojumi; konsultācijas transporta jomā; prāmju transporta pakalpojumi; kruīzu organizēšana; transporta starpniecība; glabāšanas un noliktavu pakalpojumi; ceļojumu biļešu rezervēšanas pakalpojumi; gaisa transporta pakalpojumi; autotransporta pakalpojumi; autotransporta līdzekļu noma; preču piegāde ar pasta starpniecību

(111) **Reģ. Nr.** M 67 718 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-417 (220) **Pieteik.dat.** 14.04.2014
 (531) **CFE ind.** 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** sarkans, dzeltens, melns
 (732) **Īpašn.** FUTURUS FOOD, SIA; Vienības gatve 26a, Rīga LV-1004, LV
 (511) **30** makaroni

(111) **Reģ. Nr.** M 67 719 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-418 (220) **Pieteik.dat.** 14.04.2014
 (531) **CFE ind.** 26.4.2; 26.4.4; 26.4.5; 26.4.22



(732) **Īpašn.** E22, SIA; Elizabetes iela 22-3, Rīga LV-1050, LV
 (740) **Pārstāvis** Jānis ZAĻAIS, Zvērinātu advokātu birojs "BIŠERS & PARTNERI"; Blaumaņa iela 28, Rīga LV-1011
 (511) **43** apgāde ar uzturu

(111) **Reģ. Nr.** M 67 720 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-425 (220) **Pieteik.dat.** 15.04.2014
 (531) **CFE ind.** 26.4.5; 26.4.6; 26.4.22; 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** smilškrāsa, tumši brūns, gaiši brūns
 (732) **Īpašn.** LEVERSA, SIA; Augusta Dombrovska iela 42-51, Rīga LV-1015, LV
 (740) **Pārstāvis** Jevgeņijs FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA; a/k 98, Rīga LV-1050
 (511) **30** milti un labības produkti; maize, maizes un konditorejas izstrādājumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 721 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-426 (220) **Pieteik.dat.** 15.04.2014

TRĪNE

(732) **Īpašn.** LEVERSA, SIA; Augusta Dombrovska iela 42-51, Rīga LV-1015, LV
 (740) **Pārstāvis** Jevgeņijs FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA; a/k 98, Rīga LV-1050
 (511) **30** milti un labības produkti; maize, maizes un konditorejas izstrādājumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 722 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-442 (220) **Pieteik.dat.** 22.04.2014
 (531) **CFE ind.** 19.7.1; 27.3.15



(732) **Īpašn.** DGR MINI, SIA; Ed. Veidenbauma iela 1-26, Tukums, Tukuma nov. LV-3101, LV
 (740) **Pārstāvis** Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra 'INTELS LATVIJA'; Akadēmijas laukums 1, Rīga LV-1050
 (511) **32** alus; minerālūdeņi, gāzēti ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai
33 alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

(111) **Reģ. Nr.** M 67 723 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-473 (220) **Pieteik.dat.** 29.04.2014
 (531) **CFE ind.** 19.8.5; 26.11.22; 29.1.15



(591) **Krāsu salikums** tumši zaļš, balts, zaļš, pelēks, melns
 (732) **Īpašn.** ALDARIS, AS; Tvaika iela 44, Rīga LV-1005, LV
 (740) **Pārstāvis** Natālija ANOHINA, Aģentūra 'TRIA ROBIT'; Vīlandes iela 5, LV-1010 Rīga
 (511) **41** audzināšana; apmācība; izpriecās; sporta un kultūras pasākumi

(111) **Reģ. Nr.** M 67 724 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-129 (220) **Pieteik.dat.** 05.02.2014
 (531) **CFE ind.** 26.11.3; 26.11.10; 29.1.12



(591) **Krāsu salikums** tumši zils, gaiši zils
 (732) **Īpašn.** LATVIJAS ATTĪSTĪBAS FINANŠU INSTITŪCIJA ALTUM, Valsts AS; Doma laukums 4, Rīga LV-1977, LV
 (740) **Pārstāvis** Vladimirs ANOHINS, Aģentūra 'TRIA ROBIT'; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010
 (511) **36** finanšu pakalpojumi, proti, skaidras un bezskaidras naudas maksājumu veikšana, bezskaidras naudas maksāšanas līdzekļu izlaišana un apkalpošana; valūtas tirdzniecība; banku operācijas; finanšu norēķinu pakalpojumi; uzkrāto vērtību glabāšana; darījumi ar vērtspapīriem; nedzēsto parādu iekasēšana; standartizētu nākotnes darījumu pētīšana, izpildīšana un riska ierobežošana; konsultāciju sniegšana par apdrošināšanu; kredītlīdzekļu pārvaldība, proti, finanšu stratēģijas izstrādāšana attiecībā uz līdzekļu izmantošanu nekustamā īpašuma projektos; finanšu projektu vadība; nekustamā īpašuma pārvaldīšana; nekustamā īpašuma īres un nomas pakalpojumi; faktūrkreditēšanas pakalpojumi; finanšu lietas; finanšu analīze; pakalpojumi, kas saistīti ar finansiālu sponsorēšanu; naudas maiņas operācijas; banku pakalpojumi, izmantojot elektroniskos saziņas līdzekļus, arī ar Interneta un telefona sakaru starpniecību; nekustamā īpašuma apsaimniekošana; finanšu pakalpojumi, kas saistīti ar investīcijām; finanšu aktīvu pārvedumi; elektroniskie finanšu aktīvu pārvedumi; starpniecības pakalpojumi aizdevumu jomā; pakalpojumi, kas saistīti ar aizdevumu galvojumiem; trasta operācijas; kredītēšana, arī saskaņā ar finanšu līzinga noteikumiem; aizdevumu izsniegšana; paaugstināta riska kredītu izsniegšana un garantēšana; starpniecības pakalpojumi, kas saistīti ar investīciju fondiem; apdrošināšanas mākeru pakalpojumi; ieguldījumu un ieguldījumu blakuspakalpojumu veikšana; naudas līdzekļu pārvaldīšana ar finanšu aizbildņa starpniecību; apdrošināšana; informācijas sniegšana un konsultācijas klientiem finansiāla rakstura jautājumos; informācijas sniegšana par klienta parādsaistību kārtošānu

(111) **Reģ. Nr.** M 67 725 (151) **Reģ. dat.** 20.08.2014
 (210) **Pieteik.** M-14-130 (220) **Pieteik.dat.** 05.02.2014

ALTUM

(732) **Īpašn.** LATVIJAS ATTĪSTĪBAS FINANŠU INSTITŪCIJA ALTUM, Valsts AS; Doma laukums 4, Rīga LV-1977, LV
 (740) **Pārstāvis** Vladimirs ANOHINS, Aģentūra 'TRIA ROBIT'; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010
 (511) **36** finanšu pakalpojumi, proti, skaidras un bezskaidras naudas maksājumu veikšana, bezskaidras naudas maksāšanas līdzekļu izlaišana un apkalpošana; valūtas tirdzniecība; banku operācijas; finanšu norēķinu pakalpojumi; uzkrāto vērtību glabāšana; darījumi ar vērtspapīriem; nedzēsto parādu iekasēšana; standartizētu nākotnes darījumu pētīšana, izpildīšana un riska ierobežošana; konsultāciju sniegšana par apdrošināšanu; kredītlīdzekļu pārvaldība, proti, finanšu stratēģijas izstrādāšana attiecībā uz līdzekļu izmantošanu nekustamā īpašuma projektos; finanšu

projektu vadība; nekustamā īpašuma pārvaldīšana;
nekustamā īpašuma īres un nomas pakalpojumi;
faktūrkreditēšanas pakalpojumi; finanšu lietas;
finanšu analīze; pakalpojumi, kas saistīti ar finansiālu
sponsorēšanu; naudas maiņas operācijas; banku
pakalpojumi, izmantojot elektroniskos saziņas līdzekļus,
arī ar Interneta un telefona sakaru starpniecību;
nekustamā īpašuma apsaimniekošana; finanšu
pakalpojumi, kas saistīti ar investīcijām; finanšu aktīvu
pārvedumi; elektroniskie finanšu aktīvu pārvedumi;
starpniecības pakalpojumi aizdevumu jomā;
pakalpojumi, kas saistīti ar aizdevumu galvojumiem;
trasta operācijas; kreditēšana, arī saskaņā ar finanšu
līzings noteikumiem; aizdevumu izsniegšana;
paaugstināta riska kredītu izsniegšana un garantēšana;
starpniecības pakalpojumi, kas saistīti ar investīciju
fondiem; apdrošināšanas makleru pakalpojumi;
ieguldījumu un ieguldījumu blakuspakalpojumu
veikšana; naudas līdzekļu pārvaldīšana ar finanšu
aizbildņa starpniecību; apdrošināšana; informācijas
sniegšana un konsultācijas klientiem finansiāla
rakstura jautājumos; informācijas sniegšana par klienta
parādsaistību kārtošanu

Preču zīmju pieteikumu numerācijas rādītājs

(210) Pieteikuma numurs	(111) Reģistrācijas numurs	210) Pieteikuma numurs	(111) Reģistrācijas numurs
M-11-455	M 67 628	M-14-331	M 67 702
M-13-487	M 67 629	M-14-343	M 67 703
M-13-1134	M 67 630	M-14-346	M 67 704
M-13-1211	M 67 631	M-14-347	M 67 705
M-13-1349	M 67 632	M-14-348	M 67 706
M-13-1364	M 67 633	M-14-351	M 67 707
M-13-1367	M 67 634	M-14-381	M 67 708
M-13-1368	M 67 635	M-14-382	M 67 709
M-13-1405	M 67 636	M-14-385	M 67 710
M-13-1414	M 67 637	M-14-386	M 67 711
M-13-1415	M 67 638	M-14-387	M 67 712
M-13-1416	M 67 639	M-14-392	M 67 713
M-13-1421	M 67 640	M-14-393	M 67 714
M-13-1444	M 67 641	M-14-394	M 67 715
M-13-1454	M 67 642	M-14-395	M 67 716
M-14-7	M 67 643	M-14-407	M 67 717
M-14-8	M 67 644	M-14-417	M 67 718
M-14-9	M 67 645	M-14-418	M 67 719
M-14-10	M 67 646	M-14-425	M 67 720
M-14-12	M 67 647	M-14-426	M 67 721
M-14-13	M 67 648	M-14-442	M 67 722
M-14-16	M 67 649	M-14-473	M 67 723
M-14-17	M 67 650		
M-14-18	M 67 651		
M-14-19	M 67 652		
M-14-27	M 67 653		
M-14-29	M 67 654		
M-14-41	M 67 655		
M-14-47	M 67 656		
M-14-59	M 67 657		
M-14-60	M 67 658		
M-14-64	M 67 659		
M-14-67	M 67 660		
M-14-70	M 67 661		
M-14-77	M 67 662		
M-14-78	M 67 663		
M-14-81	M 67 664		
M-14-88	M 67 665		
M-14-108	M 67 666		
M-14-113	M 67 667		
M-14-129	M 67 724		
M-14-130	M 67 725		
M-14-133	M 67 668		
M-14-134	M 67 669		
M-14-142	M 67 670		
M-14-147	M 67 671		
M-14-162	M 67 672		
M-14-163	M 67 673		
M-14-176	M 67 674		
M-14-196	M 67 675		
M-14-223	M 67 676		
M-14-228	M 67 677		
M-14-237	M 67 678		
M-14-241	M 67 679		
M-14-242	M 67 680		
M-14-252	M 67 681		
M-14-253	M 67 682		
M-14-254	M 67 683		
M-14-256	M 67 684		
M-14-257	M 67 685		
M-14-265	M 67 686		
M-14-266	M 67 687		
M-14-268	M 67 688		
M-14-270	M 67 689		
M-14-273	M 67 690		
M-14-278	M 67 691		
M-14-281	M 67 692		
M-14-285	M 67 693		
M-14-290	M 67 694		
M-14-293	M 67 695		
M-14-298	M 67 696		
M-14-299	M 67 697		
M-14-300	M 67 698		
M-14-322	M 67 699		
M-14-324	M 67 700		
M-14-328	M 67 701		

Preču zīmju īpašnieku rādītājs

(732) Īpašnieks	(210) Pieteikuma numurs	(732) Īpašnieks	(210) Pieteikuma numurs
ALDARIS, AS	M-14-473	NATIONAL BISCUITS & CONFECTIONERY CO. LTD.	M-14-273
AM2B, SIA	M-14-67	NESTE OIL OYJ	M-14-343
ARTELS, SIA	M-14-77	NEW YORK FILM ACADEMY, INC.	M-13-1454
AUTO PRIEKŠ, SIA	M-14-382	OZOLS IR, SIA	M-14-393
AUTOFAVORĪTS, SIA	M-14-381		M-14-394
AUTOPARKU VADĪBAS SISTĒMAS, SIA	M-14-385		M-14-395
AVIO SERVICES, SIA	M-14-78	PASTERNAKS, Sergejs	M-14-300
B & Š PARTNERĪBA, Juridiskais birojs, SIA	M-13-1349	PEEK & CLOPPENBURG KG	M-13-1414
BALTIC MEDICAL GROUP, SIA	M-14-252		M-13-1415
	M-14-253		M-13-1416
	M-14-254	PENTA MARITIME AGENCIES LTD, SIA	M-14-407
BALTIC MOBILE, SIA	M-14-265	PERVAK, Natalia	M-14-293
BBH INVESTMENTS, SIA	M-14-241	PIENA PARTNERI KS, Lauksaimniecības pakalpojumu piensaimnieku kooperatīvā sabiedrība	M-14-19
BĒRZIŅA, Laila	M-14-237	PREMIA TALLINNA KÜLMHOONE AS	M-14-196
BJB, SIA	M-14-392	PRIMEA, SIA	M-14-17
CENTRAL HOSTEL, SIA	M-14-347		M-14-18
CĒSU ALUS, AS	M-14-12	RAGOSA, SIA	M-14-331
	M-14-13	RAVDIVE, Viktors	M-14-59
CIDO GRUPA, SIA	M-14-324	RIGA HOSTEL, SIA	M-14-346
DGR MINI, SIA	M-14-442	RIMI LATVIA, SIA	M-14-88
DLV, SIA	M-13-1444	RĪGAS DZIRNAVNIKS, AS	M-13-1367
DOBELES DZIRNAVNIKS, A/S	M-14-328		M-13-1368
DOKTUS, Cēsu pilsētas zemnieku saimniecība	M-14-47	SALNA BALTIC, SIA	M-14-348
E22, SIA	M-14-418	SILV EXPO, SIA	M-14-108
EASTMAN KODAK COMPANY	M-14-256	SISTĒMU INOVĀCIJAS, AS	M-13-487
ECONOM CLASS, SIA	M-14-268	SMILGA, Baiba	M-14-266
ELITERA, SIA	M-14-27	STIBE, Sandis	M-14-60
ELKSNIŅŠ, Jānis	M-14-299	STREAM NETWORKS, SIA	M-14-351
EXPORTSTAR OÜ	M-14-133	TWENTIETH CENTURY FOX FILM CORPORATION	M-14-223
	M-14-134	UAB "ITALIANA LT"	M-13-1134
FURSON ENTERPRISES LP	M-14-81	VALMIERMUIŽAS ALUS, SIA	M-14-41
FUTURUS FOOD, SIA	M-14-417	VLADIMIROVS, Ainars	M-14-228
GEJUŠOVŠ, Eldars	M-13-1405	ZONDAKS, Normunds	M-13-1211
GRIĶE, Sanīta	M-14-299	ŽAKS, Dmitrijs	M-13-1421
HRG-LUX, SIA	M-14-278		
ICA AB	M-14-64		
INTERNATIONAL BUSINESS MACHINES CORPORATION	M-14-70		
IVANČENKO, Sergejs	M-14-299		
JOKER LTD, SIA	M-14-290		
JURIGA, SIA	M-14-176		
KARPOVS, Viktors	M-14-16		
KONKOVS, Georgijs	M-14-242		
LAIMA, AS	M-14-386		
	M-14-387		
LATVIJAS ATTĪSTĪBAS FINANŠU INSTITŪCIJA ALTUM, Valsts AS	M-14-129		
	M-14-130		
LATVIJAS ENERGOCELTNIKS, SIA	M-13-1364		
LATVIJAS ŠĶĪRĒJTIESU ATBALSTA SABIEDRĪBA, SIA	M-14-162		
	M-14-163		
LEVERSA, SIA	M-14-298		
	M-14-425		
	M-14-426		
LIELMUIŽA, SIA	M-14-270		
LIVIKO, SIA	M-14-7		
	M-14-8		
	M-14-9		
	M-14-10		
LR CAPITAL, SIA	M-14-322		
MARINE UNDERWRITING SERVICES, SIA	M-14-281		
MARKS M, SIA	M-14-29		
MEDIA CENTRS "KURZEME", SIA	M-14-257		
MEGO, SIA	M-14-285		
MERRILD KAFFE APS	M-11-455		
MLECZARNIA TUREK SP ZOO	M-14-113		
MOLĀRS M G, SIA	M-14-147		
MONDELEZ EUROPE GMBH	M-14-142		

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 67 632	30	M 67 628	38	M 67 632
	M 67 708		M 67 632		M 67 676
2	M 67 632		M 67 634		M 67 685
3	M 67 632		M 67 635		M 67 707
	M 67 708		M 67 655	39	M 67 632
4	M 67 632		M 67 670		M 67 660
	M 67 703		M 67 675		M 67 703
	M 67 708		M 67 680		M 67 717
5	M 67 629		M 67 690	40	M 67 632
	M 67 632		M 67 701		M 67 680
	M 67 649		M 67 711	41	M 67 632
	M 67 650		M 67 712		M 67 641
	M 67 651		M 67 718		M 67 642
	M 67 656		M 67 720		M 67 676
	M 67 666		M 67 721		M 67 679
6	M 67 632	31	M 67 632		M 67 698
7	M 67 632		M 67 664		M 67 709
8	M 67 632	32	M 67 632		M 67 723
9	M 67 632		M 67 647	42	M 67 632
	M 67 641		M 67 648		M 67 707
	M 67 661		M 67 655	43	M 67 632
	M 67 663		M 67 659		M 67 657
	M 67 676		M 67 665		M 67 662
	M 67 684		M 67 700		M 67 679
	M 67 686		M 67 722		M 67 687
	M 67 708	33	M 67 630		M 67 694
10	M 67 632		M 67 632		M 67 695
11	M 67 632		M 67 643		M 67 704
	M 67 686		M 67 644		M 67 705
12	M 67 632		M 67 645		M 67 713
13	M 67 632		M 67 646		M 67 719
14	M 67 632		M 67 655	44	M 67 632
	M 67 686		M 67 722		M 67 649
15	M 67 632	34	M 67 632		M 67 650
	M 67 686		M 67 674		M 67 651
16	M 67 632	35	M 67 631		M 67 671
	M 67 697		M 67 632		M 67 679
17	M 67 632		M 67 637		M 67 684
18	M 67 632		M 67 638		M 67 689
	M 67 637		M 67 639	45	M 67 632
	M 67 638		M 67 640		M 67 672
	M 67 639		M 67 664		M 67 673
19	M 67 631		M 67 668		M 67 697
	M 67 632		M 67 669		
20	M 67 632		M 67 672		
	M 67 636		M 67 673		
	M 67 653		M 67 677		
	M 67 654		M 67 680		
21	M 67 632		M 67 681		
	M 67 686		M 67 682		
	M 67 700		M 67 683		
22	M 67 632		M 67 688		
23	M 67 632		M 67 689		
24	M 67 632		M 67 691		
	M 67 653		M 67 693		
25	M 67 632		M 67 703		
	M 67 637		M 67 706		
	M 67 638		M 67 707		
	M 67 639		M 67 710		
	M 67 702		M 67 714		
26	M 67 632		M 67 715		
	M 67 653		M 67 716		
27	M 67 632	36	M 67 632		
28	M 67 632		M 67 668		
	M 67 641		M 67 669		
	M 67 678		M 67 692		
	M 67 686		M 67 699		
29	M 67 632		M 67 724		
	M 67 652		M 67 725		
	M 67 658	37	M 67 631		
	M 67 667		M 67 632		
	M 67 680		M 67 633		
	M 67 690		M 67 689		
	M 67 696		M 67 707		

GROZĪJUMI PATENTU REĢISTRĀ**Tiesību atjaunošana**

(Patentu likuma 46. panta trešā daļa)

- (11) **LV 13229**
- Tiesības uz patentu atjaunotas
- Anulēts 2014. gada 19. maija ieraksts Reģistrā
par patenta pirmstermiņa atzīšanu par spēkā
neesošu ar 03.08.2013
Ieraksts valsts reģistrā: 12.08.2014

Patenta īpašnieka maiņa

(Patentu likuma 51. panta otrā daļa)

- (11) **EP 2188544**
(73) SIM Netherlands B.V.; Strawinskylaan 601,
1077 XX Amsterdam, NL
(74) Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA
ROBIT; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
Ieraksts valsts reģistrā: 06.08.2014

- (11) **EP 2038172, EP 2265843**
(73) ACR Aktiengesellschaft (AG); Heiligkreuz 6,
9490 Vaduz, LI
(74) Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA
ROBIT; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
Ieraksts valsts reģistrā: 06.08.2014

- (11) **EP 1706424**
(73) Mentrik Biotech, LLC; Churchill Tower, 12400 Coit
Road, Suite 570, Dallas, TX 75251, US
(74) Vladimirs ANOHINS, Patentu aģentūra TRIA
ROBIT; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
Ieraksts valsts reģistrā: 06.08.2014

- (11) **EP 1660037**
(73) Otsuka Pharmaceutical Co., Ltd;
Shinagawa Grand Central Tower, 2-16-4 Konan,
Minato-Ku, Tokyo 108-8242, JP
(74) Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā
īpašuma aģentūra, SIA; a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
Ieraksts valsts reģistrā: 06.08.2014

- (11) **EP 1491206**
(73) Myelo Therapeutics GmbH;
Robert-Rössle-Str. 10, 13125 Berlin, DE
(74) Svetlana MAKEJEVA, Intelektuālā īpašuma
juridiskā firma LATISS; Stabu iela 44-21, Rīga,
LV-1011, LV
Ieraksts valsts reģistrā: 06.08.2014

- (11) **EP 2044005**
(73) Akebia Therapeutics Inc.; 9987 Carver Road,
Suite 420, Cincinnati, OH 45242, US
(74) Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA
PATENTS; a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
Ieraksts valsts reģistrā: 07.08.2014

Patenta īpašnieka nosaukuma maiņa

(Patentu likuma 47. panta trešā daļa)

- (11) **EP 2536722**
(73) Debiopharm International SA; Forum „après-
demain”, Chemin Messidor 5-7, CP 5911,
1002 Lausanne, CH
Aurigene Discovery Technologies Limited;
Electronic City Phase II, Hosur Road, 39-40 (P)
KIADB Ind Area, Bangalore 560 100, IN
Ieraksts valsts reģistrā: 06.08.2014

- (11) **EP 1912999**
(73) JANSSEN R&D IRELAND; Eastgate Village,
Eastgate, Little Island, Co Cork, IE
MEDIVIR AB; Blasieholmogatan 2,
111 48 Stockholm, SE
Ieraksts valsts reģistrā: 06.08.2014

- (11) **EP 2154966**
(73) The Research Foundation for The State University
of New York; P.O. Box 9, Albany, NY 12201-0009,
US
Ieraksts valsts reģistrā: 07.08.2014

- (11) **EP 2089229**
(73) MEMJET TECHNOLOGY LIMITED;
61/62 Fitzwilliam Lane, Dublin 2, IE
Ieraksts valsts reģistrā: 07.08.2014

Patenta īpašnieka adreses maiņa

(Patentu likuma 47. panta trešā daļa)

- (11) **EP 1912999**
(73) JANSSEN R&D IRELAND; Eastgate Village,
Eastgate, Little Island, Co Cork, IE
MEDIVIR AB; Blasieholmogatan 2,
111 48 Stockholm, SE
Ieraksts valsts reģistrā: 06.08.2014

- (11) **EP 2092044**
(73) Cortus AB; Skalholtsgatan 2, 164 40 Kista, SE
Ieraksts valsts reģistrā: 07.08.2014

- (11) **EP 2044005**
(73) Akebia Therapeutics Inc.; 245 First Street,
Suite 1100, Cambridge, MA 02142, US
Ieraksts valsts reģistrā: 07.08.2014

- (11) **EP 2385081**
(73) Armacell Enterprise GmbH & Co. KG;
Zeppelinstrasse 1, 12529 Schönefeld OT
Waltersdorf, DE
Ieraksts valsts reģistrā: 12.08.2014

Patenta pirmstermiņa atzīšana par spēkā neesošu
(Patentu likuma 55. panta pirmās daļas 2. punkts)

Tiek norādīts patenta numurs un tā darbības termiņa beigu datums

LV 12886	21.12.2013
LV 12908	14.12.2013
LV 13177	04.12.2013
LV 13498	20.12.2013
LV 13570	13.12.2013
LV 13960	13.12.2013
LV 13968	18.12.2013
LV 13969	18.12.2013
LV 13970	04.12.2013
LV 14110	18.12.2013
LV 14301	21.12.2013
LV 14338	29.12.2013
LV 14373	08.12.2013
LV 14395	02.12.2013
LV 14396	02.12.2013
LV 14538	21.12.2013
LV 14543	14.12.2013

Eiropas patenta pirmstermiņa atzīšana par spēkā neesošu
(Patentu likuma 73. panta pirmā daļa un
55. panta pirmās daļas 2. punkts)

Tiek norādīts patenta numurs un tā darbības termiņa beigu datums

EP 0780369	02.12.2013
EP 0784093	20.12.2013
EP 0786450	21.12.2013
EP 0787715	21.12.2013
EP 0800407	22.12.2013
EP 0873319	13.12.2013
EP 0948541	08.12.2013
EP 0954346	23.12.2013
EP 1020185	21.12.2013
EP 1020186	23.12.2013
EP 1041990	21.12.2013
EP 1042305	22.12.2013
EP 1043995	22.12.2013
EP 1047418	22.12.2013
EP 1056725	22.12.2013
EP 1135125	01.12.2013
EP 1140080	13.12.2013
EP 1140158	15.12.2013
EP 1141450	24.12.2013
EP 1419773	22.12.2013
EP 1450799	03.12.2013
EP 1451177	02.12.2013
EP 1453505	02.12.2013
EP 1456182	03.12.2013
EP 1456197	18.12.2013
EP 1492781	09.12.2013
EP 1496890	09.12.2013
EP 1496904	09.12.2013
EP 1507928	13.12.2013
EP 1543826	10.12.2013
EP 1572653	19.12.2013
EP 1572711	08.12.2013
EP 1581532	19.12.2013
EP 1697347	20.12.2013
EP 1708790	02.12.2013
EP 1723136	20.12.2013
EP 1808700	29.12.2013
EP 1828137	15.12.2013
EP 1828297	20.12.2013
EP 1830855	13.12.2013
EP 1830887	21.12.2013
EP 1833791	22.12.2013
EP 1838718	28.12.2013
EP 1843950	28.12.2013
EP 1849357	21.12.2013
EP 1860100	21.12.2013
EP 1971338	19.12.2013
EP 1974124	14.12.2013
EP 1989156	28.12.2013
EP 2094690	28.12.2013
EP 2102071	06.12.2013
EP 2120958	05.12.2013
EP 2125021	21.12.2013
EP 2183599	05.12.2013
EP 2222291	23.12.2013
EP 2222550	09.12.2013
EP 2225149	09.12.2013
EP 2231598	10.12.2013
EP 2234631	18.12.2013
EP 2235160	19.12.2013
EP 2236598	23.12.2013
EP 2332422	11.12.2013
EP 2354124	11.12.2013
EP 2372672	21.12.2013
EP 2380402	23.12.2013

Pārstāvja maiņa

(Patentu likuma 47. panta trešā daļa)

(11)	EP 1912999
(73)	JANSSEN R&D IRELAND; Eastgate Village, Eastgate, Little Island, Co Cork, IE MEDIVIR AB; Blasieholmsgatan 2, 111 48 Stockholm, SE
(74)	Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS; a/k 61, Rīga, LV-1010, LV
	<i>Ieraksts valsts reģistrā:</i> 06.08.2014

GROZĪJUMI VALSTS DIZAINPARAUGU REĢISTRĀ

Dizainparauga īpašnieka maiņa
(Dizainparaugu likuma 42. pants)

(11)	D 10 818
(73)	BROWN-FORMAN FINLANDIA LTD.; Porkkalankatu 24, Helsinki, 00180, FI
(58)	15.07.2014

Dizainparauga īpašnieka adreses maiņa
(Dizainparaugu likuma 42. pants)

(11)	D 15 284
(73)	GEOR, SIA; Langervaldes iela 5, Raubēni, Cenu pagasts, Ozolnieku novads, LV-3002, LV
(58)	14.07.2014

Reģistrācijas atjaunošana

(Dizainparaugu likuma 31. pants, Pārejas noteikumu 7. punkts)

Tiek norādīts dizainparauga reģistrācijas numurs un reģistrācijas atjaunošanas datums

D 15 284	10.06.2014
-----------------	------------

Dizainparauga izslēgšana no reģistra
(Dizainparaugu likuma 40. pants)

Tiek norādīts dizainparauga reģistrācijas numurs un reģistrācijas beigu datums

D 10 834	04.11.2013
D 10 835	12.11.2013
D 15 216	03.11.2013
D 15 217	03.11.2013
D 15 223	04.11.2013
D 15 224	04.11.2013
D 15 225	05.11.2013
D 15 227	06.11.2013
D 15 228	25.11.2013
D 15 231	10.12.2013
D 15 232	22.12.2013
D 15 234	27.11.2013
D 15 235	02.12.2013
D 5065	31.12.2013

GROZĪJUMI VALSTS PREČU ZĪMJU REĢISTRĀ		
Zīmes īpašnieka maiņa (Likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 25. pants)		
(111)	M 15 000	(111) M 55 270
(732)	CLINIGEN GROUP PLC; Pitcairn House, Crown Square, Centrum 100, Burton-upon-Trent, Staffordshire DE14 2WW, GB	(732) ARIBA GROUP, SIA; Tomsona iela 39 k-1-4, Rīga, LV-1013, LV
(740)	Natālija ANOHINA, Aģentūra „TRIA ROBIT”;	(580) 31.07.2014
(580)	Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV 05.08.2014	
(111)	M 15 821, M 64 603	(111) M 58 972, M 58 973
(732)	ASPEN GLOBAL INCORPORATED; GBS Plaza, Cnr. La Salette & Royal Roads, Grand Bay, MU	(732) AMBER PINES, SIA; Bērzaunes iela 11a, Rīga, LV-1039, LV
(740)	Aleksandra FORTŪNA, „FORAL Intelektuālā ģeogrāfiskā zīmola aģentūra”, SIA; a/k 98, Rīga, LV-1050, LV	(580) 18.07.2014
(580)	05.08.2014	
(111)	M 35 406	(111) M 59 370, M 65 343
(732)	METOS OY AB (business ID 0108466-4); Ahjonkaarre, 04220 Kerava, FI	(732) PBI, SIA; Avotu iela 10-7, Rīga, LV-1011, LV
(740)	Baiba KRAVALE, Patentu birojs „ALFA-PATENTS”;	(740) Māra UZULĒNA, Patentu birojs „ALFA-PATENTS”;
(580)	Virānes iela 2, Rīga, LV-1035, LV 18.07.2014	(740) Virānes iela 2, Rīga, LV-1035, LV 05.08.2014
(111)	M 38 199	(111) M 60 142, M 61 135, M 62 344
(732)	B & Š PARTNERĪBA, Juridiskais birojs, SIA;	(732) OTISIFARM, OAO; ul. Testovskaya 10, 123317 Moskva, RU
(740)	Vīlandes iela 6-4, Rīga, LV-1010, LV	(740) Nīna DOLGICERE, Patentu aģentūra „KDK”;
(580)	Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”;	(580) 12.08.2014
	Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV 04.08.2014	
(111)	M 39 454, M 39 455, M 39 456, M 46 791	(111) M 61 139
(732)	THE PROCTER & GAMBLE COMPANY;	(732) OTISIFARM, OAO; ul. Testovskaya 10, 123317 Moskva, RU
(740)	One Procter & Gamble Plaza, Cincinnati, OH 45202, US	(740) Nīna DOLGICERE, Patentu aģentūra „KDK”;
(580)	Natālija ANOHINA, Aģentūra „TRIA ROBIT”;	(580) 12.08.2014
	Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV 31.07.2014	
(111)	M 44 278	(111) M 64 408
(732)	GRIFOLS WORLDWIDE OPERATIONS LIMITED;	(732) KOPUMS, SIA; Valkas iela 5-13, Daugavpils, LV-5417, LV
(740)	Embassy House, Ballsbridge, Dublin 4, IE	(580) 13.08.2014
(580)	Natālija ANOHINA, Aģentūra „TRIA ROBIT”;	
	Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV 05.08.2014	
(111)	M 49 525	(111) M 65 484
(732)	R.A., SIA; Kalkūnes iela 20-3, Kalkūni, Kalkūnes pag., Daugavpils nov., LV-5449, LV	(732) AMBER PINES, SIA; Bērzaunes iela 11a, Rīga, LV-1039, LV
(580)	11.08.2014	(580) 18.07.2014
(111)	M 53 286	(111) M 65 485, M 65 486
(732)	OSMOSE HOLDINGS, INC.; 980 Ellicott Street, Buffalo, NY 14209, US	(732) AMBER PINES, SIA; Bērzaunes iela 11a, Rīga, LV-1039, LV
(740)	Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra „INTELS LATVIJA”;	(580) 18.07.2014
(580)	Akadēmijas laukums 1, Rīga, LV-1050, LV 08.08.2014	
(111)	M 54 998, M 59 243	(111) M 66 084
(732)	VENDEN, SIA; Ganību dambis 33, Rīga, LV-1005, LV	(732) ARKTIKA NORD, SIA; Republikas laukums 3-522, Rīga, LV-1010, LV
(580)	23.07.2014	(740) Rūta OLMANE; a/k 49, Rīga, LV-1006, LV
(111)	M 55 031	(580) 31.07.2014
(732)	Aleksandrs ŠUKLIŅS; Ruses iela 12-17, Rīga, LV-1029, LV	(111) M 66 950, M 66 951
(740)	Vladimirs ANOHINS, Aģentūra „TRIA ROBIT”;	(732) SKYSTAIRS, SIA; Tērbatas iela 74A, Rīga, LV-1001, LV
(580)	Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV 13.08.2014	(580) 01.08.2014
		(111) M 67 450
		(732) LATVIJAS ŠĶĪRĒJTIESU ATBALSTA SABIEDRĪBA, SIA; E. Birznieka-Upīša iela 18-7, Rīga, LV-1050, LV
		(740) Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”;
		(580) Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV 17.07.2014
		(111) M 67 450
		(732) EURO AUTO TRUCK BALTIA, SIA; Tērbatas iela 74A, Rīga, LV-1001, LV
		(740) Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra „PĒTERSONA PATENTS”;
		(580) Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV 07.08.2014

Licences			
(Likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 26. pants)		(111)	M 17 606, M 55 018, M 55 148
(111)	M 67 450	(732)	ATLANTIC INDUSTRIES; P.O. Box 309, Ugland House, South Church Street, George Town, Grand Cayman, KY1-1104, KY
(732)	EURO AUTO TRUCK BALTIA, SIA;	(580)	23.07.2014
(791)	Tērbatas iela 74A, Rīga, LV-1001, LV	(111)	M 35 554, M 35 555, M 35 556
(793)	EUROCARGO TRANSPORT, SIA;	(732)	OPTIMERA LATVIA, SIA; Pērnavas iela 27/29, Rīga, LV-1009, LV
	Stirnu iela 1-64, Rīga, LV-1035, LV	(580)	06.08.2014
	autokravu pārvadājumi; loģistikas pakalpojumi	(111)	M 42 162, M 43 624, M 43 625, M 43 626
	Licences veids: vienkārša licence	(732)	LINPAC PACKAGING LIMITED;
	Licences darbības laiks: beztermiņa licence no 29.07.2014	(580)	LINPAC Wakefield Road, Featherstone, Pontefract, West Yorkshire WF7 5DE, GB
(580)	07.08.2014	(580)	01.08.2014
(111)	M 67 450	(111)	M 42 440
(732)	EURO AUTO TRUCK BALTIA, SIA;	(732)	MERCANTILE OY AB; Lāntinen teollisuuskatu 2, P.O. Box 14, Espoo, FIN-02920, FI
(791)	Tērbatas iela 74A, Rīga, LV-1001, LV	(580)	18.07.2014
(793)	EUROCARGO TRUCK CENTER, SIA;	(111)	M 43 249
	Stirnu iela 1-64, Rīga, LV-1035, LV	(732)	NOKIA SOLUTIONS AND NETWORKS OY;
	auto rezerves daļu tirdzniecība; auto remonta un apkopes pakalpojumi	(580)	Karaportti 3, 02610 Espoo, FI
	Licences veids: vienkārša licence	(580)	31.07.2014
	Licences darbības laiks: beztermiņa licence no 29.07.2014	(111)	M 55 087
(580)	08.08.2014	(732)	ECO ASSETS MANAGEMENT, AS; Šķūņu iela 19, Rīga, LV-1050, LV
		(580)	30.07.2014
		(111)	M 55 208
		(732)	PIENO ŽVAIGŽDĒS, akcinē bendrovē;
		(580)	Perkūnkiemio g. 3, Vilnius, LT-12127, LT
		(580)	29.07.2014
		(111)	M 67 365
		(732)	CELLARTE, SIA; Mazcenu aleja 6a, Jaunmārupe, Mārupes nov., LV-2166, LV
		(580)	11.08.2014
Ķīlas tiesība		Zīmes īpašnieka adreses maiņa	
(Likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 25. ¹ pants)		(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 17. panta otrā daļa)	
(111)	M 49 745, M 52 260, M 52 262, M 53 452, M 55 947	(111)	M 15 524
(732)	BAUSKAS ALUS, SIA; „Imantas”, Īslīces pagasts, Bauskas novads, LV-3901, LV	(732)	BRITVIC SOFT DRINKS LIMITED;
	Komerķīlas ņēmējs: SEB BANKA, AS; Meistaru iela 1, Valdlauči, Ķekavas pag., Ķekavas nov., LV-1076, LV	(580)	Breakspear Park, Breakspear Way, Hemel Hempstead, HP2 4TZ, GB
	Komerķīlas termiņš: no 03.07.2014 līdz pilnīgai saistību izpildei	(580)	31.07.2014
(580)	16.07.2014	(111)	M 35 410
(111)	M 51 051, M 54 321, M 57 628, M 57 629	(732)	BRITVIC SOFT DRINKS LIMITED;
(732)	FF FOODS, SIA; Stūraiņu iela 6, Rumbula, Stopiņu novads, LV-2119, LV	(580)	Breakspear Park, Breakspear Way, Hemel Hempstead, HP2 4TZ, GB
	Komerķīlas ņēmējs: CITADELE LĪZINGS UN FAKTORINGS, SIA; Republikas laukums 2A, Rīga, LV-1010, LV	(580)	17.07.2014
	Komerķīlas termiņš: no 09.12.2013 līdz pilnīgai saistību izpildei	(111)	M 35 608, M 35 609
(580)	16.07.2014	(732)	RĪGAS ŠPROTES, biedrība; Brīvības iela 90-28, Rīga, LV-1001, LV
		(580)	31.07.2014
		(111)	M 35 755
		(732)	SPIRO INTERNATIONAL SA;
		(580)	Industriestrasse 173, 3178 Boesingen, CH
		(580)	31.07.2014
Zīmes īpašnieka nosaukuma maiņa			
(Likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 17. panta otrā daļa)			
(111)	M 11 744		
(732)	OAT AGURIO KABUSHIKI KAISHA d/b/a OAT AGRIO CO., LTD.; 1-3-1, Kanda Ogawa-machi, Chiyoda-ku, Tokyo, JP		
(580)	31.07.2014		
(111)	M 12 739, M 40 432, M 40 996, M 41 003, M 52 782		
(732)	BIG HEART PET BRANDS; One Maritime Plaza, San Francisco, CA 94111, US		
(580)	01.08.2014		
(111)	M 16 081		
(732)	KATE SPADE & COMPANY; 1441 Broadway, New York, NY 10018, US		
(580)	12.08.2014		

(111)	M 37 924	M 35 555	09.08.2014
(732)	INVISTA TECHNOLOGIES S.a.r.l.;	M 35 556	09.08.2014
(580)	Kreuzackerstrasse 9, CH-9000 St. Gallen, CH 05.08.2014	M 35 558	09.08.2014
		M 35 562	30.08.2014
		M 35 672	01.07.2014
(111)	M 38 710	M 35 683	08.08.2014
(732)	KALNOZOLS UN PARTNERI, SIA;	M 35 684	25.08.2014
(580)	Lībikas iela 14-4, Rīga, LV-1014, LV 22.07.2014	M 35 686	30.08.2014
		M 35 687	30.08.2014
		M 35 711	17.08.2014
(111)	M 49 680, M 55 080	M 35 712	17.08.2014
(732)	OSI PHARMACEUTICALS, LLC; 1 Astellas Way,	M 35 788	03.08.2014
(580)	Northbrook, IL 60062, US 04.08.2014	M 35 790	03.08.2014
		M 35 791	05.08.2014
		M 35 793	30.08.2014
		M 35 887	15.07.2014
(111)	M 52 612, M 52 613	M 35 894	11.08.2014
(732)	LIEPĀJAS KAFIJAS FABRIKA, SIA;	M 35 896	30.08.2014
(580)	Grīzupes iela 2, Liepāja, LV-3414, LV 31.07.2014	M 36 055	12.07.2014
		M 36 092	01.08.2014
		M 36 093	01.08.2014
(111)	M 54 567	M 36 098	02.08.2014
(732)	INOS, SIA; Rīgas iela 115A, Salaspils,	M 36 102	03.08.2014
(580)	Salaspils nov., LV-2169, LV 04.08.2014	M 36 103	03.08.2014
		M 36 108	04.08.2014
		M 36 114	05.08.2014
(111)	M 55 407	M 36 117	08.08.2014
(732)	RUBATE, SIA; Hipokrāta iela 2D, Rīga, LV-1079,	M 36 120	09.08.2014
(580)	LV 28.07.2014	M 36 124	10.08.2014
		M 36 127	10.08.2014
		M 36 140	15.08.2014
		M 36 144	16.08.2014
(111)	M 55 421, M 55 440, M 56 114	M 36 148	22.08.2014
(732)	SPIRITS PRODUCT INTERNATIONAL	M 36 149	22.08.2014
(580)	INTELLECTUAL PROPERTY B.V.; 3, rue du Fort Rheinsheim, L-2419 Luxembourg, LU 17.07.2014	M 36 154	23.08.2014
		M 36 158	23.08.2014
		M 36 160	25.08.2014
		M 36 161	26.08.2014
(111)	M 55 647	M 36 359	29.08.2014
(732)	VALTA LIMITED; Landstrasse 11, LI-9495 Triesen,	M 36 362	30.08.2014
(580)	LI 31.07.2014	M 36 509	08.08.2014
		M 36 643	09.08.2014
		M 36 650	24.08.2014
(111)	M 57 227	M 36 840	26.07.2014
(732)	REKOBALT, SIA; Braslas iela 22, Rīga, LV-1035,	M 37 419	10.08.2014
(580)	LV 18.07.2014	M 37 753	31.08.2014
		M 37 924	30.08.2014
		M 38 392	23.08.2014
(111)	M 57 337	M 38 393	29.08.2014
(732)	NOVATOURS, SIA; Krišjāņa Valdemāra iela 100,	M 38 394	30.08.2014
(580)	Rīga, LV-1013, LV 31.07.2014	M 38 710	20.07.2014
		M 38 763	02.08.2014
		M 54 134	06.08.2014
		M 54 173	05.08.2014
		M 54 324	18.08.2014
		M 54 325	18.08.2014
		M 54 328	18.08.2014
		M 54 329	18.08.2014
		M 54 524	31.08.2014
		M 54 567	05.03.2014
		M 54 902	11.08.2014
		M 54 998	27.07.2014
M 35 406	18.07.2014	M 55 087	29.04.2014
M 35 410	25.07.2014	M 55 090	06.08.2014
M 35 415	27.07.2014	M 55 091	06.08.2014
M 35 417	01.08.2014	M 55 092	06.08.2014
M 35 422	03.08.2014	M 55 093	06.08.2014
M 35 424	05.08.2014	M 55 094	06.08.2014
M 35 426	02.08.2014	M 55 095	06.08.2014
M 35 427	03.08.2014	M 55 097	09.08.2014
M 35 434	12.08.2014	M 55 169	10.08.2014
M 35 439	16.08.2014	M 55 172	11.08.2014
M 35 544	05.07.2014	M 55 173	11.08.2014
M 35 552	08.08.2014	M 55 208	04.08.2014
M 35 554	09.08.2014		

Reģistrāciju atjaunošana

(Likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 21. panta otrā daļa)

Tiek norādīts zīmes reģistrācijas numurs un reģistrācijas atjaunošanas datums

M 55 209	23.08.2014
M 55 262	02.08.2014
M 55 270	13.08.2014
M 55 287	27.08.2014
M 55 317	25.08.2014
M 55 387	17.08.2014
M 55 440	06.08.2014
M 55 513	20.08.2014
M 55 590	05.08.2014
M 55 631	12.08.2014
M 55 646	19.08.2014
M 56 114	29.07.2014
M 56 960	26.07.2014
M 57 121	04.08.2014
M 57 138	02.08.2014
M 57 227	22.07.2014
M 58 403	10.08.2014
M 59 243	27.07.2014

Zīmes reģistrācijas dzēšana

(Likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 19. panta sestā daļa)

(111)	M 63 528
(141)	20.07.2011
(580)	11.08.2014

Zīmes reģistrācijas izslēgšana no Reģistra

(Likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 33. panta pirmā daļa)

Tiek norādīts zīmes reģistrācijas numurs un reģistrācijas darbības pārtraukšanas datums

M 34 361	04.01.2014
M 34 363	04.01.2014
M 34 364	04.01.2014
M 34 365	04.01.2014
M 34 366	04.01.2014
M 34 370	05.01.2014
M 34 376	07.01.2014
M 34 379	07.01.2014
M 34 380	07.01.2014
M 34 381	07.01.2014
M 34 382	07.01.2014
M 34 391	11.01.2014
M 34 393	11.01.2014
M 34 394	11.01.2014
M 34 395	11.01.2014
M 34 397	11.01.2014
M 34 412	14.01.2014
M 34 413	14.01.2014
M 34 414	14.01.2014
M 34 416	14.01.2014
M 34 418	19.01.2014
M 34 426	25.01.2014
M 34 430	25.01.2014
M 34 431	25.01.2014
M 34 437	25.01.2014
M 34 441	25.01.2014
M 34 442	25.01.2014
M 34 454	27.01.2014
M 34 455	28.01.2014
M 34 819	05.01.2014
M 34 820	05.01.2014
M 34 828	12.01.2014
M 35 028	25.01.2014
M 35 122	11.01.2014
M 35 253	12.01.2014
M 35 743	18.01.2014
M 35 841	18.01.2014

M 35 842	18.01.2014
M 35 843	18.01.2014
M 35 845	18.01.2014
M 35 846	18.01.2014
M 35 847	18.01.2014
M 35 848	18.01.2014
M 35 849	18.01.2014
M 35 850	18.01.2014
M 35 851	18.01.2014
M 35 966	11.01.2014
M 35 967	11.01.2014
M 35 971	19.01.2014
M 35 973	19.01.2014
M 38 140	25.01.2014
M 38 245	18.01.2014
M 42 422	14.01.2014
M 53 356	30.01.2014
M 53 417	05.01.2014
M 53 418	28.01.2014
M 53 944	30.01.2014
M 54 128	05.01.2014
M 54 159	29.01.2014
M 54 160	27.01.2014
M 54 161	27.01.2014
M 54 162	27.01.2014
M 54 163	27.01.2014
M 54 238	09.01.2014
M 54 239	09.01.2014
M 54 241	13.01.2014
M 54 242	13.01.2014
M 54 244	15.01.2014
M 54 245	21.01.2014
M 54 247	21.01.2014
M 54 249	27.01.2014
M 54 250	28.01.2014
M 54 279	26.01.2014
M 54 286	27.01.2014
M 54 294	23.01.2014
M 54 301	09.01.2014
M 54 302	16.01.2014
M 54 303	26.01.2014
M 54 305	27.01.2014
M 54 306	27.01.2014
M 54 336	29.01.2014
M 54 364	06.01.2014
M 54 380	06.01.2014
M 54 381	06.01.2014
M 54 382	06.01.2014
M 54 383	06.01.2014
M 54 384	09.01.2014
M 54 385	26.01.2014
M 54 552	06.01.2014
M 54 553	07.01.2014
M 54 609	19.01.2014
M 54 614	07.01.2014
M 54 615	23.01.2014
M 54 635	19.01.2014
M 54 675	07.01.2014
M 54 677	07.01.2014
M 54 678	07.01.2014
M 54 681	15.01.2014
M 54 685	20.01.2014
M 54 686	21.01.2014
M 54 687	21.01.2014
M 54 799	19.01.2014
M 55 459	04.01.2014
M 55 533	09.01.2014
M 55 534	10.01.2014
M 55 535	20.01.2014
M 56 567	09.01.2014
M 58 450	29.01.2014
M 58 451	29.01.2014

Grozījumi preču sarakstā

(Likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 17. panta otrā daļa)

(111) **M 35 424**
(511) 19, 36
visas preces un pakalpojumi svītroti 05.08.2014
37
līdzšinējā redakcija
(580) 05.08.2014

(111) **M 67 300, M 67 301**
(511) 9
visas preces svītrotas 12.08.2014
35, 36
līdzšinējā redakcija
(580) 12.08.2014

Pārstāvja maiņa

(Likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 17. panta otrā daļa)

(111) **M 60 689, M 61 280, M 65 914**
(740) Edvīns DRABA, Zvērinātu advokātu birojs
SORAINEN; Krišjāņa Valdemāra iela 21, Rīga,
LV-1010, LV
(580) 08.08.2014

Pamanīto kļūdu labojums oficiālajā izdevumā 10/2013

1408. lappuse, Latvijā apstiprinātie Eiropas patenti, EP 2004892 publikācija

jābūt:

- (51) **B32B 33/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2004892**
D02G 3/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
D03D 15/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
D02G 3/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
D03D 27/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
D02G 3/22⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
D03D 27/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
D02G 3/38⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
D03D 27/08⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 06827946.2 (22) 16.10.2006
(43) 24.12.2008
(45) 13.03.2013
(45) 18.06.2014 (labotā versija)
(31) 727424 P (32) 17.10.2005 (33) US
(86) PCT/IB2006/003887 16.10.2006
(87) WO2007/054827 18.05.2007
(73) Welspun UK Limited, First Floor, Park Square, Bird Hall Lane, Cheadle, Cheshire SK3 OXF, GB
(72) MAMDAWEWALA, Rajesh R, IN
(74) Roberts, Scott Anthony, et al, Avidity IP, Merlin House, Falconry Court, Baker's Lane, Epping, Essex CM16 5DQ, GB
Baiba KRAVALE, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga, LV-1082, LV
- (54) **HIGROMATERIĀLI IZMANTOŠANAI PAVEDIENU UN AUDUMU IZGATAVOŠANĀ**
HYGRO MATERIALS FOR USE IN MAKING YARNS AND FABRICS

(57) 1. Frotē audums, kas ietver: kokvilnas metus un audu pavedienus, un uzkārsma pavedienu, kurš satur siltā ūdenī šķīstošas šķiedras tā serdē un vienu vai vairākas citas šķiedras, kas aptver siltā ūdenī šķīstošās šķiedras.

2. Audums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā ūdenī šķīstošās šķiedras ir polivinilspirts.

3. Audums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā viena vai vairākas citas uzkārsma pavediena šķiedras ir veidotas no šķiedrām, kas izvēlētas no grupas, kas sastāv no kokvilnas, kokvilnas maisījumiem, zīda šķiedrām, modāla šķiedrām, akrilšķiedrām, kokvilnas un bambusa šķiedru maisījumiem, kokvilnas un jūras zāļu šķiedru maisījumiem, kokvilnas un sudraba šķiedru maisījumiem un kokvilnas un kokogļu šķiedru maisījumiem.

4. Paņēmiens absorbējoša frotē auduma izgatavošanai, kas ietver:

(a) siltā ūdenī šķīstošu šķiedru atlasīšanai uzkārsma pavediena serdē un vienas vai vairāku citu šķiedru atlasīšanai siltā ūdenī šķīstošo šķiedru aptveršanai;

(b) ūdenī šķīstošo šķiedru iekļaušanu uzkārsma pavediena serdē un vienas vai vairāku citu šķiedru iekļaušanu uzkārsma pavediena apvalkā;

(c) uzkārsma pavediena aušanu ar kokvilnas metiem un audu pavedieniem, lai veidotu frotē audumu;

(d) auduma mazgāšanu, lai izšķīdinātu ūdenī šķīstošās šķiedras.

5. Paņēmiens saskaņā ar 4. pretenziju, kurā viena vai vairākas citas uzkārsma pavediena šķiedras ir izvēlētas no grupas, kas sastāv no kokvilnas, kokvilnas maisījumiem, zīda šķiedrām, modāla šķiedrām, akrilšķiedrām, kokvilnas un bambusa šķiedru maisījumiem, kokvilnas un jūras zāļu šķiedru maisījumiem, kokvilnas un sudraba šķiedru maisījumiem un kokvilnas un kokogļu šķiedru maisījumiem.

6. Paņēmiens saskaņā ar 5. pretenziju, kurā viena vai vairākas citas uzkārsma pavedienu šķiedras ir kokvilna.

7. Paņēmiens saskaņā ar 4. pretenziju, kurā stadija (d) ietver tekstilizstrādājuma mazgāšanu ūdenī aptuveni no 50 °C līdz aptuveni 120 °C temperatūrā.

8. Paņēmiens saskaņā ar 4. pretenziju, kurā ūdenī šķīstošās šķiedras iestrādāšanai uzkārsma pavedienu serdē ir polivinilspirta šķiedras.

9. Paņēmiens saskaņā ar 8. pretenziju, kurā polivinilspirta šķiedras tiek iestrādātas uzkārsma pavedienu serdē uz serdes vērpšanas mašīnas.

10. Paņēmiens saskaņā ar 8. pretenziju, kurā polivinilspirta šķiedras tiek iestrādātas uzkārsma pavedienu serdē uz priekšpavediena izlīdzināšanas mašīnas, pie kam polivinilspirta šķiedras tiek iestrādātas pavediena serdē, izmantojot pavediena virzītājgrieztuves šķēru pavedienu padeves procesā no pārnēsma rāmja izvilšanas zonas.

Pamanīto kļūdu labojums oficiālajā izdevumā 7/2014

1006. lappuse, Latvijā apstiprinātie Eiropas patenti, EP 2287164 publikācija

jābūt:

- (51) ... (45) ... – *kā publicēts*
(48) 11.06.2014 (labojumi vācu valodas tekstā)
(31) *un tālāk – kā publicēts*

Atbildīgā par izdevumu K. Libarte
Izdevuma reģistrācijas Nr. 000701174