ISSN 2029-2309
(online)

LIETUVOS RESPUBLIKOS VALSTYBINIO PATENTŲ BIURO OFICIALUS BIULETENIS

2016/09, 2016-05-10

OFFICIAL BULLETIN OF THE STATE PATENT BUREAU OF THE REPUBLIC OF LITHUANIA

IŠRADIMAI / INVENTIONS

Paraiškos / Applications - 2014 117 - 2015 058
Patentai / Patents - 6266 - 6271

9 2016 VILNIUS

dalis
part

TURINYS

OFICIALŪS PRANEŠIMAI 2

Valstybinio patentų biuro pranešimas 3

Patentinių patikėtinių sąrašas 4

Valstybių kodai 7

IŠRADIMAI 9

BB1A* Paskelbtos paraiškos (A)** 10

FG9A Išduoti patentai 16

MM9A Panaikinti patentai 22

MK9A Patentai, kurių galiojimas pasibaigęs 23

TK9A Atitaisymai 24

Vardinė rodyklė 25

Sisteminė rodyklė 27

Numerinė išradimų rodyklė 28

Numerinė paraiškų rodyklė 29

EUROPOS PATENTAI 30

FG9D Paskelbti patentai 30

FG4D Paskelbti patentai 35

PC9D Patento perleidimas 266

PD9D, DC9D, TH9A Patento pakeitimai 267

MM9D Išplėtimo panaikinimas 268

MG9D Išplėtimo pripažinimas negaliojančiu 269

MK9D Baigę galioti patentai 270

MM4D Panaikinti patentai 271

MG4D Patentai pripažinti negaliojančiais 273

ND9D Papildomos apsaugos liudijimai 346

Sisteminė patentų rodyklė 347

Numerinė patentų rodyklė 352

Klasifikacijos skyriai 357

* *Pagal PINO standartą ST.17*

** *Pagal PINO standartą ST.16*

VALSTYBINIO PATENTŲ BIURO PRANEŠIMAS

Nuo 2016 m. sausio 1 d. VPB oficialus biuletenis skelbiamas 2 kartus per mėnesį – 10 ir 25 dienomis. Jeigu kalendorinio mėnesio 10 ar 25 diena yra nedarbo diena, VPB biuletenis paskelbiamas kitą po šios datos einančią darbo dieną. Iš anksto apskaičiuota konkreti paskelbimo diena yra nurodoma VPB biuletenio abiejų dalių tituliniuose lapuose.

Kiekvieno mėnesio 10 dieną skelbiamame VPB biuletenio numeryje skelbiami Lietuvos Respublikos patentų, Dizaino, Prekių ženklų registrų duomenys už laikotarpį nuo ankstesnio mėnesio 16 dienos iki to mėnesio paskutinės dienos bei kita paskelbimo dieną aktuali oficiali informacija.

Kiekvieno mėnesio 25 dieną skelbiamame VPB biuletenio numeryje skelbiami Lietuvos Respublikos patentų, Dizaino, Prekių ženklų registrų duomenys už laikotarpį nuo einamojo mėnesio nuo 1 iki 15 dienos bei kita paskelbimo dieną aktuali oficiali informacija.

LIETUVOS RESPUBLIKOS PATENTINIŲ PATIKĖTINIŲ SĄRAŠAS

Duomenys iš Lietuvos Respublikos patentinių patikėtinių registro.
Numeracija - pagal patentinių patikėtinių registro duomenis.

1. Vytautas Dovydėnas	V.Grybo g. 41-38, LT-10320 Vilnius tel. +370 5 231 28 11 faks. +370 5 261 76 93 litpa@email.lt
2. Angelė Gurklytė	J. Basanavičiaus g. 11, LT-03108 Vilnius tel. +370 5 212 35 58, +370 5 261 62 83 faks. +370 5 212 35 57 ppc@post.omnitel.net
3. Marius Jakulis - Jason	AAA Law, J. Jasinskio 16A, LT-03163 Vilnius tel. +370 5 252 66 76 faks. +370 5 252 66 70 info@AAALaw.EU
4. Leonas Antanas Kučinskas	Dr. Leono A. Kučinsko patentinių paslaugų firma, Kaštonų g. 5-7, LT-01107 Vilnius tel. +370 5 262 67 23, +370 698 80 624 faks. +370 5 260 96 65, +370 5 272 48 50 leopat@is.lt
6. Marija Lenkutienė	Patentinių paslaugų centras, UAB, Jono Basanavičiaus g. 11, LT-03108 Vilnius tel. +370 5 212 35 58, +370 5 261 62 83 faks. +370 5 212 35 57 ppc@ppcpatent.lt
7. Reda Žabolienė	Advokatės Redos Žabolienės kontora METIDA, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius tel. +370 5 249 08 30, +370 5 249 08 31, +370 5 249 08 32 faks. +370 5 249 08 33 patent@metida.lt, reda.zaboliene@metida.lt
8. Virgina Adolfina Draugelienė	UAB TARPINĖ, p.o. box 1202, LT-01007, A.P.Kavoliuko g. 24-152, LT-04328 Vilnius tel. +370 5 230 56 52, +370 614 13 670 faks. +370 5 248 97 37 draugeliene@tarpine.lt
9. Liudmila Gerasimovič	IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius tel. +370 5 231 08 27 faks. +370 5 231 05 93 info@gerasimovic.com
10. Vytautas Guobys	Ateities g. 3-9, LT-08306 Vilnius tel. +370 680 11 245 faks. +370 5 269 76 16 vgpatent.lt@gmail.com
11. dr. Nijolė Viktorija Mickevičienė	Panerių g. 79a, LT-48425 Kaunas tel. +370 37 26 02 23, +370 686 40 510 faks. +370 37 30 86 68 nemlietuva@hotmail.com
12. Genė Ona Sruogienė	UAB TARPINĖ, p.o. box 1202, LT-01007, A.P.Kavoliuko g. 24-152, LT-04328 Vilnius tel. +370 5 230 56 52, +370 614 13 671 faks. +370 5 248 97 37 sruogiene@tarpine.lt
16. Nijolė Aliukaitė	p.o.box 2860, LT-01008 Vilnius ACP tel. +370 5 275 04 54, +370 616 00266 n.aliukaite@takas.lt
18. Jarūta Lotužytė	Medžiotojų g. 12-30, LT-92240 Klaipėda tel. +370 46 21 68 14, +370 46 29 30 15
19. Nijolė Nemcevičienė	Nijolės Nemcevičienės patentinių paslaugų firma, Laisvės al. 101a - 105, LT-44291 Kaunas tel. +370 37 20 12 05, +370 687 155 95 faks. +370 37 20 12 05 ninema2009@yahoo.com
20. Aldona Orlienė	Kęstučio g. 59-11, LT-44303 Kaunas tel. +370 37 22 76 57, +370 37 70 58 04, +370 686 3 34 50 faks. +370 37 20 43 59
21. Aldona Pacevičienė	A. Mickevičiaus g. 29-6, LT-44245 Kaunas tel. +370 37 20 44 42, +370 37 40 78 02, +370 98 3 13 37 faks. +370 37 40 78 03 apaceviciene@takas.lt
22. Petras Puzinas	P.Puzino įmonė „Kalnuočiai“, Aguonų g. 140, LT-37452 Panevėžys tel. +370 45 57 63 00, +370 687 267 14 faks. +370 45 57 63 00 kalnuociai@post.omnitel.net
23. Raimonda Algimanta Skutele	Architektų g. 45-69, LT-04221 Vilnius tel. +370 5 244 05 74 faks. +370 5 244 05 74 almonda@takas.lt
24. Irena Milda Srėbalienė	Patentinių paslaugų centras, UAB, Jono Basanavičiaus g. 11, LT-03108 Vilnius tel. +370 5 212 35 58, +370 5 261 62 83 faks. +370 5 212 35 57 ppc@post.omnitel.net

25. Aurelija Šidlauskienė
Dr. V.Šidlauskas ir partneriai, UAB
K.Būgos g. 29, LT-44326 Kaunas
tel. +370 37 22 14 42, +370 698 787 25 faks. +370 37 22 14 42
aurelijosfirma@gmail.com

26. Lyra Tarnauskienė
UAB PATENTINĖ TEISINĖ APSAUGA,
Maironio g. 14 B-1, LT-44298 Kaunas
tel. +370 37 32 10 67, +370 687 160 17 faks. +370 37 32 10 90
lyrat@takas.lt

27. Milda Tumkevičienė
Patentinių paslaugų centras, UAB,
Jono Basanavičiaus g. 11, LT-03108 Vilnius
tel. +370 5 212 35 58, +370 5 261 62 83 faks. +370 5 212 35 57
ppc@ppcpatent.lt

29. Liucija Janickaitė
Inpatra UAB
Šeškinės g. 59-53, LT-07162 Vilnius
tel. +370 5 246 45 38, +370 686 518 25 faks. +370 5 246 45 38
pat.janickaite@gmail.com

30. Ramunė Garšvienė
Dūkštų g. 28-20, LT-07171 Vilnius
tel. +370 5 248 21 53 faks. +370 5 248 21 53
rgarsv@takas.lt

31. Stanislava Teleišienė
UAB „Brainera“,
Savanorių pr. 217, LT-02300 Vilnius
tel. +370 5 264 80 88, +370 601 094 42 faks. +370 5 264 80 99
info@brainera.lt, stase@skynet.lt

32. Ona Vaičiulienė
V. Druskio g. 9-46, LT-04306 Vilnius
tel. +370 5 244 47 49, +370 611 37 406 faks. +370 5 244 47 49
ovaic@takas.lt

34. Liudmila Čebotariova
Patentinių paslaugų centras, UAB,
J. Basanavičiaus g. 11, LT-03108 Vilnius
tel. +370 5 212 35 58, +370 5 261 62 83 faks. +370 5 212 35 57
ppc@post.omnitel.net

35. Otilija Klimaitienė
AAA Law, J.Jasinskio 16 A, LT-03163 Vilnius
tel. +370 5 252 66 76 faks. +370 5 252 66 70
o.klimaitiene@AAALaw.EU

36. Zita Grigienė
Savanorių pr. 222a-46, LT-50196 Kaunas
tel. +370 37 31 40 50, +370 37 77 04 24, +370 686 550 16 faks. +370 37 31 40 50
zita.grigiene@gmail.com

37. Tatjana Sterlina
UAB „Intels“, Naugarduko g.32/2, LT-03225 Vilnius
tel. +370 5 233 54 77 faks. +370 5 216 22 88
info@intels.lt, sterlina@post.5ci.lt

38. Gražina Pečiulienė
Bajorų kel. 11-18, LT-08466 Vilnius
tel. +370 6 860 32 86
grazina.peciuliene38@gmail.com

36. Zita Grigienė
Savanorių pr. 222a-46, LT-50196 Kaunas
tel. +370 37 31 40 50, +370 37 77 04 24, +370 686 550 16 faks. +370 37 31 40 50
zita.grigiene@gmail.com

37. Tatjana Sterlina
UAB „Intels“, Naugarduko g.32/2, LT-03225 Vilnius
tel. +370 5 233 54 77 faks. +370 5 216 22 88
info@intels.lt, sterlina@post.5ci.lt

38. Gražina Pečiulienė
Bajorų kel. 11-18, LT-08466 Vilnius
tel. +370 6 860 32 86
grazina.peciuliene38@gmail.com

39. Sigitas Bartkus
Breslaujos g. 3, LT-44403 Kaunas
tel. +370 37 40 18 30,+370 687 990 81 faks. +370 37 35 12 71
bartkus@mail.lei.lt

40. Nelia Janiušina
UAB „Intels“, Naugarduko g.32/2, LT-03225 Vilnius
tel. +370 5 233 54 77 faks. +370 5 216 22 88
info@intels.lt, intels@takas.lt

41. Danutė Lišauskaitė
Studentų g. 32-3, LT-50249 Kaunas
tel. +370 37 73 84 56

42. Aleksandras Loginovas
Studentų g. 32-3, LT- 50249 Kaunas
tel. +370 37 43 84 56

43. Marija Vanda Antanaitienė
p.o.box 3197, LT-06002 Vilnius
tel. +370 5 247 04 42 faks. +370 5 247 04 42
patent@takas.lt

44. Audronė Juodzevičienė
Medeinos g. 13-8, LT-06139 Vilnius
tel. +370 5 240 84 37
audrone.juodzeviciene@vilnius.lt

45. dr. Juozas Lapienis	UAB „MSP Europe“, Šeimyniškių g. 21-92, LT-09236 Vilnius tel. +370 5 271 26 45, +370 685 11 286 faks. +370 5 271 26 45 lt@mikhailyuk.com, juzalap@gmail.com
46. Telesforas Urbaitis	Advokatas Telesforas Urbaitis, Gedimino pr. 28/2-801, LT-01104 Vilnius tel. +370 673 30 429, +370 685 66 354 advokatas.Telesforas@gmail.com
47. Vaclovas Kiškis	Adomaičiai, Lavoriškių p-tas, LT-15032 Vilniaus raj. tel. +370 673 44 400 vaclovas@irii.lt, vaclovas@patentas.lt
48. Eglė Mickevičiūtė- Tiažkijienė	Advokatų kontora SORAINEN ir partneriai, Jogailos g. 4, Vilnius, LT-01116 tel. +370 5 272 39 24, +370 687 85880 faks. +370 5 272 39 24 emt@takas.lt
49. Vytautas Einoris	Gerbutavičiaus g. 1/42-155, LT-04318 Vilnius tel. +370 5 245 19 87 faks. +370 5 274 50 43 einavytas@hotmail.com
50. Aušra Pakėnienė	AAA Law, J.Jasinskio 16 A, LT-03163 Vilnius tel. +370 5 252 66 76 faks. +370 5 252 66 70 a.pakeniene@AAALaw.EU
51. Jurga Petniūnaitė	AAA Law, J.Jasinskio 16 A, LT-03163 Vilnius tel. +370 5 252 66 76 faks. +370 5 252 66 70 j.petniunaite@AAALaw.EU
52. Jelena Gerasimovič	IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius tel. +370 5 231 08 27 faks. +370 5 231 05 93 info@gerasimovic.com
53. Malvina Milda Pranskevičienė	IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius tel. +370 5 231 08 27 faks. +370 5 231 05 93 info@gerasimovic.com
54. Gediminas Pranevičius	Advokatų kontora VARUL, Konstitucijos pr. 7, LT-09308 Vilnius tel. +370 5 248 73 37 faks. +370 5 248 73 38 gediminas.pranevicius@ipforma.lt
55. Vitalija Banaitienė	UAB TARPINĖ, p.o. box 1202, LT-01007, A.P.Kavoliuko g. 24-152, LT-04328 Vilnius tel. +370 5 230 56 52, +370 699 02 023 faks. +370 5 248 97 37 banaitiene@tarpine.lt
56. Vilija Viešūnaitė	Advokatų profesinė bendrija „TRINITI LT“, L. Stuokos-Gucevičiaus g. 9, LT-01122 Vilnius tel. +370 5 231 22 11, +370 687 48 149 faks. +370 5 231 22 44 vilija.viesunaite@triniti.lt
57. Gvidas Urbonas	K. Donelaičio g. 33-101, LT-44240 Kaunas tel. +370 37 324 432, +370 698 83 666 faks. +370 37 208 930 gvidasu@one.lt
58. Birutė Dauderienė	Advokatės Redos Žabolienės kontora METIDA, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius tel. +370 5 249 08 30 faks. +370 5 249 08 33 birute.dauderiene@metida.lt
59. Inga Lukauskienė	Advokatės Redos Žabolienės kontora METIDA, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius tel. +370 5 249 08 30 faks. +370 5 249 08 33 inga.lukauskiene@metida.lt
60. Lina Meškauskienė	Advokatės Meškauskienės kontora, Pylimo g. 19, LT-01141 Vilnius tel. +370 5 272 17 17 faks. +370 5 272 19 84 lina.meskauskiene@akmp.lt, info@akmp.lt
61. Edita Ivanauskienė	Advokatės Editos Ivanauskienės kontora, Vokiečių g. 7-2, LT-01130 Vilnius, Lietuva tel. +370 5 277 77 04, +370 686 11 584 faks. +370 5 277 77 04 edita_ivanauskiene@yahoo.com, edita.ivanauskiene@eiip.lt
62. Tomas Jakubauskas	Advokatų kontora Eversheds Saladžius, Jasinskio g. 16B, LT-01112 Vilnius tel. +370 5 239 2391 faks. +370 5 239 2390 tomas.jakubauskas@eversheds.lt
63. Valters Gencs	A. Tumėno g. 4, LT-01109, Vilnius, Lietuva, Kr. Valdemara g. 21, LV-1010, Riga, Latvija tel. +370 5 261 1000, +371 6 724 0090 faks. +370 5 261 1100, +371 6 724 0091 gencs.valters@gencs.eu
64. Evaldas Pabrėža	UAB “IAM consultants”, Kalvarijų g. 125 B, LT-08221 Vilnius tel. +370 683 78384 info@iam.lt, evaldas@iam.lt

VALSTYBIŲ, TERITORIJŲ, KITŲ SUBJEKTŲ IR TARPVYRIAUSYBINIŲ ORGANIZACIJŲ ŽYMĖJIMO KODAI PAGAL PINO STANDARTĄ ST.3

AD	Andora	AD	Andorra
AE	Jungtiniai Arabų Emyratai	AE	United Arab Emirates
AF	Afganistanas	AF	Afghanistan
AG	Antigva ir Barbuda	AG	Antigua and Barbuda
AI	Angilija	AI	Anguilla
AL	Albanija	AL	Albania
AM	Armėnija	AM	Armenia
AO	Angola	AO	Angola
AP	Afrikos regioninė pramoninės nuosavybės organizacija (ARIPO)	AP	African Regional Industrial Property Organization (ARIPO)
AR	Argentina	AR	Argentina
AT	Austrija	AT	Austria
AU	Australija	AU	Australia
AW	Aruba	AW	Aruba
AZ	Azerbaidžanas	AZ	Azerbaijan
BA	Bosnija ir Hercegovina	BA	Bosnia and Herzegovina
BB	Barbadosas	BB	Barbados
BD	Bangladešas	BD	Bangladesh
BE	Belgija	BE	Belgium
BF	Burkina Fasas	BF	Burkina Faso
BG	Bulgarija	BG	Bulgaria
BH	Bahreinas	BH	Bahrain
BI	Burundis	BI	Burundi
BJ	Beninas	BJ	Benin
BM	Bermuda	BM	Bermuda
BN	Brunėjus Darusalamas	BN	Brunei Darussalam
BO	Bolivijos Daugiatautė Valstybė	BO	Bolivia, Plurinational State of
BQ	Boneras, Sint Eustatijus ir Saba	BQ	Bonaire, Sint Eustatius and Saba
BR	Brazilija	BR	Brazil
BS	Bahamos	BS	Bahamas
BT	Butanas	BT	Bhutan
BV	Buvė Sala	BV	Bouvet Island
BW	Botsvana	BW	Botswana
BX	Beneliukso intelektinės nuosavybės tarnyba (BOIP)	BX	Benelux Office for Intelectual Property (BOIP)
BY	Baltarusija	BY	Belarus
BZ	Belizas	BZ	Belize
CA	Kanada	CA	Canada
CD	Kongo Demokratinė Respublika	CD	Democratic Republic of the Congo
CF	Centrinės Afrikos Respublika	CF	Central African Republic
CG	Kongas	CG	Congo
CH	Šveicarija	CH	Switzerland
CI	Dramblio Kaulo Krantas	CI	Cote d'Ivoire
CK	Kuko Salos	CK	Cook Islands
CL	Čilė	CL	Chile
CM	Kamerūnas	CM	Cameroon
CN	Kinija	CN	China
CO	Kolumbija	CO	Colombia
CR	Kosta Rika	CR	Costa Rica
CU	Kuba	CU	Cuba
CV	Žaliasis Kyšulys	CV	Cape Verde
CW	Kurakao	CW	Curaçao
CY	Kipras	CY	Cyprus
CZ	Čekija	CZ	Czech Republic
DE	Vokietija	DE	Germany
DJ	Džibutis	DJ	Djibouti
DK	Danija	DK	Denmark
DM	Dominika	DM	Dominica
DO	Dominikos Respublika	DO	Dominican Republic
DZ	Alžyras	DZ	Algeria
EA	Eurazijos patentų organizacija (EAPO)	EA	Eurasian Patent Organization (EAPO)
EC	Ekvadoras	EC	Ecuador
EE	Estija	EE	Estonia
EG	Egiptas	EG	Egypt
EH	Vakarų Sachara	EH	Western Sahara
EM	Vidaus rinkos harmonizavimo tarnyba (prekių ženklai ir dizainai) (OHIM)	EM	Office for Harmonization in the Internal Market (Trademarks and Designs) (OHIM)
EP	Europos patentų tarnyba (EPT)	EP	European Patent Office (EPO)
ER	Eritrėja	ER	Eritrea
ES	Ispanija	ES	Spain
ET	Etiopija	ET	Ethiopia
FI	Suomija	FI	Finland
FJ	Fidžis	FJ	Fiji
FK	Folklando Salos (Malvinai)	FK	Falkland Islands (Malvinas)
FO	Farerų Salos	FO	Faroe Islands
FR	Prancūzija	FR	France
GA	Gabonas	GA	Gabon
GB	Jungtinė Karalystė	GB	United Kingdom
GC	Persijos įlankos Arabų valstybių bendradarbiavimo tarybos (GCC) patentų tarnyba	GC	Patent Office of the Cooperation Council for the Arab States of the Gulf (GCC)
GD	Grenada	GD	Grenada
GE	Gruzija	GE	Georgia
GG	Gernsis	GG	Guernsey
GH	Gana	GH	Ghana
GI	Gibraltaras	GI	Gibraltar
GL	Grenlandija	GL	Greenland
GM	Gambija	GM	Gambia
GN	Gvinėja	GN	Guinea
GQ	Pusiaujo Gvinėja	GQ	Equatorial Guinea
GR	Graikija	GR	Greece
GS	Pietų Georgijos ir Pietų Sandvičo Salos	GS	South Georgia and the South Sandwich Islands
GT	Gvatemala	GT	Guatemala
GW	Bisau Gvinėja	GW	Guinea-Bissau
GY	Gajana	GY	Guyana
HK	Ypatingasis Administracinis Kinijos Regionas Honkongas	HK	The Hong Kong Special Administrative Region of the People's Republic of China
HN	Hondūras	HN	Honduras
HR	Kroatija	HR	Croatia
HT	Haitis	HT	Haiti
HU	Vengrija	HU	Hungary
IB	Pasaulinės intelektinės nuosavybės organizacijos Tarptautinis biuras (WIPO)	IB	International Bureau of the World Intellectual Property Organization (WIPO)
ID	Indonezija	ID	Indonesia
IE	Airija	IE	Ireland
IL	Izraelis	IL	Israel
IM	Meno sala	IM	Isle of Man
IN	Indija	IN	India
IQ	Irakas	IQ	Iraq
IR	Irano Islamo Respublika	IR	Iran (Islamic Republic of)
IS	Islandija	IS	Iceland
IT	Italija	IT	Italy
JE	Džersis	JE	Jersey
JM	Jamaika	JM	Jamaica
JO	Jordanija	JO	Jordan
JP	Japonija	JP	Japan
KE	Kenija	KE	Kenya
KG	Kirgizija	KG	Kyrgyzstan
KH	Kambodža	KH	Cambodia
KI	Kiribatis	KI	Kiribati
KM	Komorai	KM	Comoros
KN	Sent Kitsas ir Nevis	KN	Saint Kitts and Nevis
KP	Korėjos Liaudies Demokratinė Respublika	KP	Democratic People's Republic of Korea
KR	Korėjos Respublika	KR	Republic of Korea

KW	Kuveitas	KW	Kuwait
KY	Kaimanų Salos	KY	Cayman Islands
KZ	Kazachstanas	KZ	Kazakhstan
LA	Laoso Liaudies Demokratinė Respublika	LA	Lao People's Democratic Republic
LB	Libanas	LB	Lebanon
LC	Sent Lusija	LC	Saint Lucia
LI	Lichtenšteinas	LI	Liechtenstein
LK	Šri Lanka	LK	Sri Lanka
LR	Liberija	LR	Liberia
LS	Lesotas	LS	Lesotho
LT	Lietuva	LT	Lithuania
LU	Liuksemburgas	LU	Luxembourg
LV	Latvija	LV	Latvia
LY	Libija	LY	Libya
MA	Marokas	MA	Morocco
MC	Monakas	MC	Monaco
MD	Moldova	MD	Republic of Moldova
ME	Juodkalnija	ME	Montenegro
MG	Madagaskaras	MG	Madagascar
MK	Buvusioji Jugoslavijos Respublika Makedonija	MK	The former Yugoslav Republic of Macedonia
ML	Malis	ML	Mali
MM	Mianmaras	MM	Myanmar
MN	Mongolija	MN	Mongolia
MO	Makao	MO	Macao
MP	Marianos Šiaurinės Salos	MP	Northern Mariana Islands
MR	Mauritanija	MR	Mauritania
MS	Montseratas	MS	Montserrat
MT	Malta	MT	Malta
MU	Mauricijus	MU	Mauritius
MV	Maldyvai	MV	Maldives
MW	Malavis	MW	Malawi
MX	Meksika	MX	Mexico
MY	Malaizija	MY	Malaysia
MZ	Mozambikas	MZ	Mozambique
NA	Namibija	NA	Namibia
NE	Nigeris	NE	Niger
NG	Nigerija	NG	Nigeria
NI	Nikaragva	NI	Nicaragua
NL	Nyderlandai	NL	Netherlands
NO	Norvegija	NO	Norway
NP	Nepalas	NP	Nepal
NR	Nauru	NR	Nauru
NZ	Naujoji Zelandija	NZ	New Zealand
OA	Afrikos intelektinės nuosavybės organizacija (OAPI)	OA	African Intellectual Property Organization (OAPI)
OM	Omanas	OM	Oman
PA	Panama	PA	Panama
PE	Peru	PE	Peru
PG	Papua Naujoji Gvinėja	PG	Papua New Guinea
PH	Filipinai	PH	Philippines
PK	Pakistanas	PK	Pakistan
PL	Lenkija	PL	Poland
PT	Portugalija	PT	Portugal
PW	Palau	PW	Palau
PY	Paragvajus	PY	Paraguay
QA	Kataras	QA	Qatar
QZ	Bendrijos augalų veislių tarnyba (Europos Sąjunga)	QZ	Community Plant Variety Office (European Union) (CPVO)
RO	Rumunija	RO	Romania
RS	Serbija	RS	Serbia
RU	Rusijos Federacija	RU	Russian Federation
RW	Ruanda	RW	Rwanda
SA	Saudo Arabija	SA	Saudi Arabia
SB	Saliamono Salos	SB	Solomon Islands
SC	Seišeliai	SC	Seychelles
SD	Sudanas	SD	Sudan
SE	Švedija	SE	Sweden
SG	Singapūras	SG	Singapore
SH	Šv. Elenos, Dangun Žengimo ir Tristano da Kunjos salos	SH	Saint Helena, Ascension and Tristan da Cunha
SI	Slovėnija	SI	Slovenia
SK	Slovakija	SK	Slovakia
SL	Siera Leonė	SL	Sierra Leone
SM	San Marinas	SM	San Marino
SN	Senegalas	SN	Senegal
SO	Somalis	SO	Somalia
SR	Surinamas	SR	Suriname
SS	Pietų Sudanas	SS	South Sudan
ST	San Tomė ir Prinsipė	ST	Sao Tome and Principe
SV	Salvadoras	SV	El Salvador
SX	Sint Martenas (Olandijos dalis)	SX	Sint Maarten (Dutch part)
SY	Sirijos Arabų Respublika	SY	Syrian Arab Republic
SZ	Svazilendas	SZ	Swaziland
TC	Terkso ir Kaikoso Salos	TC	Turks and Caicos Islands
TD	Čadas	TD	Chad
TG	Togas	TG	Togo
TH	Tailandas	TH	Thailand
TJ	Tadžikija	TJ	Tajikistan
TL	Rytų Timoras	TL	Timor–Leste
TM	Turkmėnija	TM	Turkmenistan
TN	Tunisas	TN	Tunisia
TO	Tonga	TO	Tonga
TR	Turkija	TR	Turkey
TT	Trinidadas ir Tobagas	TT	Trinidad and Tobago
TV	Tuvalu	TV	Tuvalu
TW	Taivanis, Kinijos provincija	TW	Taiwan, Province of China
TZ	Tanzanija	TZ	United Republic of Tanzania
UA	Ukraina	UA	Ukraine
UG	Uganda	UG	Uganda
US	Jungtinės Amerikos Valstijos	US	United States of America
UY	Urugvajus	UY	Uruguay
UZ	Uzbekistanas	UZ	Uzbekistan
VA	Vatikanas	VA	Holy See
VC	Sent Vinsentas ir Grenadinai	VC	Saint Vincent and the Grenadines
VE	Venesuelos Bolivaro Respublika	VE	Venezuela, Bolivarian Republic of
VG	Virdžinijos Salos (Britų)	VG	Virgin Islands (British)
VN	Vietnamas	VN	Viet Nam
VU	Vanuatu	VU	Vanuatu
WO	Pasaulinė intelektinės nuosavybės organizacija (WIPO Tarptautinis biuras)	WO	World Intellectual Property Organization (WIPO) (International Bureau of)
WS	Samoa	WS	Samoa
XN	Šiaurės patentų institutas (NPI)	XN	Nordic Patent Institute (NPI)
XU	Tarptautinė naujų augalų veislių apsaugos sąjunga	XU	International Union for the Protection of New Varieties of Plants (UPOV)
XV	Višegrado patentų institutas (VPI)	XV	Visegrad Patent Institute (VPI)
YE	Jemenas	YE	Yemen
ZA	Pietų Afrikos Respublika	ZA	South Africa
ZM	Zambija	ZM	Zambia
ZW	Zimbabvė	ZW	Zimbabwe

IŠRADIMAI

*(11)** Dokumento numeris
Number of the document

(13) Dokumento rūšis**:
A - paskelbta patentinė paraiška
B - išduotas patentas
T - Europos patento apibrėžties vertimas
Kind of document:
A - published Application
B - granted Patent
T - translation of European Patent Claim

(15) Atitaisymas
Patent correction information

(21) Paraiškos numeris
Application number

(22) Paraiškos padavimo data
Date of filing the application

(24) Liudijimo įsigaliojimo data
Date of coming into effect of SPC

(30) Prioriteto paraiškos numeris, data, valstybės kodas***
Priority application number, date, code of country

(41) Paraiškos paskelbimo data
Date of publication of the application

(45) Patento paskelbimo data
Date of publication of the patent

(46) Apibrėžties vertimo paskelbimo data
Date of publication of the claims translation

(48) Atitaisymo data
Date of issuance of a corrected patent document

(51) Tarptautinės patentų klasifikacijos indeksai
Indication of International Patent Classification

(54) Išradimo pavadinimas
Title of the invention

(57) Išradimo apibrėžtis/Referatas
Claim/Abstract

(60) Paraiškos, paduotos užsienio patentų tarnybai, duomenys (paraiškos numeris, paraiškos padavimo data, valstybės kodas)
Data relating to the application filed with a foreign patent office (application number, date, code of country)

(62) Paraiškos, iš kurios dokumentas išskirtas, numeris
Number of the earlier application

(68) Patento numeris
Patent number

(71) Pareiškėjo pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas
Name and address of applicant, code of country

(72) Išradėjo vardas, pavardė, valstybės kodas
Name of inventor, code of country

(73) Savininko pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas
Name and address of grantee, code of country

(74) Patentinio patikėtinio registracijos numeris/ atstovo vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas
Name, registration number, address of attorney/representative, code of country

(83) Mikroorganizmo deponavimo numeris ir vieta, valstybės kodas
Number and place of deposit of the microorganism, code of country

(85) Nacionalinio PCT lygio pradžios data
Date of commencement of the national phase pursuant to the PCT

(86) Tarptautinės paraiškos padavimo duomenys (paraiškos numeris, paraiškos padavimo data)
Data relating to the filing PCT application (number of application, date of filing application)

(87) Tarptautinės paraiškos paskelbimo duomenys (paskelbimo numeris, paskelbimo data)
Publication data of the PCT application (publication number, publication date)

(92) Vaisto ar augalų apsaugos priemonės pirmojo nacionalinio registravimo liudijimo numeris ir išdavimo data
Number and date of the first national authorization to place the medicinal or plant protection product on the market

(93) Vaisto ar augalų apsaugos priemonės pirmojo registravimo regioninėje ekonominėje bendrijoje liudijimo numeris, išdavimo data ir valstybės kodas
Number, date and code of country of origin of the first authorization to place the medicinal or plant protection product on the market within regional economic community

(94) Liudijimo galiojimo termino pasibaigimo data
Calculated date of expiry of the SPC

(95) Veikliosios medžiagos pavadinimas
Name of the product protected by the basic patent

(96) Europos paraiškos padavimo duomenys (paraiškos numeris, paraiškos padavimo data)
Data relating to the filing European application (number of application, date of filing application)

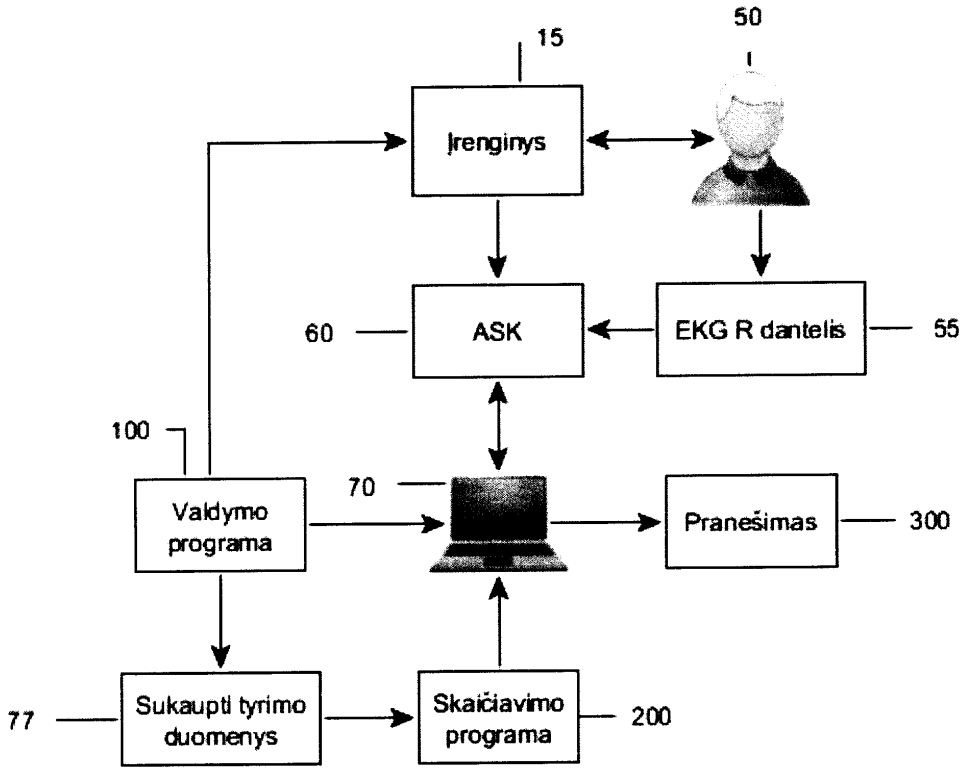
(97) Europos paraiškos paskelbimo duomenys (paraiškos paskelbimo data, patento paskelbimo data)
Publication data of the European application (publication date of aplication; publication date of patent)

** Pagal PINO standartą ST.9*
*** Pagal PINO standartą ST.16*
**** Pagal PINO standartą ST.3*

Patento paraiškos, paskelbtos pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 26 straipsnį

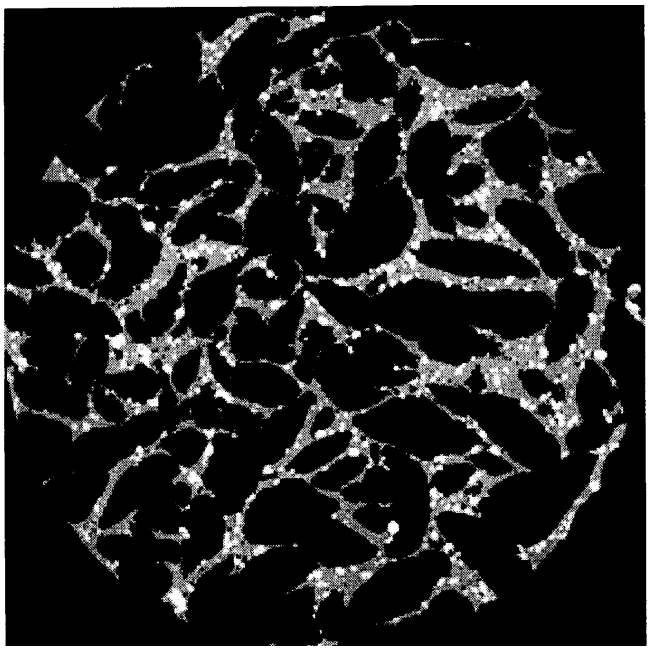
(51) Int. Cl. (2016.01): **A61B 5/00**
(21) **2014 118**
(13) **A**
(22) 2014-10-13
(71) KLAIPĖDOS UNIVERSITETAS, H. Manto g. 84, Klaipėda, LT
(72) Albinas STANKUS, LT
Žydrūnas LUKOŠIUS, LT
(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Miego arterijos kraujo spaudimo ir jo pulsinės bangos matavimo įrenginys ir sistema augmentacijos indekso ir miego arterijos vidinio skersmens skaičiavimui ir skaičiavimo būdas

(57) Šis išradimas pateikia miego arterijos kraujo spaudimo ir jo pulsinės bangos matavimo įrenginį ir sistemą, augmentacijos indekso ir miego arterijos vidinio skersmens apskaičiavimui ir jų apskaičiavimo būdą, kur kinėta miego arterijos kraujo spaudimoir jo pulsinės bangos matavimo sistema apima įrenginį, susidedantį bent iš vieno tvirtinimo prie naudotojo kūno dalies įtaiso, pavaros, ir bent vieno jėgos jutiklio. Minėta sistema papildomai apima analoginio signalo į skaitmeninį signalą keitiklį,įrenginio valdymui skirtą procesorinę priemonę, galinčią vykdyti variklio valdymo programą ir augmentacijos indekso bei miego arterijos vidinio skersmens dydžio apskaičiavimo programą, kur minėtos programos yra saugomos laikmenoje. Naudojant matavimo įrenginį ir sistemą pagal šį išradimą yra matuojamas miego arterijos kraujo spaudimas ir jo pulsinė banga, naudojant procesorine priemone vykdomą, laikmenoje esančią, valdymo kompiuterinę programą, ir skaičiuojamas sistolinio bei diastolinio kraujo spaudimas, augmentacijos indeksas ir miego arterijos vidinis skersmuo, naudojant procesorine priemone vykdomą laikmenoje esančią skaičiavimo kompiuterinę programą.



Apibrėžties punktai: 11, brėžiniai: 9.

(51) Int. Cl. (2016.01): **A61F 2/00**
(21) **2014 117**
(13) **A**
(22) 2014-10-13
(71) UAB “Biomė”, Giros g. 4-15, LT-47338 Kaunas, LT
(72) Eugenijus LIESIS, LT
Odeta BANIUKAITIENĖ, LT
Alisa PALAVENIENĖ, LT
Jolanta LIESIENĖ, LT
(74) Aurelija ŠIDLAUSKIENĖ, 25, Dr. V. Šidlauskas ir partneriai, UAB, K. Būgos g. 29, LT-44326 Kaunas, LT
(54) Trimatis porėtas celiuliozės karkasas kaulo inžinerijai ir jo gavimo būdas
(57) Išradimas priskiriamas medžiagų inžinerijos sričiai ir gali būti panaudotas odontologijoje ar kitos srities chirurgijoje kaulo audinio regeneracijai defekto vietoje.Trimatis porėtas celiuliozės karkasas, pasižymintis bio suderinamumu ir osteokondukcinėmis savybėmis, gaunamas sudarant kompozitą iš gamtinio polimero celiuliozės ir biogeninių kalcio šaltinių, būtent, autogeninio (nuosavo) kaulo, alogeninio (kito tos pačios rūšies, t.y. žmogaus, kito individo) kaulo, ksenogeninio (kitos rūšies organizmo) kaulo dalelių. Šio išradimo tikslas gauti trimatį porėtą celiuliozės karkasą, kuris pasižymėtų bio suderinamumu ir geromis osteokondukcinėmis savybėmis ir struktūra, atitinkančia natūralaus kaulo morfologiją. Išradimo tikslas pasiekiamas sudarant celiuliozės kompozitą su biogeninių kaulų 0,01 - 2000 mikronų dydžio dalelėmis, esant masių santykiui 1:0,12-6,0. Atskiru atveju celiuliozės kompozitas sudaromas su sepijos kaulo, kuriame yra mineraliniai junginiai ir polisacharidas chitinas, 0,01-2000 mikronų dydžio dalelėmis. Atskiru atveju karkaso porų paviršius padengiamas kolagenu, trombocitais praturtintu fibrinu, įvairiais augimo faktoriais, terapeutiniais priedais. Trimatės porėtos struktūros, atitinkančos kaulo morfologiją, karkasas gaunamas celiuliozės gelį formuojant su įterptomis biogeninio kaulo dalelėmis, po to jį inkliuduojant 10-30%, vandeniniu alkoholio tirpalu ir liofilizuojant arba veikiant gelį superkriziniu anglies dioksidu 24-70 Mpa slegyje 35 - 80° temperatūroje. Gautas blokelio formos karkasas gali būti sumalamas iki norimo dydžio granulių ir/ar iš jų pagaminama pasta.



Apibrėžties punktai: 7, brėžiniai: 5.

---

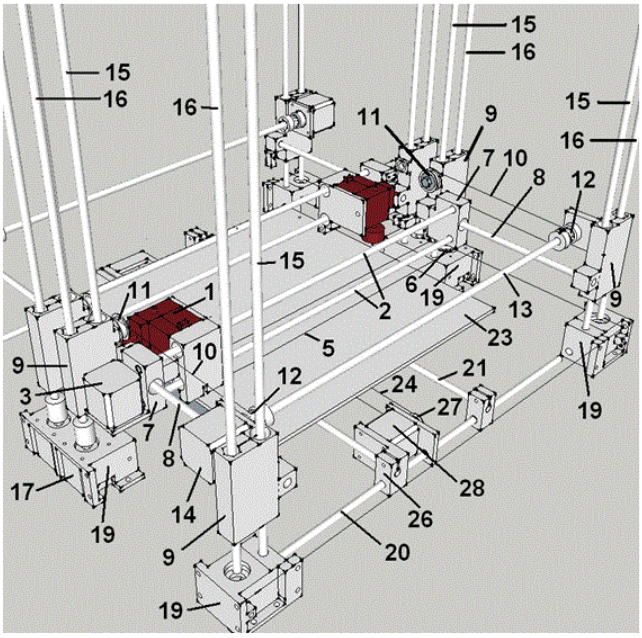
(51) Int. Cl. (2016.01): **B29C 67/00**
B41J 2/00
B22F 7/00
B28B 1/00
(21) **2014 126**
(13) **A**
(22) 2014-10-28
(71) UAB “Phantom Group”, B. Sruogos g. 6, LT-50250 Kaunas, LT

(72) Eimantas TOMKEVIČIUS, LT

(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija “Žabolienė ir partneriai METIDA”, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT

(54) Trimačių objektų spausdinimo įtaisas, turintis bent dvi spausdinimo galvutes ir padėklą sujungtus bent septynioms ašims ir jų valdymo būdas

(57) Šiuo išradimo aprašymu pateikiamas trimačių objektų formavimo spausdinant įtaisas, turintis bent dvi spausdinimo galvutes ir spausdinimo padėklą, kurie tarpusavyje susieti mažiausiai septyniomis ašimis - po tris ašis vienai spausdinimo galvutei ir viena ašis padėklui. Minėtas spausdinimo galvutes ir padėklą valdo valdymo sistema pasižyminti dirbtiniu intelektu, kuris optimizuoja spausdinimo galvučių ir padėklo judėjimo trajektorijas ir jų sąveiką, siekiant trumpiausio spausdinimo laiko. Taip pat minėtas dirbtinis intelektas turi mokymosi funkciją, kuri lygina trajektorijų optimizavimo rezultatus su realiais spausdinimo rezultatais, analizuoja galimų neatitikimų priežastis, atsižvelgia į minėtas priežastis, panaudoja jas ateities spausdinimo algoritmų sudaryme, identifikuoja galimus gedimus, vykdo jų prevenciją ir panašiai.



Apibrėžties punktai: 3, brėžiniai: 4.

---

(51) Int. Cl. (2016.01): **F01K 11/00**
F22D 11/00
G21D 3/00

(21) **2015 091**

(13) **A**

(22) 2015-10-28

(30) 2014-220000, 2014-10-29, JP

(71) Hitachi-GE Nuclear Energy, Ltd., 1-1, Saiwai-cho 3-chome, Hitachi-shi, Ibaraki 317-0073, JP

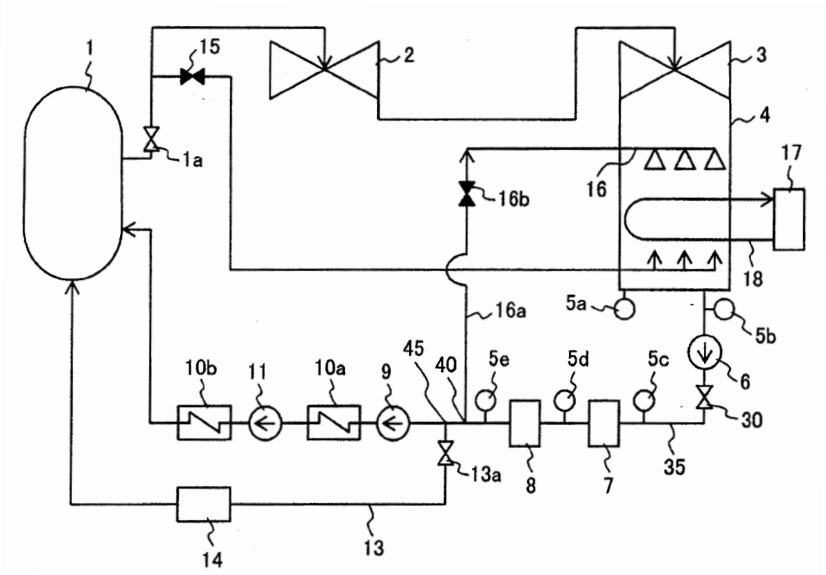
(72) Yamato MIKAMI, JP
Masayuki NAGASAWA, JP

(74) Liudmila GERASIMOVIČ, 9, IĮ “Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis”, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius, LT

(54) Jėgainė

(57) Problema: Pasiūlyti jėgainę, kurioje galima išvengti jūros vandens plitimo jėgainėje nesugadinant garo turbinos, kai kondensatoriuje yra jūros vandens nuotėkis. Sprendimas: Jėgainė, kuri turi: garo generatorių (1); turbiną (3), kurią suka garo generatoriuje (1) gaminamas garas; kondensatorių (4), kuris jūros vandeniu aušina garą, išleidžiamą iš garo turbinos (3), ir tokiu būdu susidaro vandens kondensatas; vandens kondensato vamzdį (35), kuriuo tiekiamas vandens kondensatas iš kondensatoriaus(4) į garo generatorių (1); jūros vandens nuotėkio aptikimo įtaisus (5d, 5e), kurie įrengti vandens kondensato vamzdyje (35) ir aptinka jūros vandens nuotėkį kondensatoriuje (4); kondensatoriaus garų temperatūros reguliatoriaus purkštuvą (16), kuris prijungtas prie vandens kondensato vamzdžio (35) ir į jį tiekiamas vandens kondensatas iš susijungimo vietos 40, ir jis purškia vandens kondensatą į garą kondensatoriuje (4); ir vamzdį

(13), kuris atsišakoja nuo vandens kondensato vamzdžio (35) ir tiekia vandens kondensatą į garo generatorių (1). Jeigu jūros vandens nuotėkio aptikimo įtaisai (5d ir 5e) aptinka jūros vandens nuotėkį kondensatoriuje (4), vandens kondensato tiekimas iš susijungimo vietos 40 į garo generatorių (1) ir vandens kondensato tiekimas į vamzdį (13), atsišakojantį nuo vandens kondensato vamzdžio (35) yra nutraukiami.



Apibrėžties punktai: 9, brėžiniai: 6.

---

(51) Int. Cl. (2016.01): **G01N 1/00**
G01N 3/00

(21) **2015 058**

(13) **A**

(22) 2015-07-14

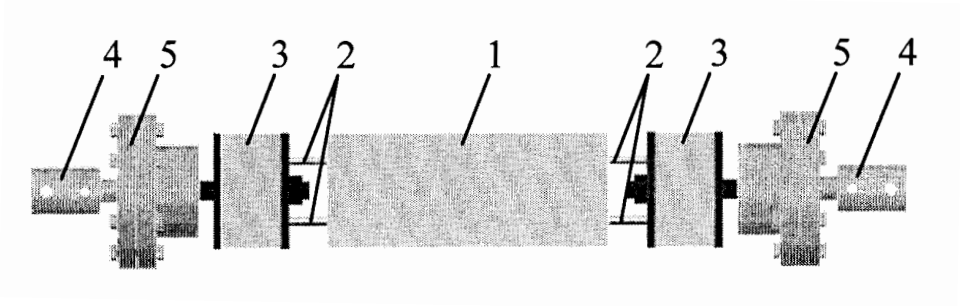
(71) VILNIAUS GEDIMINO TECHNIKOS UNIVERSITETAS, Saulėtekio al. 11, LT-10223 Vilnius, LT

(72) Viktor GRIBNIAK, LT
Arvydas RIMKUS, LT

(74) Vytautas GUOBYS, 10, Ateities g. 3-9, LT-08306 Vilnius, LT

(54) Betoninio konstrukcinio elemento armatūros strypų grupės tvirtinimo įranga

(57) Išradimas priklauso statybinių konstrukcinių elementų sričiai ir gali būti panaudotas armuoto betono konstrukcinių elementų gamybai bei jų mechaninių savybių tyrimams.Tvirtinimo įranga turi prie abiejų betoninio konstrukcinio elemento (1) galų du simetriškai įrengtus armatūros strypų (2) inkaravimo mazgus (3), kuriuos sudaro dvi viena nuo kitos tarpu atskirtos plokštelės (6), sujungtos centriniu (7) ir mažiausiai keturiais strypais (8), kurios turi tapačiai išdėstytas kiaurymes, pro kurias yra prakišti betoninio elemento armatūros strypai (2), kurie tarpe tarp plokštelių (6) yra užpilami betonu (9). Centrinis strypas (7) yra sujungtas su tempimo mašina (4).Tarp betoninio konstrukcinio elemento (1) kraštų ir inkaravimo mazgų (3) yra numatytas tarpas. Konstrukcinis elementas (1) ir inkaravimo mazgai (3) gali būti pagaminti tuo pat metu ir turėti tą patį arba skirtingos sudėties užpildą (9). Inkaravimo mazgai (3) gali būti pagaminti prieš gaminant elementą (1) ir turėti papildomą apspaudimo įrangą (10).



Apibrėžties punktai: 6, brėžiniai: 4.

---

(51) Int. Cl. (2016.01): **G06Q 10/00**
A61C 3/00

(21) **2014 121**

(13) **A**

(22) 2014-10-14

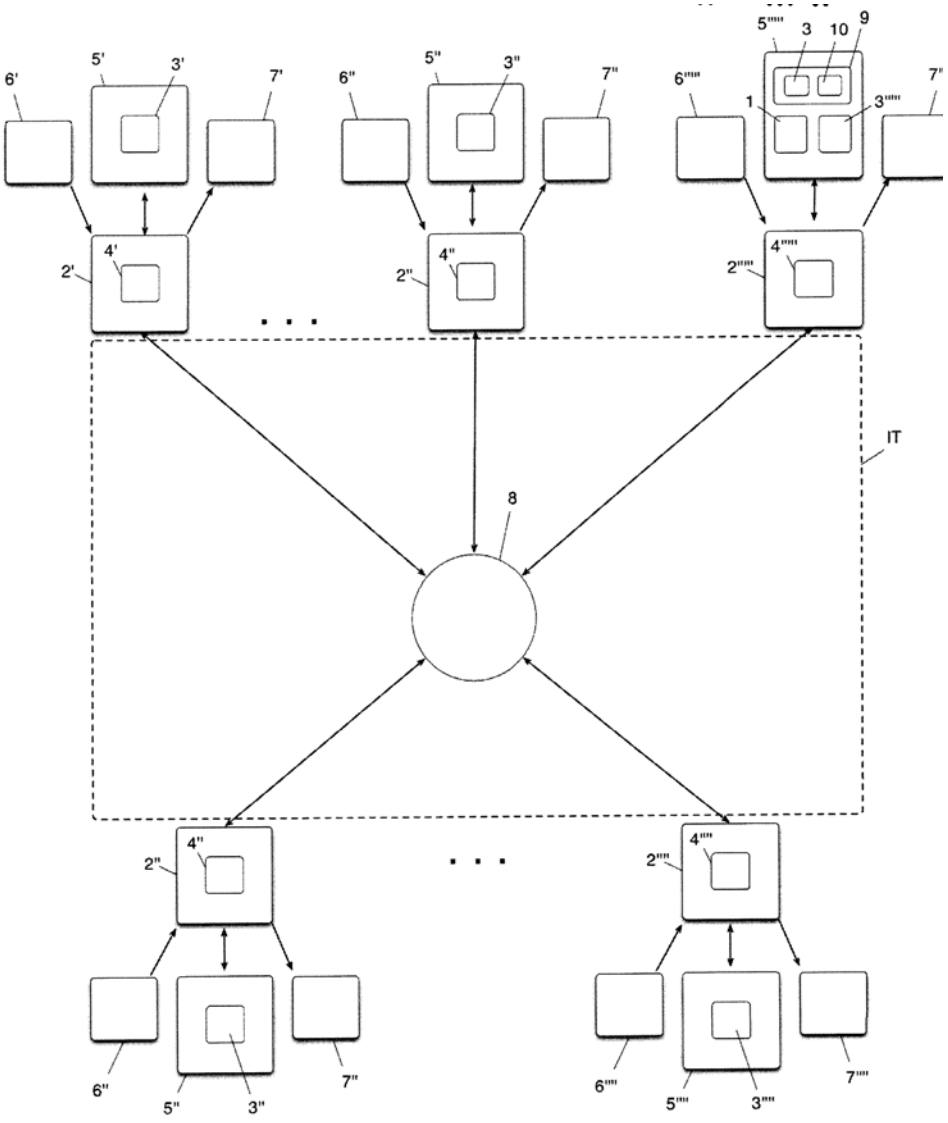
(71) UAB “DTL Vilnius”, Žirmūnų g. 70, Vilnius, LT

(72) Jūratė GOLOCHVOŠČIŪTĖ-ANDRIJAUSKIENĖ, LT
Rolandas ANDRIJAUSKAS, LT
Robertas GUSTAITIS, LT

(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

(54) Odontologijos paciento protezavimo gydymo procesą administruojantis būdas ir sistema

(57) Išradimas yra susijęs su odontologijos paciento protezavimo gydymo plano sudarymo ir administravimo sritimi, o tiksliau odontologijos paciento protezavimo gydymo proceso administravimo būdu ir sistema. Šis išradimas yra skirtas užtikrinanti gydymo etapų paskaičiavimą, naudojant planavimo sistemą, kuria yra įgyvendinamas odontologo ir dantų techniko laboratorijos darbo organizavimo pagal specifinį darbo protokolą būdas. Vadovaujantis šiuo protokolu, kiekvienas protezavimo žingsnis yra atliekamanuosekliai ir kokybiškai, apjungiant skirtingus dantų protezavimo etapus. Dėl to sumažėja nesėkmingo gydymo etapo rizika.



Apibrėžties punktai: 12, brėžiniai: 17.

(51) Int. Cl. (2016.01): **G08C 17/00**
(21) **2014 122**
(13) **A**
(22) 2014-10-15
(71) ELDES, UAB, Ukmergės g. 283B, LT-06313 Vilnius, LT
(72) NESKELBIAMA
(74) Virgina Adolfina DRAUGELIENĖ, 8, UAB TARPINĖ, A.P.Kavoliuko g. 24-152, LT-04328 Vilnius, LT
(54) Mobilaus telemetrinio įrenginio duomenų perdavimo būdas
(57) Išradimas priklauso telemetriniu įrenginiu kontroliuojamų parametrų ar kitų signalų perdavimo sistemoms ir būdams. Mobilaus telemetrinio įrenginio duomenų perdavimo būdas apimą šią operacijų seką: telemetriniame įrenginyje iš anksto aktyvuojamas norimas skaičius apibrėžtų sąlygų, kurių bent vieną patenkinus telemetrinis įrenginys mobiliuoju ryšiu siunčia į vatotojo mobilųjį terminalą SMS trumpąją žinutę, kurioje užkoduotas paslaugų tiekėjo serverio unikalus internetinis adresas, telemetrinio įrenginio atpažinimo kodas, laikas ir patenkintos arba patenkintų nustatytų sąlygų kodai. Aktyvavus internetinę nuorodą, žinutė interneto ryšiu perduodama į paslaugų tiekėjo serverį, kuris žinutę dekoduoja ir interneto ryšiu perduoda vartotojui patogia forma, informuojant jį, kokios nustatytos apibrėžtos sąlygos buvo patenkintos, o taip pat duomenis kaupia paslaugų tiekėjo serveryje su galimybe vėliau juos parodyti vartotojui.

Apibrėžties punktai: 2, brėžiniai: 1.

Patentai 6266 - 6271 paskelbti pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 28 straipsnį

(51) Int. Cl. (2016.01): **A23K 1/00**
C12N 1/00

(11) **6270**

(13) B

(21) 2014 109

(22) 2014-09-24

(41) 2016-04-11

(72) Elena BARTKIENĖ, LT
Gražina JUODEIKIENĖ, LT
Ramūnas GARBARAVIČIUS, LT

(73) UAB „Baltijos biotechnologijos“, A. Tumėno g. 4-38, LT-01109 Vilnius, LT

(74) Vaclovas KIŠKIS, 47, Adomaičiai, Lavoriškių p-tas, LT-15032 Vilniaus raj., LT

(54) Probiotiniai fermentuoti pašarų priedai

(57) 1. Pieno rūgšties bakterijų padermės *Pediococcus acidilactici* BaltBio01 MSCL P1480 kaip pradinio fermentacijos mikroorganizmo panaudojimas fermentuotuose pašarų prieduose, papilduose, premiksuose, pašarų žaliavose bei kombinuotuose pašaruose.

2. Pieno rūgšties bakterijų padermės *Pediococcus pentosaceus* BaltBio02 MSCL P1481 kaip pradinio fermentacijos mikroorganizmo panaudojimas fermentuotuose pašarų prieduose, papilduose, premiksuose, pašarų žaliavose bei kombinuotuose pašaruose.

3. Panaudojimas pagal 1 ir 2 punktus, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad fermentuotų pašarų priedų gamybai naudoja pieno rūgšties padermių *Pediococcus acidilactici* BaltBio01 MSCL P1480 ir *Pediococcus pentosaceus* BaltBio02 MSCL P1481 mišinius.

4. Pašarų priedas, papildas, premiksas, žaliava kurio sudėtyje yra *Pediococcus acidilactici* BaltBio01 MSCL P1480 ir/arba *Pediococcus pentosaceus* BaltBio02 MSCL P1481 pagal 1-3 punktus, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad grynos PRB gausinamos alternatyvioje terpėje kuri gaminama iš bulvių sulčių, jas autoklavuojant, atvėsinant iki 30 ºC produktą ir įvedant grynas pagausintas PRB kultūras (į 0,5 litro sulčių / 1 ml grynų grynųjų bakterijų kultūrų, pagausintų MRS buljone) ir išlaikant 32 °C temperatūroje nuo 24 h iki 72 h iki $9,60x10^{10}$ PRB KSV/ml.

---

(51) Int. Cl. (2016.01): **A23K 1/00**
C12N 1/00

(11) **6271**

(13) B

(21) 2014 110

(22) 2014-09-24

(41) 2016-04-11

(72) Elena BARTKIENĖ, LT
Gražina JUODEIKIENĖ, LT
Ramūnas GARBARAVIČIUS, LT

(73) UAB „Baltijos biotechnologijos“, A. Tumėno g. 4-38, LT-01109 Vilnius, LT

(74) Vaclovas KIŠKIS, 47, Adomaičiai, Lavoriškių p-tas, LT-15032 Vilniaus raj., LT

(54) Augalinės kilmės fermentuoti pašarai

(57) 1. Augalinės kilmės fermentuoti pašarai susidedantys pieno rūgšties bakterijų raugo ir substrato, b e s i s k i r i a n t y s tuo, kad raugo sudėtyje dominuoja padermės *Pediococcus acidilactici* BaltBio01 MSCL P1480 ar/ir *Pediococcus pentosaceus* BaltBio02 MSCL P1481, ir naudojamas substratas – augalinės kilmės produktai turintys angliavandenių – grūdiniai javai ir jų dalys, aliejingos sėklos, ankštiniai augalai, šienas, žolė.

2. Fermentuoti pašarai, pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t y s tuo, kad substratas yra mišinys susidedantis iš 5-20 % kviečių sėlenų ir 80-95 % miežių sėlenų.

3. Fermentuoti pašarai, pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t y s tuo, kad pieno rūgšties bakterijų raugo ir substrato santykis fermentacijos pradžioje turi būti 0,5-10 dalių su 90-99,5 dalių atitinkamai, geriausia 2:98.

4. Fermentuoti pašarai, pagal 1-3 punktus, b e s i s k i r i a n t y s tuo, kad substratas su pieno rūgšties bakterijų raugu fermentuojamas temperatūrų intervale 30-34 ºC iki pasiekiama pieno rūgšties bakterijų koncentracija 10^8-10^9 KSV/g.

5. Fermentuoti pašarai, pagal 1-4 punktus, b e s i s k i r i a n t y s tuo, kad substratas prieš fermentaciją ekstruduotas ir esant mažiau nei 50 % drėgmei fermentuotas 30 ºC arba mažesnėje temperatūroje.

6. Fermentuoti pašarai, pagal 1-5 punktus, b e s i s k i r i a n t y s tuo, kad po fermentacijos gautas fermentuotas produktas presavimo būdu granuliuotas ir išdžiovintas iki 8-10 % drėgnio.

7. Fermentuoti pašarai, pagal 1-6 punktus, b e s i s k i r i a n t y s tuo, kad jie skirti atrajojančių gyvulių šėrimui.

---

(51) Int. Cl. (2016.01): **B23D 35/00**

(11) **6266**

(13) B

(21) 2015 070

(22) 2015-08-05

(41) 2016-03-10

(72) Quntao Yu, CN

(73) Pujiang Jianfeng Environmental Science and Technology Co., Ltd, Floor 4 No. 5 Zones 1 Jiangnan Industrial Pujiang City, Zhejiang, CN

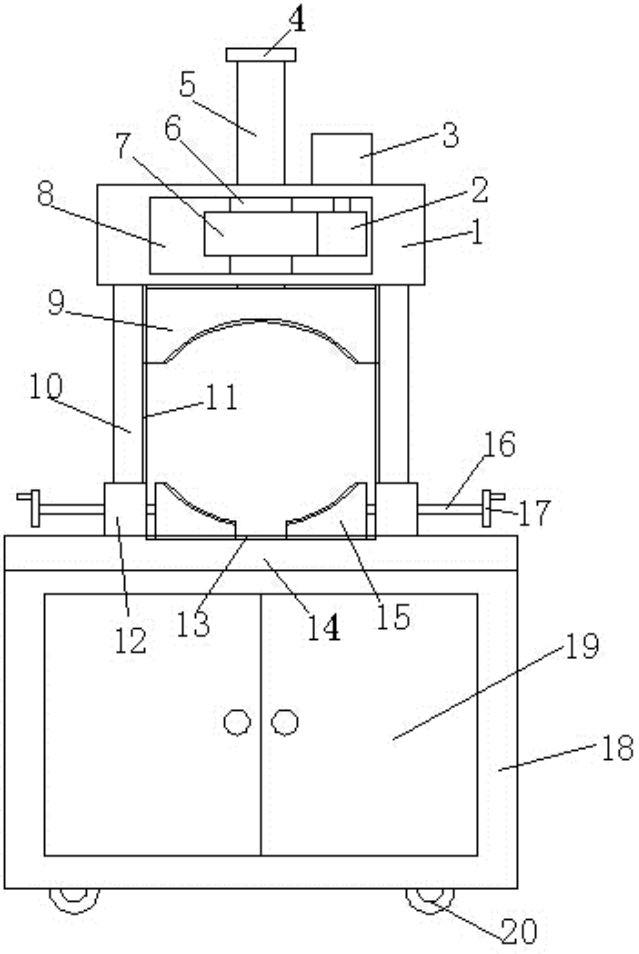
(74) Liucija JANICKAITĖ, 29, Inpatra UAB, Šeškinės g. 59-53, LT-07162 Vilnius, LT

(54) Apvalaus vamzdžio pjaustymo pagalbinis įrenginys su įrankių spintele

(57) 1. Apvalaus vamzdžio pjaustymo pagalbinis įrenginys su įrankių spintele, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jį sudaro viršutinė apkaba (1) ir apatinė apkaba (14), įrengta žemiau viršutinės apkabos (1); stovo kolona (10), sumontuota tarp viršutinės apkabos (1) ir apatinės apkabos (14); viršutinis lanko formos fiksavimo blokas (9), sumontuotas stovo kolonos (10) viduje; pirmasis kreipiamasis griovelis (11), sumontuotas išilgai stovo kolonos (10) lanko formos fiksavimo bloko (9) pusėje, be to, abi viršutinio lanko formos fiksavimo bloko (9) pusės įstatytos į pirmąjį kreipiamąjį griovelį (11); pagrindinis sriegiuotas strypas (5), sumontuotas viršutinio lanko formos fiksavimo bloko (9) viršuje, be to, pagrindinio sriegiuoto strypo (5) viršus tęsiasi per viršutinę apkabą (1); išgaubta kilpa (4), sumontuota prie krašto pagrindinio sriegiuoto strypo (5) pratęsimo dalies gale; ertmė (8), sumontuota viršutinės apkabos (1) viduryje; sriegiuota įvorė (6), sujungta su pagrindiniu sriegiuotu strypu (5) ir sumontuota pagrindinio sriegiuoto strypo (5) išorėje, ertmėje (8); pirmoji pavara (7), fiksuotai sujungta su sriegiuota įvore (6) ir sumontuota sriegiuotos įvorės (6) išorės viduryje; antroji pavara (2), sukabinta su pirmąja pavara (7) ir sumontuota pirmosios pavaros (7) dešinėje pusėje; pavaros variklis (3), įtaisytas virš antrosios pavaros (2), be to, pavaros variklis (3) sukamai sujungtas su antrąja pavara (2) ir fiksuotai sujungtas su viršutine apkaba (1); žemutinis lanko formos fiksavimo blokas (15), sumontuotas žemiau viršutinio lanko formos fiksavimo bloko (9); pagrindo atrama (12), sumontuota apatinio lanko formos fiksavimo bloko (15) išorėje, be to, pagrindo atramos (12) viršus nejudamai sujungtas su stovo kolona (10); pagalbinis sriegiuotas strypas (16), sumontuotas apatinio lanko formos fiksavimo bloko (15) galinio paviršiaus viduryje, iš šono, nukreipto į pagrindo atramą (12), be to, pagalbinis sriegiuotas strypas (16) eina per pagrindo atramą (12); paleidimo rankena (17), sumontuota pagalbinio sriegiuoto strypo (16) išorinio pratęsimo dalies gale; antrasis kreipiamasis griovelis (13), sumontuotas ant apatinės apkabos (14) paviršiaus tarp pagrindo atramų (12), be to, apatinio lanko formos fiksavimo bloko (15) apačia įstatyta į antrąjį kreipiamąjį griovelį (13); įrankių spintelė (18), sumontuota apatinės apkabos (14) apačioje; spintelės durys, (19) sumontuotos įrankių spintelės (18) priekiniame paviršiuje; kreipiamieji ratai (20), naudojami valdyti ir sumontuoti įrankių spintelės (18) apačioje.

2. Apvalaus vamzdžio pjaustymo pagalbinis įrenginys su įrankių spintele pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad slydimui atsparus sluoksnis sumontuotas lanko zonoje tarp viršutinio lanko formos fiksavimo bloko (9) ir apatinio lanko formos fiksavimo bloko (15).

3. Apvalaus vamzdžio pjaustymo pagalbinis įrenginys su įrankių spintele pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad apatiniai lanko formos fiksavimo blokai (15) yra du.



(51) Int. Cl. (2016.01): **B62M 13/00**
(11) **6268**
(13) B
(21) 2014 106
(22) 2014-09-16
(41) 2016-04-11
(72) Gediminas NEMANIS, LT
(73) UAB „ELINTA“, Terminalo g. 3, Biruliškių k., Karmėlavos sen., 54469 Kauno r., LT
(74) Vaclovas KIŠKIS, 47, Adomaičiai, Lavoriškių p-tas, LT-15032 Vilniaus raj., LT
(54) Elektrinė frikcinė dviračio pavara

(57) 1. Elektrinė frikcinė dviračio pavara, susidedanti iš korpuso (1), varančiojo mechanizmo (4), kuris susideda iš elektros variklio (14), kurio statorius (16) pritvirtintas prie vienos laikiklio sienelės (6a), o ant išorinio rotoriaus (16) sumontuoti cilindrinis gaubtas (17) ir įgaubtas vedantysis velenas (20) ir kurio gaubtas (17) sumontuotas didžiajam (18) ir mažajam (19) riedėjimo guoliuose įtvirtintuose laikiklio (6) sienelėse (6a) ir (6b), prispaudimo mazgo (3) ir tvirtinimo mazgo (2), kuris susideda iš laikiklio (5) ir prie jo šarnyriškai prijungtos jungiamosios dalies (23) su pavaros padėties fiksavimo mechanizmu (28), b e s i s k i r i a n t i tuo, kad:

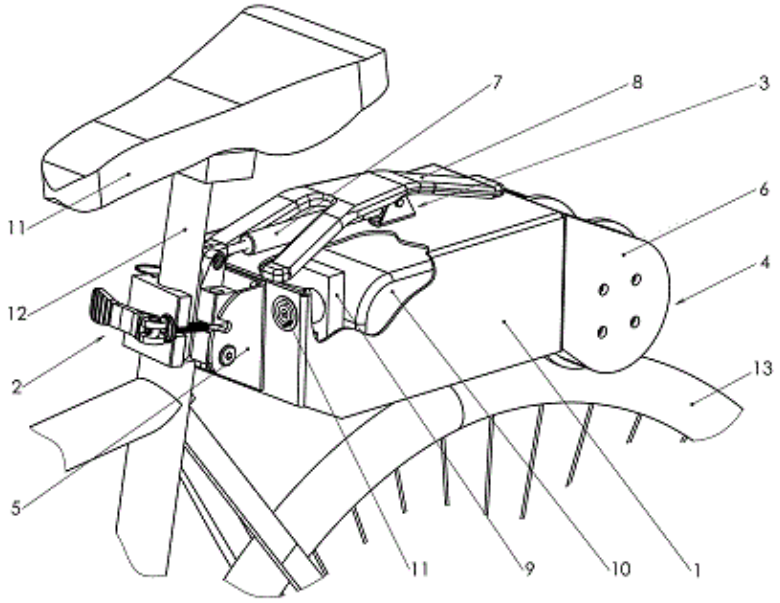
vedančiojo veleno (20) įgaubtos zonoje viduryje padarytas trapecinio profilio griovelis (20a);

jungiamoje tvirtinimo mazgo (2) dalyje (23) padarytos ribinės atramos, kurios riboja jos eigą apie savo ašį (27) atžvilgiu laikiklio (5);

pavaros padėties fiksavimo mechanizmas (28) susideda iš sumontuotas jungiamojoje dalyje tuščiavidurės įvorės (32) su įstrižu skersgaliu ir joje sumontuotų pasukamo kaiščio (33) su rankenėle (34) ir spyruoklės (35);

riedėjimo guoliai (18), (19) iš montažo pusės papildomai apsaugoti, didysis (18) – žiedine plokštele (21), o mažasis (19) – manžetu (22);

mažasis riedėjimo guolis (19) padarytas kintamo ašiškumo.



(51) Int. Cl. (2016.01): **G06Q 99/00**
(11) **6269**
(13) B
(21) 2015 086
(22) 2015-10-06
(41) 2016-04-11
(72) Jolanta DIDŽGALVIENĖ, LT
(73) UAB INOVATYVIŲ PROCESŲ SPRENDIMAI, Lauksargio g. 22, LT-10105 Vilnius, LT
(74) Edita IVANAUSKIENĖ, 61, Advokatės Editos Ivanauskienės kontora, Vokiečių g. 7-2, LT-01130 Vilnius, LT
(54) Asmenų identifikavimo ir alkoholio kiekio kraujyje matavimo būdas ir įrenginys

(57) 1. Asmenų kontrolės būdas apimantis asmens identifikavimą ir alkoholio kontrolę b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad apima sekančius veiksmus: lustinės asmens identifikavimo kortelės pagalba identifikuoja asmenį, asmeniui suteikiama galimybė pūsti į alkoholio matuoklį, pūtimo metu atlieka veido fotografavimą, atliekama veido atpažinimo funkcija, lustinės asmens identifikavimo kortelės, veido identifikavimo ir alkoholio matuoklio duomenys koriniais arba lokaliais belaidžiais telekomunikaciniais tinklais siunčiami į serverį, esant padidintam alkoholio kiekiui kontroliuojamo asmens kraujyje siunčiama žinutė administratoriui, duomenys serveryje saugomi (archyvuojami) ir gali būti perduodami kitoms tarnyboms.

2. Būdas pagal 1 punktą b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad asmenį identifikuoja pagal asmens identifikacinį kodą.

3. Būdas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad veido fotografavimą atlieka tuo metu, kai tik alkoholio matuoklyje pasikeičia oro slėgis (pūtimo pradžioje).

4. Būdas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad veido atpažinimo funkcija atliekama po ketvirto sėkmingai atpažinto veido vaizdo.

5. Būdas pagal 1 ir 4 punktus, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad veido atpažinimo funkcija atliekama lyginant su penkiolika paskutinių sėkmingai atpažintų veido vaizdų.

6. Kontrolės įrenginys, susidedantis iš įvesties terminalo (1), koriniais arba lokaliais belaidžiais telekomunikaciniais tinklais (4) sujungto su administratoriaus serveriu (2) ir administratoriaus prieigos sąsajos modulio(3), b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad įvesties terminalas (1) apima mobilaus telefono turinčio lietimo ekraną (5) vaizdo kamerą (6) garsiakalbį (7) ir procesorių (8) apimantį valdymo (8a), priėmimo (8b) ir vaizdo atpažinimo (8c), atminties

(8d) ir radijo ryšio (8e) modulius, o taip pat alkoholio matuoklį (10) ir lustinių asmens identifikavimo kortelių skaitytuvą (11) per nuoseklią sąsają (12) ir radijo ryšį (13) sujungtus su procesoriaus (8) radio ryšio moduliu (8e).

7. Kontrolės įrenginys pagal 6 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis turi kelis įvesties terminalus (1), kurie koriniais arba lokaliais belaidžiais telekomunikaciniais tinklais (4) sujungti su administratoriaus serveriu (2).

8. Kontrolės įrenginys pagal 6 ir 7 punktus, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad įvesties terminale (1): vaizdo kamera (7) sumontuota per nedidelį atstumą virš alkoholio matuoklio (10), iš abiejų vaizdo kameros (7) pusių yra sumontuoti šviestuvai (15a, 15b).

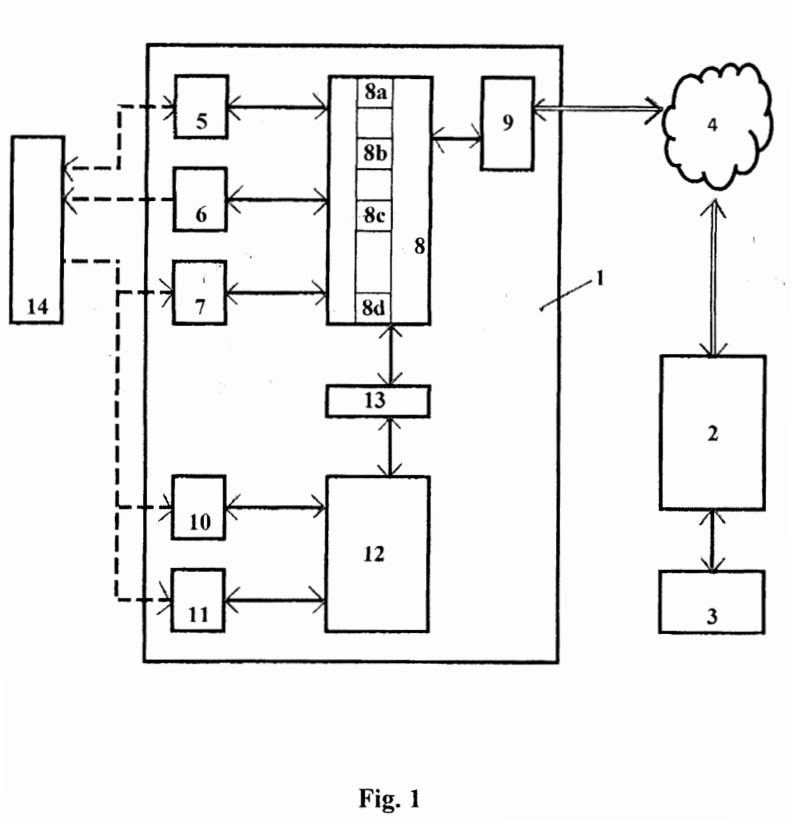


Fig. 1

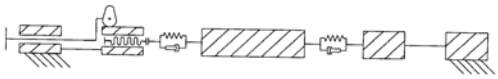
---

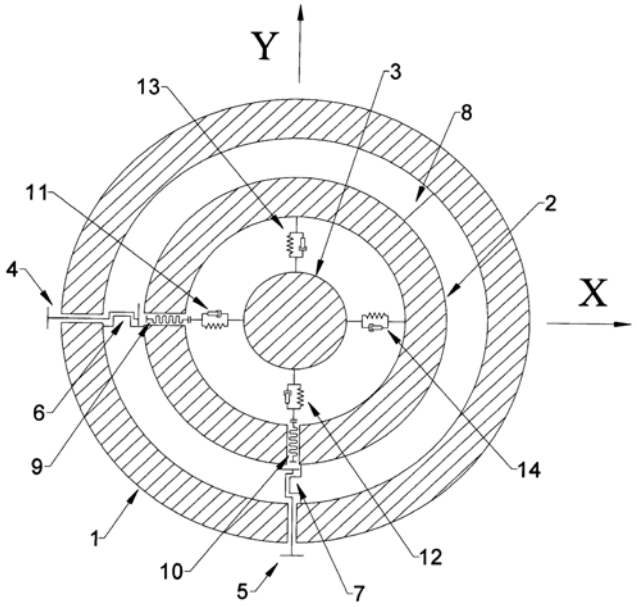
(51) Int. Cl. (2016.01): **H05B 41/00**
(11) **6267**
(13) B
(21) 2014 107
(22) 2014-09-23
(41) 2016-03-25
(72) Audrius ČEREŠKA, LT
Giedrius AUGUSTINAVIČIUS, LT
(73) VILNIAUS GEDIMINO TECHNIKOS UNIVERSITETAS, Saulėtekio al. 11, LT-10223 Vilnius, LT
(74) Vytautas EINORIS, 49, Gerbutavičiaus g. 1/42-155, LT-04318 Vilnius, LT
(54) Didelio tikslumo pozicionavimo sistema
(57) 1. Daugiamačio judesio generavimo-pozicionavimo sistema centravimo-niveliavimo įrenginiui, susiejanti tikslų postūmį vienos koordinačių ašies kryptimi su kitų krypčių tampria deformacija, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad centravimo-niveliavimo įrenginys susideda iš apatinės platformos-išorinio žiedo, ant kurio sumontuotas vidinis žiedas ir padėklas bei centravimo-niveliavimo padėties reguliavimo įtaisai, įmontuoti išoriniame žiede toje pačioje plokštumoje dvejose statmenose viena kitai ašyse, o vidinis ir išorinis žiedas bei padėklas sujungti tampriais lankstais taip, kad vidinis žiedas su išoriniu sujungtas trimis niveliavimo lankstais, iš kurių du išdėstyti minėtose ašyse, o trečiasis, atraminis, per tarp jų likusio centravimo kampo vidurį, o su padėklu vidinis žiedas sujungtas keturiais centravimo lankstais, tolygiai išdėstytais reguliavimo įtaisų išdėstymo ašyse kas 90^0, iš kurių du tiesiogiai

sąveikauja su centravimo-niveliavimo įtaisais, o kiti du yra atraminiai, be to, išorinis žiedas pritvirtintas ant aerostatinio suklio, bazuojant apatine plokštuma.

2. Sistema pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad centravimo-niveliavimo padėties reguliavimo įtaisas yra sukonstruotas kaip dvigubas suktukas, susidedantis iš niveliavimo padėties reguliavimo rankenėlės, susietos su kumšteliu, kontaktuojančiu su vidinio žiedo plokštuma, įtvirtintos išoriniame žiede ir centravimo padėties reguliavimo rankenėlės, patalpintos koncentriškai niveliavimo rankenėlės viduje ir susietos su sraigtine pora, sumontuota vidiniame žiede, per riedėjimo rutuliuką kontaktuojantį su centravimo lankstu.

3. Sistema pagal 1 ir 2 punktus, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad kaip visų daugiamačio judesio poslinkio stabilizatorius, ant dvigubo suktuko niveliavimo rankenėlės įmontuota spyruoklė.





Patentai, panaikinti pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 36 straipsnį

Patento nr.	Panaikinimo data
5856	2015-10-14
5859	2015-10-14
6066	2015-10-22
6174	2015-10-09

Patentai, kurių galiojimas pasibaigęs pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 36 straipsnį

Patento nr.	Galiojimo baigties data
4055	2016 03 19
4258	2016 03 21
4259	2016 03 21
4281	2016 03 15
4350	2016 03 22

Atitaisymai

(11) **6251**
(51) Int. Cl. (2016.01): **B65B 67/00 1**
(13) B
(54) Pakavimo įrenginys
Biuro atitaisymas
Paskelbta: Išradimai 2016 / 5 puslapis
(73) KROONIPUU OÖ, Jaska talu, Tõruvere küla , 60201 Alatskivi vald, Tartu maakond, EE
(15) Atitaisymas
(73) KROONIPUU OÜ, Jaska talu, Tõruvere küla, 60201 Alatskivi vald, Tartu maakond, EE
(48) 2016-04-20

VARDINĖ PAREIŠKĖJŲ, IŠRADĖJŲ IR PATENTŲ SAVININKŲ RODYKLĖ

(71) Pareiškėjas, valstybės kodas (72) Išradėjas, valstybės kodas (73) Patento savininkas, valstybės kodas	Žymėjimas P - pareiškėjas I - išradejas S - patento savininkas	(51) Klasifikacijos indeksas	(21) Paraiškos numeris (11) Patento numeris	(13) Dokumento rūšies kodas
ANDRIJAUSKAS Rolandas, LT	I	A61C 3/00 G06Q 10/00	2014 121	A
AUGUSTINAVIČIUS Giedrius, LT	I	H05B 41/00	6267	B
BANIUKAITIENĖ Odeta, LT	I	A61F 2/00	2014 117	A
BARTKIENĖ Elena, LT	I	A23K 1/00 C12N 1/00	6270	B
DIDŽGALVIENĖ Jolanta, LT	I	G06Q 99/00	6269	B
ELDES, UAB, LT	P	G08C 17/00	2014 122	A
GARBARAVIČIUS Ramūnas, LT	I	A23K 1/00 C12N 1/00	6270	B
GOLOCHVOŠČIŪTĖ-ANDRIJAUSKIENĖ Jūratė, LT	I	A61C 3/00 G06Q 10/00	2014 121	A
GRIBNIAK Viktor, LT	I	G01N 1/00 G01N 3/00	2015 058	A
GUSTAITIS Robertas, LT	I	A61C 3/00 G06Q 10/00	2014 121	A
Hitachi-GE Nuclear Energy, Ltd., JP	P	F01K 11/00 F22D 11/00 G21D 3/00	2015 091	A
JUODEIKIENĖ Gražina, LT	I	A23K 1/00 C12N 1/00	6270	B
KLAIPĖDOS UNIVERSITETAS, LT	P	A61B 5/00	2014 118	A
LIESIENĖ Jolanta, LT	I	A61F 2/00	2014 117	A
LIESIS Eugenijus, LT	I	A61F 2/00	2014 117	A
LUKOŠIUS Žydrūnas, LT	I	A61B 5/00	2014 118	A
MIKAMI Yamato, JP	I	F01K 11/00 F22D 11/00 G21D 3/00	2015 091	A

(71) Pareiškėjas, valstybės kodas (72) Išradėjas, valstybės kodas (73) Patento savininkas, valstybės kodas	Žymėjimas P - pareiškėjas I - išradejas S - patento savininkas	(51) Klasifikacijos indeksas	(21) Paraiškos numeris (11) Patento numeris	(13) Dokumento rūšies kodas
NAGASAWA Masayuki, JP	I	F01K 11/00 F22D 11/00 G21D 3/00	2015 091	A
NEMANIS Gediminas, LT	I	B62M 13/00	6268	B
PALAVENIENĖ Alisa, LT	I	A61F 2/00	2014 117	A
Pujiang Jianfeng Environmental Science and Technology Co., Ltd, CN	S	B23D 35/00	6266	B
RIMKUS Arvydas, LT	I	G01N 1/00 G01N 3/00	2015 058	A
STANKUS Albinas, LT	I	A61B 5/00	2014 118	A
TOMKEVIČIUS Eimantas, LT	I	B22F 7/00 B28B 1/00 B29C 67/00 B41J 2/00	2014 126	A
UAB „Baltijos biotechnologijos“, LT	S	A23K 1/00 C12N 1/00	6270	B
UAB „Biomė“, LT	P	A61F 2/00	2014 117	A
UAB „DTL Vilnius“, LT	P	A61C 3/00 G06Q 10/00	2014 121	A
UAB „ELINTA“, LT	S	B62M 13/00	6268	B
UAB „Phantom Group“, LT	P	B22F 7/00 B28B 1/00 B29C 67/00 B41J 2/00	2014 126	A
UAB INOVATYVIŲ PROCESŲ SPRENDIMAI, LT	S	G06Q 99/00	6269	B
VILNIAUS GEDIMINO TECHNIKOS UNIVERSITETAS, LT	P,S	G01N 1/00 G01N 3/00 H05B 41/00	2015 058	A
Yu Quntao, CN	I	B23D 35/00	6266	B
ČEREŠKA Audrius, LT	I	H05B 41/00	6267	B

SISTEMINĖ IŠRADIMŲ RODYKLĖ

(51) Klasifikacijos indeksas	(21) Paraiškos numeris (11) Patento numeris	(13) Dokumento rūšies kodas
A23K 1/00	6270	B
A23K 1/00	6271	B
A61B 5/00	2014 118	A
A61C 3/00	2014 121	A
A61F 2/00	2014 117	A
B22F 7/00	2014 126	A
B23D 35/00	6266	B
B28B 1/00	2014 126	A
B29C 67/00	2014 126	A
B41J 2/00	2014 126	A
B62M 13/00	6268	B
C12N 1/00	6270	B
C12N 1/00	6271	B
F01K 11/00	2015 091	A
F22D 11/00	2015 091	A
G01N 1/00	2015 058	A
G01N 3/00	2015 058	A
G06Q 10/00	2014 121	A
G06Q 99/00	6269	B
G08C 17/00	2014 122	A
G21D 3/00	2015 091	A
H05B 41/00	6267	B

NUMERINĖ IŠRADIMŲ RODYKLĖ

(21) Paraiškos numeris	(11) Patento numeris
2014 106	6268
2014 107	6267
2014 109	6270
2014 110	6271
2015 070	6266
2015 086	6269

NUMERINĖ IŠRADIMŲ PARAIŠKŲ RODYKLĖ

(21) Paraiškos numeris	(51) Klasifikacijos indeksas
2014 117	A61F 2/00
2014 118	A61B 5/00
2014 121	G06Q 10/00
2014 121	A61C 3/00
2014 122	G08C 17/00
2014 126	B29C 67/00
2014 126	B41J 2/00
2014 126	B22F 7/00
2014 126	B28B 1/00
2015 058	G01N 1/00
2015 058	G01N 3/00
2015 091	F01K 11/00
2015 091	F22D 11/00
2015 091	G21D 3/00

Europos patentai, paskelbti pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 71 straipsnį

(51) Int.Cl. ***A24B 15/00*** (2006.01)
A24B 15/28 (2006.01)
A24F 47/00 (2006.01)
(11) **1555898**
(13) T
(96) 03776589.8
(96) 2003-10-30
(97) 2005-07-27
(97) 2016-03-16
(86) PCT/US2003/034290
(86) 2003-10-30
(87) WO 2004/041007
(87) 2004-05-21
(30) 422497 P, 2002-10-31, US
(72) WOODSON, Beverley, C., US
NEWMAN, Deborah, J., US
(73) Philip Morris Products S.A., 2000 Neuchātel, CH
(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Elektriškai kaitinama cigaretė, turinti kontroliuojamo atpalaidavimo aromato suteikimą5
Apibrėžties punktai: 20, brėžiniai: 6.

(57) 1. Elektriškai kaitinama cigaretė (23) elektrinei rūkymo sistemai (21), apimanti bent vieną sorbentą; ir kvapniosios medžiagos išleidimo priedą, apimantį bent vieną išleidžiamą kvapniąją medžiagą elektriškai kaitinamoje cigaretėje (23) kvapniosios medžiagos išleidimo priedą kaitinant elektra iki bent minimalios temperatūros, kurioje kvapniosios medžiagos išleidimo priedas yra inkliuzijos kompleksas, kuris turi „šeimininko" molekulę ir kvapnioji medžiaga yra „svečio" molekulė inkliuzijos komplekse.

2. Elektriškai kaitinama cigaretė (23) pagal 1 punktą, kurioje sorbentas yra aktyvuota anglis.

3. Elektriškai kaitinama cigaretė (23) pagal 1 punktą, kurioje sorbentas yra ceolitas.

4. Elektriškai kaitinama cigaretė (23) pagal 1 punktą, kurioje kvapnioji medžiaga (23) yra (i) mentolas, arba (ii) vanilė ir gama oktalaktonas.

5. Elektriškai kaitinama cigaretė (23) pagal 1 punktą, kurioje kvapnioji medžiaga yra bent viena kvapnioji medžiaga pasirinkta iš grupės, susidedančios iš mentolo, mėtos, šokolado, saldymedžio, vaisių aromato, gama octalaktono, vanilės, etilo vanilino, kvėpavimo gaiviklio aromato, prieskonių aromato, metilo salikilato, linalolio, bergamočių aliejaus, pelargonijų aliejaus, citrinų aliejaus, imbiero aliejaus ir tabako aromato.

6. Elektriškai kaitinama cigaretė (23) pagal 1 punktą, kurioje „šeimininko" molekulė yra beta – ciklodekstrinas.

7. Elektriškai kaitinama cigaretė (23) pagal 1 punktą, kuri apima, remiantis viršutinės plėvelės (71) ir (arba) įkloto (66) mase, mažiau nei 15 % inkliuzijos komplekso masės.

8. Elektriškai kaitinama cigaretė (23) pagal 1 punktą, kurioje inkliuzijos kompleksas apima ne daugiau kaip apytikriai 20 % kvapniosios medžiagos.

9. Elektriškai kaitinama cigaretė (23) pagal 1 punktą, kurioje minimali temperatūra yra apie 60°C, ir inkliuzijos

kompleksas yra išdėstytas bent vienoje vietoje elektriškai kaitinamojoje cigaretėje, kuri pasiekia bent apytikriai 60°C cigaretės (23) rūkymo metu.

10. Elektriškai kaitinama cigaretė (23) pagal 1 punktą, kurioje kvapniosios medžiagos išleidimo priedas yra patalpintas ant vidinės plėvelės (84), apsupančios tabako kištuką (80), ant tabako turinčios plėvelės (66), ir (arba) viršutinės plėvelės (71), supančios įklotą (66).

11. Elektriškai kaitinama cigaretė (23) pagal 1 punktą, kurioje sorbentas yra plaušai.

12. Elektriškai kaitinama cigaretė (23) pagal 11 punktą, kurioje plaušai yra ištisiniai arba neištisiniai plaušai.

13. Elektriškai kaitinama cigaretė (23) pagal 11 punktą, kurioje plaušai yra impregnuoti bent vienu sorbentu.

14. Elektriškai kaitinamos cigaretės (23) pagal 1 punktą gamybos būdas, apimantis įtraukimą į elektriškai kaitinamą cigaretę (23) (a) bent vieno sorbento, ir (b) kvapniosios medžiagos atpalaidavimo priedo, apimančio bent vieną kvapniąją medžiagą, atpalaiduojamą elektriškai kaitinamoje cigaretėje (23) kvapniosios medžiagos atpalaidavimo priedą kaitinant elektra iki bent minimalios temperatūros, kuriame kvapniosios medžiagos atpalaidavimo priedas yra inkliuzijos kompleksas, kuris turi „šeimininko" molekulę ir kvapnioji medžiaga yra „svečio" molekulė inkliuzijos komplekse.

15. Elektriškai kaitinamos cigaretės (23) pagal 1 punktą rūkymo būdas, apimantis elektriškai kaitinamos cigaretės (23) dalies elektrinį kaitinimą tam, kad formuotųsi dūmai ir dūmai būtų traukiami per elektriškai kaitinamą cigaretę (23), sorbentas pašalina bent vieną pasirinktą dujų fazę, sudarytą iš dūmų srauto.

16. Elektrinė rūkymo sistema (21), apimanti:

žiebtuvėlį (25); ir

bent vieną elektriškai kaitinamą cigaretę (23), apimančią:

bent vieną sorbentą; ir

kvapniosios medžiagos išleidimo priedą, turintį bent vieną kvapniąją medžiagą, kuri yra išleidžiam elektriškai kaitinamoje cigaretėje (23) kvapniosios medžiagos išleidimo priedą kaitinant iki bent minimalios temperatūros, kurioje kvapniosios medžiagos išleidimo priedas yra inkliuzijos kompleksas, kuris turi „šeimininko" molekulę ir kvapnioji medžiaga yra „svečio" molekulė inkliuzijos komplekse.

17. Elektriškai kaitinama cigaretė (23), apimanti:

bent vieną sorbentą; ir

bent vieną kvapniosios medžiagos išleidimo priedą tokios formos, kuri pasirinkta iš grupės, susidedančios iš granulių, juostos ir inkliuzijos komplekso, kiekvienas kvapniosios medžiagos išleidimo priedas turi bent vieną kvapniąją medžiagą, išleistiną elektriškai kaitinamoje cigaretėje (23) kvapniosios medžiagos išleidimo priedą kaitinant elektra iki bent minimalios temperatūros, kurioje kvapniosios medžiagos išleidimo priedas yra inkliuzijos kompleksas, kuris turi „šeimininko" molekulę ir kvapnioji medžiaga yra „svečio" molekulė inkliuzijos komplekse.

18. Elektriškai kaitinama cigaretė (23) pagal 17 punktą, kurioje kvapniosios medžiagos išleidimo priedas apima bent du kvapniosios medžiagos išleidimo priedus inkliuzijos komplekso formos, kiekvienas kvapniosios medžiagos išleidimo priedas turi skirtingą minimalią temperatūrą, prie kurios kvapnioji medžiaga yra išleidžiama elektriškai kaitinamos cigaretės (23) rūkymo metu.

19. Elektriškai kaitinamos cigaretės (23) pagal 17 punktą gamybos būdas, apimantis įtraukimą į elektriškai kaitinamą cigaretę (23)(a) bent vieno sorbento, ir (b) bent vieno kvapniosios medžiagos išleidimo priedo inkliuzijos komplekso formos, kvapniosios medžiagos išleidimo priedas, apimantis bent vieną išleidžiamą kvapniąją medžiagą elektriškai kaitinamoje cigaretėje (23) kvapniosios medžiagos išleidimo priedą kaitinant elektra iki bent minimalios temperatūros.

20. Elektriškai kaitinamos cigaretės (23) pagal 17 punktą rūkymo būdas, apimantis kaitinamos cigaretės (23) dalies elektrinį kaitinimą tam, kad formuotųsi dūmai ir dūmai būtų traukiami per elektriškai kaitinamą cigaretę (23), sorbentas pašalina bent vieną pasirinktą dujų fazę, sudarytą iš dūmų srauto.

(51) Int.Cl. ***A61K 9/20*** (2006.01)
A61K 9/16 (2006.01)
A61K 9/48 (2006.01)
A61K 31/485 (2006.01)
A61K 9/22 (2006.01)

(11) **2281555**

(13) T

(96) 10178548.3

(96) 2002-05-02

(97) 2011-02-09

(97) 2016-03-23

(30) 288211 P, 2001-05-02, US

(72) Oshlack, Benjamin, US
Wright, Curtis, US
Prater, Derek Allan, GB

(73) EURO-CELTIQUE S.A., 1653 Luxembourg, LU

(74) Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

(54) Kartą per dieną vartojamos oksikodono formos

Apibrėžties punktai: 9, brėžiniai: 0.

(57) 1. Nepertraukiamo atpalaidavimo peroralinė vaisto forma, skirta vartoti kartą per dieną, apimanti:

(a) dvisluoksnę šerdį,

(i) apimančią nuo 5 iki 640 mg oksikodono arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską ir mažiausiai vieną polimero hidrogelį; ir

(ii) atpalaidavimo sluoksnį, apimantį osmopolimerą; ir

(b) pusiau pralaidžią sienelę, gaubiančią dvisluoksnę šerdį, turinčią joje esantį kanalą, skirtą minėto oksikodono arba jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos atpalaidavimui,

kur pusiau pralaidi sienelė apima narį, parinktą iš grupės, susidedančios iš celiuliozės esterio polimero, celiuliozės eterio polimero ir celiuliozės esterio-eterio polimero; ir

kur minėtas oksikodonas arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska yra vienintelis vaistas vaisto formoje.

2. Nepertraukiamo atpalaidavimo peroralinė vaisto forma pagal 1 punktą, kur minėtas pakeičiamas sluoksnis apima osmageną, geriau yra parinktas iš grupės, susidedančios iš osmosinių druskų ir osmosinių karbohidratų.

3. Nepertraukiamo atpalaidavimo peroralinė vaisto forma pagal 1 arba 2 punktą, kur minėta vaisto forma pateikia oksikodono arba jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos *in vitro* atpalaidavimo greitį, kuris išmatuotas USP aparate (pintinė), esant 100 apsisukimų per minutę 900 ml vandeniniame buferyje, esant pH tarp 1,6 ir 7,2 ties 37°C, nuo 0 % iki 40 % po 1 valandos, nuo 8 % iki 70 % po 4 valandų, nuo 20 % iki 80 % po 8 valandų, nuo 30 % iki 95 % po 12 valandų, nuo 35 % iki 95 % po 18 valandų ir daugiau negu 50 % po 24 valandų.

4. Nepertraukiamo atpalaidavimo peroralinė vaisto forma pagal 1 arba 2 punktą, kuri apima nuo 5 iki 500 mg oksikodono.

5. Nepertraukiamo atpalaidavimo peroralinė vaisto forma pagal 1 arba 2 punktą, kur minėta oksikodono farmaciniu požiūriu priimtina druska yra oksikodono hidrochloridas.

6. Nepertraukiamo atpalaidavimo peroralinė vaisto forma pagal 1 arba 2 punktą, skirta panaudoti skausmo gydymui, kur vaisto forma pateikia analgetinį poveikį mažiausiai 24 valandas.

7. Vaisto forma pagal bet kurį iš 1 arba 2 punktų tabletės formos.

8. Vaisto forma pagal 1 arba 2 punktą, kur osmopolimeras apima narį, parinktą iš grupės, susidedančios iš polialkileno oksido ir karboksialkilceliuliozės.

9. Vaisto forma pagal 2 punktą, kur osmagenas yra parinktas iš grupės, susidedančios iš natrio chlorido, kalio chlorido, magnio sulfato, ličio fosfato, ličio chlorido, natrio fosfato, kalio sulfato, natrio sulfato, kalio fosfato, gliukozės, fruktozės ir maltozės.

(51) Int.Cl. ***B60L 11/18*** (2006.01)
(11) **1646526**
(13) T
(96) 04739069.5
(96) 2004-03-25
(97) 2006-04-19
(97) 2016-02-24
(86) PCT/EP2004/003151
(86) 2004-03-25
(87) WO 2005/009779
(87) 2005-02-03
(30) 10331084, 2003-07-09, DE
(72) NESKELBIAMA
(73) Wobben Properties GmbH, 26607 Aurich, DE
(74) Virgina Adolfina DRAUGELIENĖ, 8, UAB TARPINĖ, A.P.Kavoliuko g. 24-152, LT-04328 Vilnius, LT
(54) Variklinė transporto priemonė
Apibrėžties punktai: 8, brėžiniai: 4.

(57) 1. Variklinė transporto priemonė, turinti bent vieną elektros variklį, energijos akumuliatorių, skirtą paleidimo energijai tiekti į elektros variklį, turintį kištukinio tipo jungtį, kuri yra prijungta prie energijos akumuliatoriaus, skirto srovės šaltiniui prijungti ir turinti valdymo sistemą, skirtą elektros srovei iš srovės šaltinio į energijos akumliatorių valdyti, kur

valdymo sistema (10) leidžia elektros srovei tekėti iš energijos akumuliatoriaus (20) į srovės šaltinį (tinklą) (30), o automobilyje arba jo išorėje yra numatytas inverteris, kurio pagalba energijos akumuliatoriaus elektros galingumas gali būti tiekiamas kaip alternatyvi srovė į srovės šaltinį (tinklą),

b e s i s k i r i a n t i tuo, kad automobilyje yra numatytas registravimo įtaisas, kuris užregistruoja kada koks elektros energijos kiekis yra įkrautas į transporto priemonės energijos akumuliatorių ir kada koks elektros energijos kiekis yra patiektas iš transporto priemonės energijos akumuliatoriaus į srovės šaltinį (tinklą).

2. Variklinė transporto priemonė pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i duomenų komunikacijos įrenginiu, skirtu duomenims tarp valdymo sistemos (10) ir tinklo (30) perduoti.

3. Variklinė transporto priemonė pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad valdymo sistema apima laikrodį arba yra prijungta prie laikrodžio.

4. Transporto priemonė pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad valdymo sistemos pagalba akumuliatorius yra įkraunamas valdoma elektros energija, kai yra prijungtas prie maitinimo tinklo.

5. Transporto priemonė pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad su valdymo sistema yra susieta su energijos valdymo programa, kuri, kai transporto priemonė yra prijungta prie elektros maitinimo tinklo, iššaukia akumuliatoriaus automatinį įkrovimo arba iškrovimo veiksmą.

6. Transporto priemonė pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad transporto priemonė yra aprūpinta elektros skaitikliu/energijos elementu, kuris matuoja elektros energiją, gautą energijos akumuliatoriuje, kuri yra tiekiama į maitinimo tinklą.

7. Transporto priemonė pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad transporto priemonė turi elektros kištukinę jungtį, kuri gali būti prijungta prie maitinimo tinklo atitinkamos kištukinės jungties, kur kištukinė jungtis turi įžeminimo liniją, kurios pagalba transporto priemonės duomenys gali pasikeisti per elektros maitinimo tinklo kompanijos duomenų tinklą ir toliau papildomi duomenys gali būti tiekiami per duomenų tinklą, pavyzdžiui, duomenys, susieti su transporto priemonės elektros akumuliatoriaus statusu.

8. Transporto priemonė pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad transporto priemonės išorėje yra sukonstruotas inverteris, kurio pagalba transporto priemonės energijos akumuliatoriaus srovė yra numatyta tiekti į srovės šaltinį (tinklą).

(51) Int.Cl. ***C12N 15/11*** (2006.01)
A61K 48/00 (2006.01)
A61K 31/7088 (2006.01)
(11) **2602322**
(13) T
(96) 12198517.0
(96) 2001-09-21
(97) 2013-06-12
(97) 2016-03-02
(30) 00203283, 2000-09-21, EP
(72) van Ommen, Garrit-Jan Boudewijn, NL
van Deutekom, Judith Christina Theodora, NL
Den Dunnen, Johannes Theodorus, NL
(73) Academisch Ziekenhuis Leiden, 2333 ZA Leiden, NL
(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
(54) Egzono praleidimo sužadinimas eukariotinėse ląstelėse
Apibrėžties punktai: 12, brėžiniai: 0.

(57) 1. Priešprasminis oligonukleotidas, nukreiptas prieš žmogaus distrofino pre-mRNR 53 egzono vidų, kuris pagerina minėto egzono maskavimą splaisingo aparate ir minėto egzono išskyrimą iš galutinės mRNR.

2. Priešprasminis oligonukleotidas pagal 1 punktą, kur oligonukleotidas gali prisirišti prie 53 egzono arba jo dalies.

3. Priešprasminis oligonukleotidas pagal 1 arba 2 punktą, kur minėtas priešprasminis oligonukleotidas gali specifiškai sąveikauti su egzono atpažinimo seka 53 egzone.

4. Priešprasminis oligonukleotidas pagal 2 arba 3 punktą, kur prisirišimas prie 53 egzono vidaus yra nustatomas judrumo poslinkio gelyje analize arba nustatant ar minėto egzono nėra minėtoje mRNR.

5. Priešprasminis oligonukleotidas pagal bet kurį iš 1-4 punktų, kur oligonukleotidas sužadina specifinį minėto 53 egzono praleidimą distrofino pre-mRNR, kur minėtas priešprasminis oligonukleotidas yra ląstelėje, turinčioje distrofino pre-mRNR, turinčioje minėtą egzoną.

6. Priešprasminis oligonukleotidas pagal 5 punktą, kur oligonukleotidas sužadina distrofino baltymo, apimančio mažiausiai Bekerio mutanto funkcionalumą, gamybą, kur minėtas priešprasminis oligonukleotidas yra ląstelėje, turinčioje distrofino pre-mRNR, kuri turi 53 egzoną.

7. Priešprasminis oligonukleotidas pagal bet kurį iš 1-6 punktų, kur oligonukleotidas turi 14-40 nukleotidų ilgį.

8. Priešprasminis oligonukleotidas pagal bet kurį iš 1-7 punktų, kur oligonukleotidas yra 2’-O-metilo oligoribonukleotidas arba peptido nukleorūgštis.

9. Priešprasminis oligonukleotidas pagal 8 punktą, kur 2’-O-metilo oligoribonukleotidas yra 2’-O-metilo fosforotiato oligoribonukleotidas.

10. Nukleorūgšties pristatymo nešiklis, galintis ekspresuoti priešprasminį oligonukleotidą pagal bet kurį iš 1-7 punktų, geriau kur minėtas nukleorūgšties pristatymo nešiklis apima vienos vijos virusą arba su adenovirusu susijusį virusą.

11. Priešprasminio oligonukleotido pagal bet kurį iš 1-9 punktų arba nukleorūgšties pristatymo nešiklio pagal 10 punktą panaudojimas gamybai vaisto, skirto paciento Diušeno raumenų distrofijos gydymui.

12. Panaudojimas pagal 11 punktą, kur gydomas pacientas turi mažiausiai tam tikrus distrofino pozityvius pluoštus.

Europos patentai, paskelbti pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 79 straipsnį

(51) Int.Cl. ***A01N 43/62*** (2006.01)
A61K 48/00 (2006.01)
A61K 38/47 (2006.01)
A61K 38/48 (2006.01)
(11) **2154969**
(96) 08755799.7
(96) 2008-05-16
(97) 2010-02-24
(97) 2015-11-18
(86) PCT/US2008/064017
(86) 2008-05-16
(87) WO 2008/144591
(87) 2008-11-27
(30) 930462 P, 2007-05-16, US
929554 P, 2007-07-03, US
(72) SCHLOSSMACHER, Michael, CA
CULLEN, Valerie, US
SHIHABUDDIN, Lamya, US
CHENG, Seng, H., US
(73) The Brigham and Women`s Hospital, Inc., Boston, MA 02115, US
(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
(54) Sinukleinopatijų gydymas
Apibrėžties punktai: 13, brėžiniai: 0.
(57) 1. Vieno arba abiejų iš:
rūgšties-beta-gliukocerebrozidazės (GBA) polipeptido ir
polinukleotido, koduojančio rūgšties-beta- gliukocerebrozidazės (GBA) polipeptidą, panaudojimas gamybai vaisto, skirto gydymo būdui subjekto, sergančio sinukleinopatija, bet ne kliniškai diagnozuota lizosomų kaupimosi liga, kur polipeptidas arba polinukleotidas yra skiriami veiksmingo kiekio, siekiant sumažinti α-sinukleino lygį subjekto centrinėje arba periferinėje nervų sistemoje arba abejose, arba subjekto lizosomų srityje.

2. Panaudojimas pagal 1 punktą, kur sinukleinopatija yra pirminė sinukleinopatija.

3. Panaudojimas pagal 2 punktą, kur sinukleinopatija apima bet kurį vieną arba daugiau iš:
Parkinsono ligos (PD); sporadinės arba paveldimos demencijos su Lewy kūneliais (DLB); grynojo autonominio nepakankamumo (PAF) su α-sinukleino nusėdimu; išsėtinės sisteminės atrofijos (MSA); paveldimos neurodegeneracijos su smegenų geležies sankaupa; ir senyvo amžiaus epizodinės Lewy kūnelių ligos.

4. Panaudojimas pagal 1 punktą, kur sinukleinopatija yra antrinė sinukleinopatija.

5. Panaudojimas pagal 4 punktą, kur sinukleinopatija apima bet kurį vieną arba daugiau iš:
Lewy kūnelių varianto Alzheimerio ligos; Downo sindromo; progresinio supranuklearinio paralyžiaus; esminio tremoro su Lewy kūneliais; šeiminio parkinsonizmo su arba be demencijos; tau geno ir progranulino geną jungiančios demencijos su arba be parkinsonizmo; Creutzfeldt-Jakob ligos; galvijų spongiforminės encefalopatijos; antrinės Parkinsono ligos; parkinsonizmo, išsivysčiusio iš neurotoksino poveikio; vaistų sukelto parkinsonizmo su α-sinukleino nusėdimu; sporadinės arba paveldimos spinocerebralinės ataksijos; amiotrofinės lateralinės sklerozės (ALS); ir idiopatinio dažno akių judėjimo miego metu sutrikimo.

6. Panaudojimas pagal 1 punktą, papildomai apimantis vieno arba daugiau agentų, kurie padidina α-sinukleino kompleksų autofagiją, arba polipeptido, kuris padidina α-sinukleino kompleksų degradacinį procesą lizosomose, skyrimą.

7. Panaudojimas pagal 6 punktą, kur agentas apima mTOR inhibitorių.

8. Panaudojimas pagal 6 punktą, kur agentas apima rapamiciną arba rapamicino analogą.

9. Panaudojimas pagal 6 punktą, kur agentas vieną arba daugiau iš everolimo, ciklosporino, FK506, hsc70, N-oktil-4-epi-β-valienamino ir glicerolio.

10. Panaudojimas pagal 6 punktą, kur agentas apima mažą molekulę, didelę molekulę, peptidą, antikūną, nukleorūgštį arba jo biologiniu požiūriu aktyvų fragmentą.

11. Vienas arba abu iš:
rūgšties-beta-gliukocerebrozidazės (GBA) polipeptido ir
polinukleotido, koduojančio rūgšties-beta-gliukocerebrozidazės (GBA) polipeptidą,
skirti panaudoti sinukleinopatijos, kur nėra kliniškai diagnozuota lizosomų kaupimosi liga, gydymo būdui.

12. Vienas arba abu iš:
rūgšties-beta-gliukocerebrozidazės (GBA) polipeptido ir
polinukleotido, koduojančio rūgšties-beta-gliukocerebrozidazės (GBA) polipeptidą, panaudojimas gamybai vaisto, skirto subjekto, turinčio bet kurį vieną arba daugiau iš: Parkinsono ligos (PD); sporadinės arba paveldimos demencijos su Lewy kūneliais (DLB); grynojo autonominio nepakankamumo (PAF) su α-sinukleino nusėdimu; išsėtinės sisteminės atrofijos (MSA); paveldimos neurodegeneracijos su smegenų geležies sankaupa; senyvo amžiaus epizodinės Lewy kūnelių ligos; Lewy kūnelių varianto Alzheimerio ligos; Downo sindromo; progresinio supranuklearinio paralyžiaus; esminio tremoro su Lewy kūneliais; šeiminio parkinsonizmo su arba be demencijos; tau geno ir progranulino geną jungiančios demencijos su arba be parkinsonizmo; Creutzfeldt-Jakob ligos; galvijų spongiforminės encefalopatijos; antrinės Parkinsono ligos; parkinsonizmo, išsivysčiusio iš neurotoksino poveikio; vaistų sukelto parkinsonizmo su α-sinukleino nusėdimu; sporadinės arba paveldimos spinocerebralinės ataksijos; amiotrofinės lateralinės sklerozės (ALS); ir idiopatinio dažno akių judėjimo miego metu sutrikimo, kur polipeptidas arba polinukleotidas yra skiriami veiksmingo kiekio, siekiant sumažinti α-sinukleino lygį subjekto centrinėje arba periferinėje nervų sistemoje arba abu, arba subjekto lizosomų srityje, gydymo būdui.

13. Vienas arba abu iš:
rūgšties-beta-gliukocerebrozidazės (GBA) polipeptido ir
polinukleotido, koduojančio rūgšties-beta-gliukocerebrozidazės (GBA) polipeptidą, skirti panaudoti Parkinsono ligos (PD); sporadinės arba paveldimos demencijos su Lewy kūneliais (DLB); grynojo autonominio nepakankamumo (PAF) su α-sinukleino nusėdimu; išsėtinės sisteminės atrofijos (MSA); paveldimos neurodegeneracijos su smegenų geležies sankaupa; senyvo amžiaus epizodinės Lewy kūnelių ligos; Lewy kūnelių varianto Alzheimerio ligos; Downo sindromo; progresinio supranuklearinio paralyžiaus; esminio tremoro su Lewy kūneliais; šeiminio parkinsonizmo su arba be demencijos; tau geno ir progranulino geną jungiančios demencijos su arba be parkinsonizmo; Creutzfeldt-Jakob ligos; galvijų spongiforminės encefalopatijos; antrinės Parkinsono ligos; parkinsonizmo, išsivysčiusio iš neurotoksino poveikio; vaistų sukelto parkinsonizmo su α-sinukleino nusėdimu; sporadinės arba paveldimos spinocerebralinės ataksijos; amiotrofinės lateralinės sklerozės (ALS); ir idiopatinio dažno akių judėjimo miego metu sutrikimo gydymo būdui.

---

(51) Int.Cl. ***A21D 13/00*** (2006.01)
(11) **2826375**
(96) 13425103.2
(96) 2013-07-19
(97) 2015-01-21
(97) 2015-12-02
(72) Maucotel, Thierry, FR
Maloberti, Paolo, IT
Christofidis, Nicholas, IT
Buttini, Roberto, IT
(73) Barilla France S.A.S., 92100 Boulogne-Billancourt, FR
(74) Liucija JANICKAITĖ, 29, Inpatra UAB, Šeškinės g. 59-53, LT-07162 Vilnius, LT

(54) Sumuštinių duonos be plutos gamybos būdas
Apibrėžties punktai: 7, brėžiniai: 1.

(57) 1. Sumuštinių duonos be plutos gamybos būdas, apimantis šiuos etapus:
- sumuštinių duonos tešlos paruošimą;
- minėtos tešlos pusgaminių formavimą ir jų talpinimą į formas;
- minėtų pusgaminių kepimą krosnyje, atitinkamų sumuštinių duonos kepalų gavimą;
- sumuštinių duonos kepalų aušinimą ir plutos iš visų jo pusių pašalinimą;
b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kepimo krosnyje etapas vykdomas krosnyje nuo 50 iki 70 minučių, esant 145-175 °C temperatūrai.

2. Būdas pagal 1 punktą, kur minėtoje krosnyje kepama, naudojant šilumos perdavimą į maistą laidumo ir (arba) šilumos spinduliuotės, ir (arba) konvekcijos priemonėmis.

3. Būdas pagal 2 punktą, kur kepama, naudojant šilumos perdavimą į maistą laidumo, šilumos spinduliuotės ir konvekcijos priemonėmis.

4. Būdas pagal bet kurį iš 1-3 punktų, kur minėta krosnis yra tunelinė krosnis.

5. Būdas pagal bet kurį iš 1- 4 punktų, kur minėtas kepimo krosnyje etapas vykdomas, esant 155-165°C temperatūrai.

6. Būdas pagal bet kurį iš 1-5 punktų, kur kepimo trukmė svyruoja nuo 55 iki 65 minučių.

7. Būdas pagal bet kurį iš 1-4 punktų, kur minėtas kepimo krosnyje etapas vykdomas 60 minučių, esant maždaug 160 °C temperatūrai.

---

(51) Int.Cl. ***A24D 3/04*** (2006.01)
A24F 47/00 (2006.01)
(11) **2814341**
(96) 12818526.1
(96) 2012-12-28
(97) 2014-12-24
(97) 2016-03-09
(86) PCT/EP2012/077087
(86) 2012-12-28
(87) WO 2013/120566
(87) 2013-08-22
(30) 12155250, 2012-02-13, EP
(72) JARRIAULT, Marine, CH
LOUVET, Alexis, CH
MEYER, Cédric, CH
SANNA, Daniele, IT
ZUBER, Gérard, CH
(73) Philip Morris Products S.A., 2000 Neuchātel, CH
(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

(54) Aerozolį generuojantis gaminys, turintis biologiškai skaidų aromatą generuojantį komponentą
Apibrėžties punktai: 10, brėžiniai: 5.

(57) 1. Aerozolį generuojantis gaminys (10), susidedantis iš daugelio strypo formos surinktų elementų (11), dauguma iš elementų turi aerozolį formuojantį substratą (20) ir kandiklio filtrą (50), patalpintą žemyn pasroviui nuo aerozolį formuojančio substrato (20) viduje strypelio (11), kuriame aerozolį generuojantis gaminys (10) apima lakų aromatą generuojantį komponentą, patalpintą tarp aerozolį formuojančio substrato (20) ir kandiklio filtro (50) strypo viduje (11), lakus aromatą generuojantis komponentas yra sujungtas su pluoštiniu atraminiu elementu (45), ir kur mažo pasipriešinimo atraminis elementas (40) yra patalpintas kandikliu prieš srovę ir žemyn pasroviui aerozolį formuojančiam substratui (20), mažo pasipriešinimo atraminis elementas (40) apima išilgai nutįsusį kanalą,

talpinantį lakų aromatą generuojantį komponentą strypo (11) viduje, kur mažo pasipriešinimo atraminis elementas (40) apima daugelį išilgai nusitęsusių kanalų, apibrėžtų lakštine medžiaga ir yra suformuotas panaudojant vieną arba daugiau procesų, pasirinktų iš sąrašo, apimančio lakštinės medžiagos susukimą, klostavimą, surinkimą ir lankstymą tam, kad formuotų kanalus, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad aerozolį generuojantis gaminys turi 45 mm bendrą ilgį ir 7 mm išorinį diametrą, aerozolį formuojantis substratas turi 10 mm ilgį.

2. Gaminys (10) pagal 1 punktą, kuriame lakštinė medžiaga yra medžiaga, pasirinkta iš sąrašo, turinčio polietileną, polipropileną polivinilchloridą, polietileno tereftalatą, polipieno rūgštį, celiuliozės acetatą, krakmolą kopoliesterio pagrindu, popierių ir aliuminio foliją.

3. Gaminys (10) pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame žemo pasipriešinimo atraminis elementas turi poringumą tarp 50 % ir 90 % išilgine kryptimi.

4. Gaminys (10) pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame žemo pasipriešinimo atraminis elementas turi bendrą paviršiaus plotą tarp 300 mm^2 vienam mm ilgio ir 1000 mm^2 vienam mm ilgio.

5. Gaminys (10) pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame žemo pasipriešinimo atraminis elementas turi bendrą ilgį tarp 7 mm ilgio ir 28 mm ilgio.

6. Gaminys (10) pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame žemo pasipriešinimo atraminis elementas turi bendrą ilgį apytikriai 18 mm.

7. Gaminys (10) pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame lakštinė medžiaga turi storį tarp 10 mikrometrų ir 250 mikrometrų.

8. Gaminys (10) pagal bet kurį ankstesnį punktą, dar turintis atskyrimo elementą (30), patalpintą kryptimi aukštyn lakiam aromatą generuojančiam komponentui ir kryptimi žemyn aerozolį formuojančio substrato atžvilgiu (20).

9. Gaminys (10) pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame lakus aromatą generuojantis komponentas turi mentolio.

10. Gaminys (10) pagal bet kurį ankstesnį punktą, apimantis daugiau kaip 1,5 mg mentolio, patalpinto tarp kandiklio filtro (50) ir aerozolį formuojančio substrato (20).

---

(51) Int.Cl. ***A24D 3/04*** (2006.01)
A61Q 13/00 (2006.01)
(11) **2775869**
(96) 12795356.0
(96) 2012-11-06
(97) 2014-09-17
(97) 2016-04-13
(86) PCT/EP2012/071910
(86) 2012-11-06
(87) WO 2013/068337
(87) 2013-05-16
(30) 11250887, 2011-11-07, EP
(72) TRITZ, Dorothy, CH
KUERSTEINER, Charles, CH
JORDIL, Yves, FR
CHECCHETTO, Andrea, CH
(73) Philip Morris Products S.A., 2000 Neuchātel, CH
(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Rūkymo gaminys, turintis mentolio
Apibrėžties punktai: 16, brėžiniai: 2.

(57) 1. Rūkymo gaminys, turintis aromatą išskiriantį segmentą, aromatą išskiriantis segmentas, apimantis:

pluoštinės medžiagos kaištį, apibrėžtą iš esmės orui nepralaidžiu įvyniokliu; ir

daugybę iš kietų mentolio dalelių, paskirstytų pluoštinės medžiagos kaiščio viduje, kuriame pluoštinė medžiaga apima atsitiktinai orientuotus pluoštus.

2. Rūkymo gaminys pagal 1 punktą, kuriame pluoštinės medžiagos kaištis yra apibrėžtas iš esmės orui nepralaidžiu permatomu įvyniokliu.

3. Rūkymo gaminys pagal 1 arba 2 punktą, kuriame pluoštinės medžiagos kaištis yra apibrėžtas iš esmės orui nepralaidžiu įvyniokliu, turinčiu deguonies dujų perdavimo greitį (O_2GTR), mažesnį už apytikriai apie 5 cm^3 (STP)/ m2.24 valandas prie slėgio diferencinio 1 atmosferai kaip matuojama pagal ASTM F1297-07 prie 23°C ir 0 % santykinei drėgmei (RH).

4. Rūkymo gaminys pagal 1 punktą, kuriame pluoštinės medžiagos kaištis yra apibrėžtas iš esmės orui nepralaidžiu popieriniu įvyniokliu, turinčiu pralaidumą, mažesnį, nei 20 koresta vienetų matuojant pagal ISO 2965:2009.

5. Rūkymo gaminys pagal bet kurį vieną 1 – 4 punktą, kuriame pluoštinės medžiagos kaištis yra filtruojančios pluoštinės medžiagos kaištis.

6. Rūkymo gaminys pagal 5 punktą, kuriame pluoštinė filtruojanti medžiaga yra iš esmės neturinti plastifikatorių.

7. Rūkymo gaminys pagal bet kurį vieną 1 – 6 punktą, kuriame kietų mentolio dalelių vidurkis tarp apytikriai 0,1 miligramo ir apytikriai 1 mg yra padalintas pluoštinės medžiagos kaiščio viduje jo ilgio milimetrui.

8. Rūkymo gaminys pagal bet kurį vieną 1 – 7 punktą, kuriame daugumos kietųjų mentolio dalelių vidutinis dalelės dydis yra tarp apytikriai 50 mikrometrų ir apytikriai 900 mikrometrų.

9. Rūkymo gaminys pagal bet kurį vieną 1 – 8 punktą, apimantis kandiklį, kuriame kandiklis turi aromatą išskiriantį segmentą.

10. Rūkymo gaminys pagal 9 punktą, dar apimantis rūkomos medžiagos įvynioklio strypelį, pritvirtintą prie kandiklio per antgalio popierių (6).

11. Rūkymo gaminys pagal 10 punktą, kuriame aromatą išskiriantis segmentas šliejasi prie rūkomosios medžiagos įvynioto strypelio.

12. Rūkymo gaminys pagal 10 arba 11 punktą, kuriame mentolio kiekis, išleistas iš aromatą išskiriančio segmento, kai rūkymo gaminys yra rūkomas pagal ISO 15592-3:2008, yra tarp apytikriai 1 % ir apytikriai 15 % daugybės kietųjų mentolio dalelių masės, paskirstytos pluoštinės medžiagos kaiščio viduje.

13. Rūkymo gaminys pagal bet kurį vieną 10 – 12 punktą, suteikiantis bendrą mentolio tiekimą tarp apytikriai 0,1 mg ir apytikriai 3 mg, kai rūkoma pagal ISO 15592-3:2008.

14. Rūkymo gaminys pagal 9 punktą, dar apimantis aerozolį generuojantį substratą kandikliu aukštyn.

15. Rūkymo gaminys pagal bet kurį vieną 9 – 14 punktą, kuriame kandiklis dar apima burnos galinį segmentą aromatą skleidžiančiam segmentui kryptimi žemyn.

16. Kandiklis rūkymo gaminiui, apimantis aromatą išskiriantį segmentą, aromatą išskiriantis segmentas apimantis:

pluoštinės medžiagos kaištį, apibrėžtą iš esmės orui nepralaidžiu įvyniokliu; ir

daugybę iš kietų mentolio dalelių, paskirstytų pluoštinės medžiagos kaiščio viduje, kuriame pluoštinė medžiaga apima atsitiktinai orientuotus pluoštus.

(51) Int.Cl. ***A24F 47/00*** (2006.01)
(11) **2814343**
(96) 13708105.5
(96) 2013-02-12
(97) 2014-12-24
(97) 2016-04-13
(86) PCT/EP2013/052786
(86) 2013-02-12
(87) WO 2013/120849
(87) 2013-08-22
(30) 12155234, 2012-02-13, EP
(72) ROUDIER, Stephane, CH
SAMULEWICZ, Aleksandra, HU
LAVANCHY, Frederic, CH
(73) Philip Morris Products S.A., 2000 Neuchātel, CH
(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Rūkymo gaminys, apimantis dvigubus šilumai laidžius elementus
Apibrėžties punktai: 17, brėžiniai: 3.

(57) 1. Rūkymo gaminys (2, 54, 60), apimantis:

šilumos šaltinį (4, 40);

aerozolį formuojantį substratą (6) šilumos šaltiniui kryptimi žemyn; ir

pirmąjį šilumai laidų elementą (22) aplink ir kontaktuojantį su šilumos šaltinio užpakaline dalimi (4b) ir aerozolį formuojančio substrato gretima priekine dalimi (6a),

b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad rūkymo gaminys dar apima antrąjį šilumai laidų elementą (30, 30') aplink bent pirmojo šilumai laidaus elemento dalį, kuriame bent dalis antrojo šilumai laidaus elemento yra radialiniu būdu atskirta nuo pirmojo šilumai laidaus elemento.

2. Rūkymo gaminys pagal 1 punktą, kuriame visi iš antrųjų šilumai laidžių elementų yra radialiniu būdu atskirti nuo pirmojo šilumai laidaus elemento taip, kad čia nebūtų jokio tiesioginio kontakto tarp pirmojo ir antrojo šilumai laidžių elementų.

3. Rūkymo gaminys pagal 1 arba 2 punktą, kuriame pirmasis šilumai laidus elementas ir antrasis šilumai laidus elementas yra radialiniu būdu atskirti bent vienu šilumą izoliuojančios medžiagos sluoksniu.

4. Rūkymo gaminys pagal 3 punktą, kuriame šilumą izoliuojanti medžiaga yra popieriaus įvynioklis (12).

5. Rūkymo gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame antrasis šilumai laidus elementas apima vieną arba daugiau šilumą reflektuojančios medžiagos sluoksnių.

6. Rūkymo gaminys pagal 5 punktą, kuriame šilumą reflektuojanti medžiaga reflektuoja daugiau kaip 50 % krentančio spinduliavimo.

7. Rūkymo gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame antrasis šilumai laidus elementas apima vieną arba daugiau aliuminio sluoksnių.

8. Rūkymo gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame antrasis šilumai laidus elementas uždengia bent dalį aerozolį formuojančio substrato ir bent dalį šilumos šaltinio.

9. Rūkymo gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame antrasis šilumai laidus elementas turi maksimalų storį nuo 5 iki 50 mikronų.

10. Rūkymo gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame pirmasis šilumai laidus elementas ir antrasis šilumai laidus elementas yra atskirti radialiniu būdu per bent 50 mikronų.

11. Rūkymo gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, dar apimantis išorinį popieriaus įvynioklį aplink antrąjį šilumai laidų elementą.

12. Rūkymo gaminys pagal bet kurį 1 - 10 punktą, kuriame antrasis šilumai laidus elementas (30, 30') yra numatytas ties rūkymo gaminio išorine puse taip, kad antrasis šilumai laidus elementas būtų matomas ant rūkymo gaminio išviršinio paviršiaus.

13. Rūkymo gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame antrasis šilumai laidus elementas yra suformuotas iš sluoksniuotos medžiagos, turinčios vieną arba daugiau šilumai laidžios medžiagos sluoksnių.

14. Rūkymo gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame šilumos šaltinis (40) yra užaklintas lengvai įsidegantis šilumos šaltinis, kuriame nenumatyti išilginiai oro praėjimo kanalai šilumos šaltinyje taip, kad oras traukiamas per rūkymo gaminį panaudojimo metu neitų per jokius oro pratekėjimo kanalus išilgai šilumos šaltinio.

15. Rūkymo gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame antrasis šilumai laidus elementas (30') driekiasi už pirmojo šilumai laidaus elemento kryptimi žemyn.

16. Rūkymo gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame pirmojo šilumai laidus elemento (30') briaunos kryptimi aukštyn ir antrasis šilumai laidus elementas yra iš esmės išlygiuoti.

17. Būdas, skirtas reguliuoti rūkymo gaminio dūmas po dūmo aerozolio pristatymą papsėjimo metu, būdas apimantis pateikimą rūkymo gaminio pagal 1 punktą ir kiekio reguliavimą, pagal kurį antrasis šilumai laidus elementas driekiasi už pirmojo šilumai laidaus elemento kryptimi žemyn, virš aerozolį formuojančio substrato.

---

(51) Int.Cl. ***A61B 10/02*** (2006.01)
A61B 10/00 (2006.01)
(11) **1903946**
(96) 06765587.8
(96) 2006-05-26
(97) 2008-04-02
(97) 2016-01-20
(86) PCT/IB2006/001723
(86) 2006-05-26
(87) WO 2006/129195
(87) 2006-12-07
(30) 685892 P, 2005-05-31, US
(72) LUNDKVIST, Ulf, SE
SJOBERG, Berndt, SE
WILLANDER, Erik, SE
NYGREN, Soren, SE
(73) Aprovix AB, 751 83 Uppsala, SE
(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA", Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
(54) Mėginio paėmimo sistema
Apibrėžties punktai: 20, brėžiniai: 4.
(57) 1. Mėginio paėmimo sistema, apimanti:

a) siuntimo pakuotę (14);

b) automatinį mėginio paėmimo įrenginį (2), turintį:

i) lankstų veleną (4), turintį viename gale rankeną (5), kur velenas yra sukonstruotas tam, kad leistų individualiai automatiškai paimti ginekologinį mėginį iš gleivinės, ir

ii) mėginio paėmimo elementą (6) nuimamai prijungtą prie kito veleno galo fiksuojančia jungtimi, kuri yra suformuota per iškyšas (15) ties mėginio paėmimo elemento galu ir pritaikyta užsifiksuoti grioveliuose, patalpintuose pailginimuose (16), ties kitu veleno galu, ir veikiantį paimti ginekologinį mėginį iš asmens gleivinės; ir

c) sandarų mazgą (7), kur mazgas yra sukonstruotas laikyti mėginį paimantį elementą, turintį jame ginekologinį mėginį sandarintoje būsenoje ir talpinamą siuntimo pakuotėje sandarintoje būsenoje; ir

kuriame mėginio paėmimo elementas, velenas ir sandarus mazgas yra sukonstruoti taip, kad leistų mėginio paėmimo elementui bent iš dalies būti įtrauktam į sandarų mazgą ir atskirtą nuo veleno fiksuojančios jungties atjungimu nekontaktuojant su mėginio paėmimo elementu iš asmens, ir kuriame išsikišimai yra išlaisvinami iš griovelių, esančių pailginime, pasisukant mėginio paėmimo elementui.

2. Sistema pagal 1 punktą, kuriame velenas yra sukonstruotas tam, kad leistų individualiai automatiškai paimti ginekologinį mėginį iš gimdos kaklelio vietos.

3. Sistema pagal 1 punktą, kuriame ginekologinis mėginys yra mėginys Žmogaus papilomos viruso analizei.

4. Sistema pagal 1 punktą, dar apimanti transportavimo pakuotę (3), sukonstruotą talpinti komponentus a) – c), skirtus pristatyti asmeniui tam, kad naudotų sistemą.

5. Sistema pagal 4 punktą, kurioje transportavimo pakuotė ir mazgas, kiekvienas turi identifikavimo elementą (8).

6. Sistema pagal 5 punktą, kurioje identifikavimo elementas apima bar kodą.

7. Sistema pagal 1 punktą, kurioje veleno dalis yra standi.

8. Sistema pagal 1 punktą, kurioje velenas yra suformuotas iš polimero, turinčio polipropileno, polietileno arba jų mišinio.

9. Sistema pagal 1 punktą, kurioje mėginį paimantis elementas yra iš esmės cilindrinis ir turi diametrą nuo apytikriai 2 iki apytikriai 20 mm.

10. Sistema pagal 1 punktą, kurioje mėginį paimantis elementas turi bent vieną iškeltą dalį (9).

11. Sistema pagal 10 punktą, kurioje iškelta dalis formuoja daugybę ląstelių ir gleivinės surinkimo segmentų.

12. Sistema pagal 11 punktą, kurioje mėginį paimantis elementas dar apima bent vieną griovelį (11), kuris yra nuo apytikriai 0,01 iki apytikriai 2 mm pločio tam, kad išlaikytų jame ginekologinį mėginį.

13. Sistema pagal 12 punktą, kurioje iškelta dalis formuoja briauną prie griovelio, galinčią gramdyti audinį tam, kad paimtų mėginį.

14. Sistema pagal 13 punktą, kurioje iškelta dalis ir grioveliai yra sukonstruoti taip, kad paimtų mėginį įvedant į kūno angą ir išlaikytų paimtą mėginį įrenginio atitraukimo metu iš kūno angos.

15. Sistema pagal 1 punktą, kurioje mėginį paimantis elementas turi abrazyvinį paviršių.

16. Sistema pagal 15 punktą, kurioje abrazyvinis paviršius turi paviršiaus nelygumus nuo apytikriai 1 iki apytikriai 100 μm.

17. Sistema pagal 1 punktą, kurioje sandarus mazgas apima mazgo apdangą mazgo sandarinimui.

18. Sistema pagal 17 punktą, kurioje mazgas ir mazgo apdanga formuoja nepraleidžiantį oro sandarinimą.

19. Sistema pagal 1 punktą, dar apimanti nurodymų lakštą.

20. Sistema pagal 1 punktą, kurioje siuntimo pakuotė yra iš anksto adresuota ir kurioje mėginio paėmimo elementas turi daugybę iškeltų dalių ir griovelių, sistema dar apima nurodymų lapą;
bar kodo mazgas turi oro nepralaidžią mazgo apdangą ir sukonstruotas priimti mėginį priimantį elementą jame ir tam, kad būtų patalpintas į siuntimo pakuotę; ir
transportavimo pakuotė sukonstruota priimti siuntimo pakuotę, nuorodų lakštą, lankstų veleną, mėginio paėmimo elementą, bar kodo mazgą dėl pristatymo vartotojui.

---

(51) Int.Cl. ***A61C 8/00*** (2006.01)
A61C 13/263 (2006.01)
(11) **2561825**
(96) 10850326.9

(96) 2010-12-30
(97) 2013-02-27
(97) 2016-03-23
(86) PCT/KR2010/009603
(86) 2010-12-30
(87) WO 2011/132843
(87) 2011-10-27
(30) 20100037567, 2010-04-22, KR
(72) PARK, Kwang Bum, KR
RYOO, Kyoung Ho, KR
SHON, Kyu Seok, KR
SON, June Ig, KR
(73) Megagen Implant Co., Ltd., Gyeongsangbuk-do, KR
(74) Irena Milda SRĖBALIENĖ, 24, Patentinių paslaugų centras, UAB, J. Basanavičiaus g. 11/1, LT-03108 Vilnius, LT
(54) Dantų implanto sistema

Apibrėžties punktai: 7, brėžiniai: 9.

(57) 1. Implantų sistemą sudaro:

pirmasis tvirtinimo įtaisas (100), kuris sudarytas iš pirmojo korpuso (120) ir pirmojo vientiso sriegio (130), šis pirmasis vientisas sriegis (130) yra spiralės formos ir žiedais juosia pirmojo korpuso (120) paviršių; ir

antrasis tvirtinimo įtaisas (200) sudarytas iš antrojo korpuso (220) ir antrojo vientiso sriegio (230), šis antrasis korpusas (220) yra tokios pačios formos ir dydžio, kaip ir pirmojo korpuso (120), ir antrasis vientisas sriegis (230) yra spiralės formos ir žiedais juosia antrojo korpuso (220) paviršių, kur antrojo vientiso sriegio (230) skersmuo skiriasi nuo pirmojo vientiso sriegio (130) skersmens;

kur antrojo vientiso sriegio (230) briaunų galiniai kraštai yra nustatytu atstumu nutolę išilgai spindulio į išorę nuo pirmojo ištisinio sriegio (130) pirmosios priekinės briaunos galo (131a),

b e s i s k i r i a n t i tuo, kad antrojo vientiso sriegio (230) viršutinė dalis yra išlenkta (231b) ir yra identiška viršutinei išlenktai daliai (131b), sudarančiai pirmosios priekinės briaunos (131a) viršutinį paviršių ir taip pat išlenkta sriegio apatinė dalis (231c), kuri yra identiška apatinei išlenktai daliai (131c), sudarančiai pirmosios priekinės briaunos (131a) apatinį paviršių, ir tuo, kad antrojo vientiso sriegio (230) briaunos galinis kraštas yra nustatytu atstumu nutolęs išilgai spindulio į išorę nuo pirmojo vientiso sriegio (130) pirmosios priekinės briaunos (131a) taip, kad būtų galima implantuoti antrąjį tvirtinimo įtaisą (200) negręžiant papildomai skylėje (H), kur buvo implantuotas pirmasis tvirtinimo įtaisas (100).

2. Implantų sistema pagal apibrėžties 1 punktą, kur pirmąjį tvirtinimo įtaisą (100) dar sudaro pirmoji neleidžianti gesti kaului dalis (170), esanti viename pirmojo korpuso (120) galiniame krašte ir apsauganti alveolinį kaulą, esantį atviroje skylės (H) vietoje, kur yra implantuotas pirmasis tvirtinimo įtaisas (100), kad jo nepažeistų pirmasis vientisas sriegis (130); ir

antrąjį tvirtinimo įtaisą (200) dar sudaro antroji neleidžianti gesti kaului dalis (270), esanti viename antrojo korpuso (120) galiniame krašte ir apsauganti alveolinį kaulą, esantį atviroje skylės (H) vietoje, kad jo nepažeistų antrasis vientisas sriegis (230).

3. Implantų sistema, pagal apibrėžties 2 punktą, kur pirmoji ir antroji neleidžiančios gesti kaului dalys (170, 270) yra atitinkamai suformuotos vietose, kuriose nėra sriegių, kur pirmasis ir antrasis vientisi sriegiai (130, 230) nejuosia pirmojo ir antrojo korpusų (120, 220) galinių išorinių paviršių, ir yra integraliai suformuotos pirmame ir antrame korpusuose (120, 220) iki iš anksto nustatyto ilgio viename kiekvieno pirmojo ir antrojo korpusų (120, 220) galiniame krašte.

4. Implantų sistema pagal apibrėžties 3 punktą, kur kiekviena pirmoji ir antroji neleidžiančios gesti kaului dalys (170, 270) turi netiesinį išorinį paviršių, tokį kad pirmosios ir antrosios neleidžiančios gesti kaului dalių (170, 270) skersmuo mažėja nuo vienos kiekvieno iš pirmojo ir antrojo korpusų (120, 220) galinės dalies į priešingą jos pusę.

5. Implantų sistema pagal vieną iš ankstesnių punktų, kur pirmasis ir antrasis korpusai (120, 220) yra numatyti taip, kad kiekvieno iš pirmojo ir antrojo korpusų (120, 220) išorė nusmailinta tokiu būdu, kad kiekvieno iš pirmojo ir antrojo korpusų (120, 220) skersmuo mažėja išilgai implantavimo kryptimi; ir

įsivaizduojama kontūrinė linija, jungianti pirmojo ir antrojo vientisų sriegių (130, 230) priekines briaunas, sudaro smailėjančią pasvirą liniją, kur plotis tarp įsivaizduojamų horizontalių linijų po truputį mažėja implantavimo kryptimi.

6. Implantų sistema pagal vieną iš ankstesnių punktų, kur pirmojo vientiso sriegio (130) žingsnis (P) tarp sriegių ir antrojo vientiso sriegio (230) žingsnis (P) tarp sriegių yra identiški vienas kitam.

7. Implantų sistema pagal apibrėžties 2, 3 arba 4 punktą, kur kiekvieną pirmąjį ir antrąjį vientisus sriegius (130, 230) sudaro:

priekinė briauna (131a, 231a), kuri yra vertikali arba nuožulni į vieną pusę; ir

išlenkta dalis (131b, 131c, 231b, 231c), suformuota apatiniame arba viršutiniame priekinės briaunos (131a, 231a) paviršiuje ir sumažinanti pasipriešinimą sukimui,

kur pirmąjį tvirtinimo įtaisą (100) dar sudaro pirmosios įvesties kreiptuvo dalis (160), esanti pirmojo korpuso (120) gale, priešingame pirmajai neleidžiančiai gesti kaului daliai (170), ir kurio ilgis yra toks pat, kaip iš anksto nustatytas pjūvis pirmojo korpuso (120) išilgine kryptimi, nuo pirmojo korpuso (120) priekinės briaunos (131a) ta kryptimi, kuria pirmasis korpusas (120) yra implantuotas ir kuria pirmasis korpusas (120) nukreiptas į pradinę implantavimo įvestį,

kur antrąjį tvirtinimo įtaisą (200) dar sudaro antrosios įvesties kreiptuvo dalis (260), esanti antrojo korpuso (220) gale, priešingame antrajai neleidžiančiai gesti kaului daliai (270), ir kurio ilgis yra toks pats, kaip iš anksto nustatytas pjūvis antrojo korpuso (220) išilgine kryptimi, nuo antrojo korpuso (220) priekinės briaunos (231a) ta kryptimi, kuria antrasis korpusas (220) yra implantuotas ir kuria antrasis korpusas (220) nukreiptas į pradinę implantavimo įvestį.

---

(51) Int.Cl. ***A61F 9/007*** (2006.01)
A61M 1/00 (2006.01)

(11) **2648664**

(96) 11788728.1

(96) 2011-11-15

(97) 2013-10-16

(97) 2016-01-13

(86) PCT/US2011/060751

(86) 2011-11-15

(87) WO 2012/078319

(87) 2012-06-14

(30) 962082, 2010-12-07, US

(72) LANE, MD, Stephen, US

(73) Alcon Research, Ltd., Fort Worth, Texas 76134, US

(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT

(54) Jungtinis bendraašis ir bimanualinis drėkinimo (išsiurbimo) aparatas

Apibrėžties punktai: 5, brėžiniai: 5.

(57) 1. Jungtinis bendraašis ir bimanualinis drėkinimo (išsiurbimo) montažas (100) panaudojimui chirurginėje procedūroje, apimantis:

drėkinimo rankinį elementą (102), apimantį drėkinimo adatą (114), besitęsiančią nuo drėkinimo rankinio elemento distalinio galo (112), drėkinimo adata sukonstruota išskirti drėkinimo skystį iš montažo;

išsiurbimo rankinį elementą (104), apimantį išsiurbimo adatą (128), besitęsiančią nuo išsiurbimo rankinio elemento distalinio galo (126), išsiurbimo adata turi ašį ir yra sukonstruota išsiurbti skystį montaže, b e s i s k i r i n t i s tuo, kad montažas (100) dar apima

įvorės elementą (106), įvorės elementas sujungia kartu drėkinimo rankinį elementą (102) ir išsiurbimo rankinį elementą (104), kai montažas yra pirmosios formos, kur įvorės elementas turi vidaus gręžtinę angą (142) ir distalinius išsiurbimo galus (112, 126) ir drėkinimo rankenos elementai yra sukonstruoti įsiterpti į gręžtinę angą išsiurbimo distaliniams galams ir drėkinimo rankenos elementams sujungti su movos elementu;

kur montažas turi pirmąją formą, kurioje drėkinimo rankinis elementas (102) ir išsiurbimo rankinis elementas (104) yra kartu sujungti taip, kad išsiurbimo adata (128) driekiasi išilgai įvorės elemento (106), centrinės ašies pirmoje formoje vidinėje gręžtinėje angoje (142), kuriame drėkinimo skystis, išleidžiamas iš drėkinimo adatos (114), pristatomas per žiedinės formos erdvę tarp išsiurbimo adatos (128) ir įvorės elemento (106) išilgai įvorės elemento (106) distalinio galo (140), ir antrąją išmontuotą formą, kuri suteikia fiziškai atskirtiną ir nepriklausomai galintį veikti drėkinimo rankinį elementą (102) ir išsiurbimo rankinį elementą (104), kuris veikia kaip bimanualinis įrankis.

2. Montažas pagal 1 punktą, kuriame vidinė gręžtinė anga (142) turi proksimalinę skylę (144) ir priešingą distalinę skylę (146), įvorės elementas (106) turi vidinius sriegius gręžtinės angos viduje greta proksimalinės skylės, ir

kuriame drėkinimo ir išsiurbimo rankenų elementų distaliniai galai, kiekvienas turi išorinius sriegius (132, 118) taip, kad srieginiu būdu sujungtų vidinius sriegius (150) su gręžtine anga (142).

3. Montažas pagal 2 punktą, kuriame dalis išsiurbimo adatos (128) driekiasi už distalinės skylės (146).

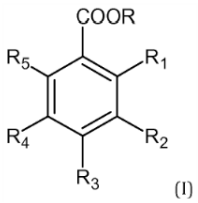
4. Montažas pagal 1 punktą, dar apima sujungimo elementą (108), besidriekiantį tarp drėkinimo rankinio elemento (102) ir išsiurbimo rankinio elemento (104) tam, kad sujungtų rankinius elementus kartu, kai montažas yra pirmojoje formoje.

5. Montažas pagal 4 punktą, kuriame sujungimo elementas (108) yra suveržimo elementas, kuris kartu sujungia kiekvieną iš drėkinimo rankinio elemento (102) ir išsiurbimo rankinio elemento (104) proksimalinių galinių dalių (112, 124).

---

(51) Int.Cl. ***A61K 9/46*** (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/107 (2006.01)
A61K 31/215 (2006.01)
A61K 31/216 (2006.01)
(11) **1930002**
(96) 06761527.8
(96) 2006-07-21
(97) 2008-06-11
(97) 2016-01-06
(86) PCT/CN2006/001792
(86) 2006-07-21
(87) WO 2007/014515
(87) 2007-02-08
(30) 200510012287, 2005-08-02, CN
(72) QIN, Weihua, CN
(73) SHENGHUA (GUANGZHOU) PHARMACEUTICAL SCIENCE &, No.102 Xianlie Zhong Road, Guangzhou Guangdong 510070, CN
(74) Stanislava TELEIŠIENĖ, 31, UAB „Brainera“, Savanorių pr. 217, LT-02300 Vilnius, LT
(54) Hidroksibenzenkarboksirūgšties esterio junginių panaudojimas vaisto, skirto ŽPV (HPV) infekcijos prevencijai ir gydymui, gamyboje
Apibrėžties punktai: 9, brėžiniai: 0.

(57) 1. Hidroksibenzkarboksirūgšties esterio, kurio formulė (I) nurodyta žemiau, panaudojimas vaisto, skirto prevencijai ir gydymui žmonių ar gyvūnų ŽPV infekcijos, ŽPV sukeltų *Condylomata acuminata*, gimdos kaklelio erozijos ŽPV turintiems pacientams, lėtinio cervicito ŽPV turintiems pacientams, arba pagalbai gimdos kaklelio vėžio gydyme, kur R yra C1-11 alkilo grupė; R1, R2, R3, R4 ir R5 yra nepriklausomai OH arba H; ir ne mažiau kaip du iš jų yra OH



(I)

2. Hidroksibenzkarboksirūgšties esterio panaudojimas vaisto gamybai pagal 1 punktą, kur minėtas R yra C_{1-8} alkilo grupė.

3. Hidroksibenzenkarboksirūgšties esterio panaudojimas vaisto gamybai pagal 1 arba 2 punktus, kur minėtas R yra C_{1-3} alkilo grupė.

4. Hidroksibenzenkarboksirūgšties esterio panaudojimas vaisto gamybai pagal 1-3 punktus, kur bent trys iš minėtų R yra R_1, R_2, R_3, R_4 ir R_5 yra OH.

5. Hidroksibenzenkarboksirūgšties esterio panaudojimas vaisto gamybai pagal 1-3 punktus, kur minėtas hidroksibenzenkarboksirūgšties esteris yra parinktas iš grupės, susidedančios iš 2,4-hidroksibenzenkarboksirūgšties

esterio, 3,4-dihidroksibenzenkarboksirūgšties esterio, 2,3,4-trihidroksibenzenkarboksi rūgšties esterio, 3,4,5-trihidroksibenzenkarboksirūgšties esterio ir 3,4,6-trihidroksibenzenkarboksirūgšties esterio.

6. Hidroksibenzenkarboksi rūgšties esterio panaudojimas vaisto gamybai pagal 1-5 punktus, kur minėtas hidroksibenzenkarboksirūgšties esteris yra parinktas iš grupės, susidedančios iš 2,3,4-trihidroksibenzenkarboksirūgšties esterio, 3,4,5-trihidroksibenzenkarboksirūgšties esterio, 3,4,6-trihidroksibenzenkarboksirūgšties esterio.

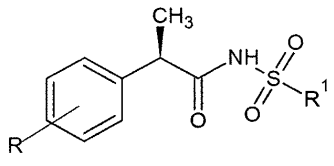
7. Hidroksibenzenkarboksirūgšties esterio panaudojimas vaisto gamybai pagal 1-6 punktus, kur minėtas hidroksibenzenkarboksirūgšties esteris yra 3,4,5-tihidroksibenzenkarboksirūgšties esteris.

8. Hidroksibenzenkarboksirūgšties esterio panaudojimas vaisto gamybai pagal 1-7 punktus, kur minėtas junginys ir/arba kompozicija, apimanti tokį junginį kaip aktyvų ingredientą, yra/yra pagaminta kaip milteliai, tirpalas, tabletės, kapsulės, granulės arba skysčiai su įvairiais adjuvantais, skirtais injekcijoms arba geriamiesiems preparatams arba pagaminti tepalai, geliai, losjonai, tabletės, žvakutės, plėvelės arba purškalai su įvairiais adjuvantais, skirtais gleivinės kompozicijoms arba kitoms farmaciniu požiūriu priimtinoms kompozicijoms.

9. Hidroksibenzenkarboksirūgšties esterio panaudojimas vaisto gamybai pagal 1-7 punktus, kur minėtas junginys ir/arba kompozicija, apima tokį junginį kaip aktyvų ingredientą, yra/yra naudojamas(a) kaip asmens priežiūros gaminiai, kur tokie asmens priežiūros produktai yra rankų muilas, rankų dezinfekavimo priemonės, kūno prausikliai, kūno valymo želė, kūno prausimo muilas, kūno priežiūros servetėlės, veido servetėlės, nosies purškalai ar jų deriniai.

---

(51) Int.Cl. ***A61K 31/185*** (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)
(11) **2485724**
(96) 10768898.8
(96) 2010-10-06
(97) 2012-08-15
(97) 2016-02-10
(86) PCT/EP2010/064920
(86) 2010-10-06
(87) WO 2011/042465
(87) 2011-04-14
(30) 09172365, 2009-10-06, EP
(72) PIEMONTI, Lorenzo, IT
DAFFONCHIO, Luisa, IT
ALLEGRETTI, Marcello, IT
(73) Dompé farmaceutici s.p.a., 20122 Milano, IT
(74) Tatjana STERLINA, 37, UAB „Intels“, Naugarduko g. 32/2, LT-03225 Vilnius, LT
(54) Sulfonamidai, skirti diabeto prevencijai
Apibrėžties punktai: 4, brėžiniai: 0.
(57) 1. Junginys, kurio formulė I arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska:



(I)

kur R yra parinktas iš linijinio arba šakoto 4-(C_1-C_6) alkilo, 4-trifluormetansulfoniloksi ir 3-benzoilo, o R^1 yra (C_1-C_6) alkilas, skirti naudoti diabeto prevencijai arba diabeto atsiradimo ir progresavimo atitolinimui.

2. Junginys, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur diabetas yra 1 tipo cukrinis diabetas.

3. Junginys, skirtas naudoti pagal bet kurį vieną iš 1-2 punktų, parinktas iš R(-)-N-2-[(4-izobutilfenil)propionil]-metansulfonamido ir R(-)-2[(4'-trifluorometanosulfoniloksi) fenil]propionil-metansulfonamido.

4. Junginys, skirtas naudoti kaip pagal bet kurį vieną iš 1-3 punktų, kur minėta druska yra parinkta iš lizino ir natrio druskų.

---

(51) Int.Cl. ***A61K 31/335*** (2006.01)
A61K 31/7048 (2006.01)
A61K 31/365 (2006.01)
A61P 1/12 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)

(11) **2070530**

(96) 09156339.5

(96) 2005-05-13

(97) 2009-06-17

(97) 2016-02-17

(30) 570697 P, 2004-05-14, US

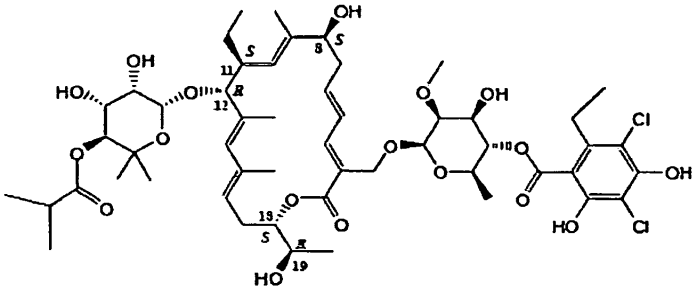
(72) Shue, Youe-Kong, US
Babakhani, Farah Kondori, US
Okumu, Franklin W., US
Sears, Pamela Suzanne, US
Miller-Shangle, Starr Louise, US
Walsh, Robert Brian, US

(73) Merck Sharp & Dohme Corp., Rahway, NJ 07065, US

(74) Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

(54) Ligų, susijusių su antibiotikų vartojimu, gydymas
Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 0.

(57) 1. Junginys, turintis formulę:



skirtas naudoti paciento ligos, sąlygotos *Clostridium difficile* buvimo, gydymui.

2. Junginys pagal 1 punktą, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur pacientas yra žinduolis.

3. Junginys pagal 1 punktą, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur pacientas yra žmogus.

4. Junginys pagal 1 punktą, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur liga yra susijusi su antibiotikų vartojimu.

5. Junginys pagal 1 punktą, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur liga yra susijusi su chemoterapijos naudojimu.

6. Junginys pagal 1 punktą, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur liga yra susijusi su antivirusinės terapijos naudojimu.

7. Junginys pagal 4 punktą, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur liga yra su antibiotikais susijęs viduriavimas.

8. Junginys pagal bet kurį iš 1-6 punktą, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur liga yra kolitas.

9. Junginys pagal bet kurį iš 1-6 punktą, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur liga yra pseudomembraninis kolitas.

10. Junginys pagal bet kurį iš 1-9 punktą, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur junginys yra skirtas įvedimui kiekiu nuo maždaug 10 mg iki maždaug 1 g.

11. Junginys pagal 10 punktą, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur junginys yra skirtas įvedimui kiekiu nuo maždaug 50 mg iki maždaug 400 mg vieną arba du kartus per dieną.

12. Junginys pagal bet kurį iš 1-10 punktą, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur junginys yra skirtas įvedimui nuo vieno iki keturių kartų per dieną.

13. Junginys pagal bet kurį iš 1-12 punktą, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur junginys yra skirtas įvesti pacientui peroraliai.

14. Junginys pagal bet kurį iš 1-10 punktą, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur junginys yra skirtas įvedimui nuo vieno iki keturių kartų per dieną 3-15 dienų.

15. Junginys pagal 1 punktą, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur junginys yra skirtas naudoti su *Clostridium difficile* susijusio paciento viduriavimo gydymui, įvedant peroraliai.

---

(51) Int.Cl. ***A61K 31/437*** (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 27/00 (2006.01)
(11) **2349260**
(96) 09737257.7
(96) 2009-10-01
(97) 2011-08-03
(97) 2016-01-06
(86) PCT/US2009/059203
(86) 2009-10-01
(87) WO 2010/039939
(87) 2010-04-08
(30) 102242 P, 2008-10-02, US
(72) FRIEDMAN, Paul A., US
FRIDMAN, Jordan S., US
LUCHI, Monica E., US
WILLIAMS, William V., US
(73) Incyte Holdings Corporation, Wilmington, DE 19803, US
(74) Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Janus kinazės inhibitoriai, skirti sausų akių ir kitų su akimis susijusių ligų gydymui
Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 0.
(57) 1. Agentas, skirtas naudoti paciento sausų akių sutrikimo gydyme, kur minėtas agentas yra 3-ciklopentil-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]propannitrilas arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

2. Agentas, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur minėtas agentas yra (3R)- 3-ciklopentil-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]propannitrilas arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

3. Agentas, skirtas naudoti pagal 1 arba 2 punktą, kur minėtas sausų akių sutrikimas yra:
(a) dėl vandeningų ašarų trūkumo sausos akys;
(b) sausos akys dėl pagreitėjusio išgaravimo;
(c) sausos akys dėl Sjogren‘ sindromo;
(d) sausos akys ne dėl Sjogren‘ sindromo;

4. Agentas, skirtas naudoti pagal bet kurį iš 1-3 punktą, kur minėtas gydymas apima simptomo, parinkto iš akių diskomforto, regėjimo sutrikimo, ašarų plėvelės nestabilumo, ašarų hiperosmoliariškumo ir akies paviršiaus uždegimo, palengvinimą.

5. Agentas, skirtas naudoti pagal bet kurį iš 1-4 punktą, kur minėtas gydymas apima įvedimą minėtam pacientui farmacinės kompozicijos, apimančios minėtą agentą ir farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį.

6. Agentas, skirtas naudoti pagal 5 punktą, kur minėta farmacinė kompozicija yra peroralinė vaisto forma.

7. Agentas, skirtas naudoti pagal bet kurį iš 1-4 punktą, kur minėtas gydymas apima įvedimą minėtam pacientui oftalminės kompozicijos, apimančios minėtą agentą ir oftalminiu požiūriu priimtiną nešiklį.

8. Agentas, skirtas naudoti pagal 7 punktą, kur minėta oftalminė kompozicija yra (a) vietinė kompozicija; arba (b) vandeninė kompozicija, vandeninė suspensija, tepalas arba gelis.

9. Agentas, skirtas naudoti pagal 7 punktą, kur minėta oftalminė kompozicija yra akių įdėklas.

10. Agentas, skirtas naudoti pagal 9 punktą, kur;

(a) minėtas akių įdėklas apima mikrorutuliukus;

(b) minėti mikrorutuliukai yra injekuoti į akies užpakalinį segmentą, į gyslainės plotą, į odeną, į stiklakūnį arba po tinklaine;

(c) minėtas akių įdėklas apima kolageną, želatiną arba polimerą, kur minėtas polimeras yra parinktas iš polikaprolaktono (PCL), etilen/vinilacetato kopolimero (EVA), polialkilo cianoakrilato, poliuretano, nailono, poli(dl-laktido-ko-glikolido) (PLGA), arba bet kurių iš aukščiau paminėtų kopolimero; arba

(d) minėtas akių įdėklas yra implantuotas po viršutiniu akies voku, į akies užpakalinį segmentą, į gyslainės plotą, į odeną, į stiklakūnį arba po tinklaine.

11. Agentas, skirtas naudoti pagal bet kurį iš 1-10 punktą, dar apimantį bent vieno papildomo terapinio agento įvedimą.

12. Agentas, skirtas naudoti pagal 11 punktą, kur:

(a) minėtas papildomas terapinis agentas yra fluocinolono acetonidas, rimeksolonas, ciklosporinas, riaminolonas, deksametazonas, fluocinolonas, kortizonas, prednizolonas, flumetolonas, civamidas, testosteronas, ekabeto natris, 15-(s)-hidroksieikozatetraenoinė rūgštis, 2S,3S,4R,5R)-3,4-dihidroksi-5-[6-[(3-jodofenil)metilamino]purin-9-il]-N-metil-oksolan-2-kar-boksamidas, gefarnatas, cevileminas, doksiclinas, minociklinas, oksitetraciklinas, voklosporinas, rivoglitazonas, lakritino rebamipidas, pilokarpinas, takrolimusas, pimekrolimusas, loteprednolio etabonatas, rituksimabas, dikvafosolio tetranatris, dehidroepiandrosteronas, anakinra, efalizumabas, mikofenoliato natris, etanerceptas, hidroksichlorochinas arba talidomidas; arba

(b) minėtas papildomas terapinis agentas yra natrio hialuronatas, hialurono rūgštis, polivinilalkoholis, hidroksipropilmetilceliuliozė, glicerinas, polietilenglikolis arba karboksimetilceliuliozė.

13. Agento panaudojimas medikamento, skirto sausų akių sutrikimo gydymui, gamyboje, kur minėtas agentas yra 3-ciklopentil-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]propannitrilas arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

14. Panaudojimas pagal 13 punktą, kur agentas yra (3R)- 3-ciklopentil-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]propannitrilas arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

---

(51) Int.Cl. ***A61K 31/506*** (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
C07D 239/69 (2006.01)

(11) **2501384**

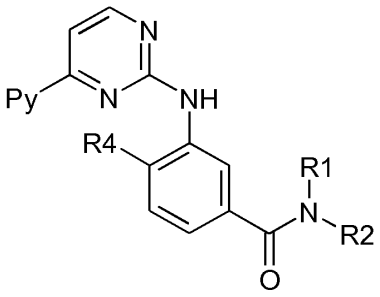
(96) 10781781.9

(96) 2010-11-17

(97) 2012-09-26
(97) 2016-02-17
(86) PCT/US2010/056926
(86) 2010-11-17
(87) WO 2011/062927
(87) 2011-05-26
(30) 261812 P, 2009-11-17, US
(72) GALLAGHER, Neil, CH
YIN, Ophelia, US
(73) Novartis AG, 4056 Basel, CH
(74) Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Proliferacinių sutrikimų ir kitų patologinių būklių, medijuojamų BCR-ABL, C-KIT, DDR1, DDR2 arba PDGF-R kinazės aktyvumo, gydymo būdas

Apibrėžties punktai: 3, brėžiniai: 0.

(57) 1. Pirimidilaminobenzamidas, turintis formulę (I)



(I),

kurioje

Py reiškia 3-piridilą,

R1 reiškia vandenilį,

R2 reiškia 5-(4-metil-1H-imidazol-1-il)-3-(trifluormetil)-fenilą; ir

R4 reiškia metilą;

arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, skirti naudoti proliferacinių sutrikimų arba kitų patologinių būklių, parinktų iš melanomos, ypač melanomos, turinčios c-KIT mutacijas, krūties vėžio, gaubtinės žarnos vėžio, plaučių vėžio, prostatos vėžio arba Kaposi' sarkomos, virškinamojo trakto stromos navikų (GIST), ūmios mieloidinės leukemijos (AML), leukemijos, kuri reaguoja į Abl tirozinkinazės aktyvumo inhibavimą, lėtinės mieloidinės leukemijos (CML), ūmios limfoblastinės leukemijos su teigiama Filadelfijos chromosoma (Ph + ALL), mezoteliomos, sisteminės mastocitozės, hipereozinofilinio sindromo (HES), fibrozės, kepenų fibrozės, inkstų fibrozės, reumatoidinio artrito, poliartrito, sklerodermijos, raudonosios vilkligės, transplantatas-prieš-šeimininką ligos, neurofibromatozės, plaučių hipertenzijos, plaučių arterinės hipertenzijos, Alzheimerio ligos, seminomos, disgerminomos ir psoriazės gydymui, kur junginys, turintis formulę (I) arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska ir, pasirinktinai, farmaciniu požiūriu priimtini nešikliai įvedami peroraliai, disperguoti obuolių sultyse.

2. Pirimidilaminobenzamidas, turintis formulę (I), skirtas naudoti pagal 1 punktą, jo monohidrochlorido monohidrato druskos pavidale.

3. Pirimidilaminobenzamidas, turintis formulę (I), arba pirimidilaminobenzamidas, turintis formulę (I) jo monohidrochlorido monohidrato druskos pavidale, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur patologinė būklė yra parinkta iš CML ir Ph + ALL.

---

(51) Int.Cl. ***A61K 31/519*** (2006.01)
A61K 31/593 (2006.01)
A61K 31/714 (2006.01)
A61K 33/06 (2006.01)
A61K 33/26 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)

A61P 5/14 (2006.01)
A61P 7/06 (2006.01)
A61P 1/16 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)

(11) **2451299**
(96) 10797960.1
(96) 2010-07-09
(97) 2012-05-16
(97) 2016-04-06
(86) PCT/US2010/041631
(86) 2010-07-09
(87) WO 2011/006147
(87) 2011-01-13
(30) 270615 P, 2009-07-10, US
270741 P, 2009-07-13, US
(72) Scott III, , Linzy O., US
(73) Scott III,, Linzy O., Atlanta, GA 30331, US
(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
(54) Būdai ir kompozicijos, skirtos su skydliauke susijusių sveikatos būsenų gydymui, su sumažintu filatų kiekiu
Apibrėžties punktai: 16, brėžiniai: 0.
(57) 1. Kompozicija, apimanti foliatą, skirta panaudoti hipotiroidizmu sergančio individo smegenų foliato nepakankamumo gydymo būdui, kur minėtas būdas apima:
a. hipotiroidizmu sergančio individo atrinkimą, kuris yra gydomas narkotiku, agentu, vaistu arba hormonu, parinktu iš grupės, susidedančios iš levotiroksino, levotiroksino natrio, liotironino natrio, liotrikso, tiroksino ir trijodtironino; ir
b. minėtos kompozicijos, apimančios foliatą, skyrimą individui.

2. Kompozicija, skirta panaudoti pagal 1 punktą, kur kur foliatas yra sumažinto kiekio foliatas.

3. Kompozicija, skirta panaudoti pagal 1 punktą, kur foliatas yra 6(S)-5-metiltetrahidrofoliatas.

4. Kompozicija, skirta panaudoti pagal 1-3 punktus, papildomai apimantis vitamino B12 skyrimą individui.

5. Kompozicija, skirta panaudoti pagal 1 punktą, kur individas turi užmaskuotą megaloblatinę anemoją.

6. Kompozicija, skirta panaudoti pagal 1 punktą, kur individas turi užmaskuotą makrocitinę anemiją.

7. Kompozicija, skirta panaudoti pagal 1 punktą, kur individas turi hepatitinę disfunkciją.

8. Kompozicija, skirta panaudoti pagal 1 punktą, kur individas turi MTHFR polimorfizmą.

9. Kompozicija, skirta panaudoti pagal 1-3 punktus, papildomai apimanti vitamino B12 ir geležies skyrimą individui.

10. Kompozicija, skirta panaudoti pagal 1-3 punktus, papildomai apimanti vitamino B12 ir L-karnitino skyrimą individui.

11. Kompozicija, skirta panaudoti pagal 1-3 punktus, papildomai apimanti vitamino B12 ir kalcio skyrimą individui.

12. Kompozicija, skirta panaudoti pagal 1-3 punktus, papildomai apimanti vitamino B12 ir vitamino D skyrimą individui.

13. Kompozicija, skirta panaudoti pagal 1-3 punktus, kur kompozicija papildomai apima vitaminą B12 ir vieną arba daugiau iš šių: geležį, L-karnitiną, kalcį arba vitaminą D.

14. Kompozicija, skirta panaudoti pagal 1-3 punktus, papildomai apimanti vitamino B12, geležies, L-karnitino, kalcio arba vitamino D skyrimą.

15. Kompozicija, apimanti (a) narkotiką, agentą, vaistą arba hormoną, parinktą iš grupės, susidedančios iš levotiroksino, levotiroksino natrio, liotironino natrio, liotrikso, tiroksino ir trijodtironino ir (b) sumažinto kiekio foliatą, kur sumažinto kiekio foliatas yra 6(S)-5-metiltetrahidrofoliatas.

16. Kompozicija pagal 15 punktą, papildomai apimanti vitaminą B12.

---

(51) Int.Cl. ***A61K 31/7036*** (2006.01)
A61K 31/145 (2006.01)
A61K 31/00 (2006.01)
(11) **2651419**
(96) 11808253.6
(96) 2011-12-14
(97) 2013-10-23
(97) 2016-02-10
(86) PCT/GB2011/001721
(86) 2011-12-14
(87) WO 2012/080700
(87) 2012-06-21
(30) 201021186, 2010-12-14, GB
423000 P, 2010-12-14, US
(72) O`NEIL, Deborah, GB
CHARRIER, Cedric, GB
(73) Novabiotics Limited, Craibstone Aberdeen AB21 9TR, GB
(74) Liucija JANICKAITĖ, 29, Inpatra UAB, Šeškinės g. 59-53, LT-07162 Vilnius, LT
(54) Kompozicija, apimanti antibiotiką ir dispergentą
Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 0.
(57) 1. Produktas, apimantis sinergetiškai veiksmingą kiekį antibiotiko agento ir antrojo agento dispergento; kur antibiotikas yra tobramicinas, kolistinas, gentamicinas arba ciprofloksacinas ir kur antrasis agentas yra cisteaminas.

2. Produktas pagal 1 punktą, skirtas naudoti kaip vaistas.

3. Substratas, prie kurio produktas, kaip apibrėžta 1 punkte, yra pritaikytas arba pridėtas.

4. Substratas pagal 3 punktą, kur substratas yra parinktas iš grupės, susidedančios iš tvarsliavos, medicinos priemonių ir invazinių priemonių.

5. Substratas pagal 4 punktą, kur invazinės priemonės yra parinktos iš grupės, susidedančios iš stentų, kateterių, peritoninės dializės vamzdelių, drenavimo priemonių, sąnarių protezų ir dantų implantų.

6. Farmacinė kompozicija, apimanti produktą pagal 1 punktą ir vieną arba daugiau farmaciniu požiūriu priimtinų skiediklių, pagalbinių medžiagų ir (arba) nešiklių.

7. Produktas pagal 1 punktą, skirtas naudoti gydymui arba prevencijai mikrobinės infekcijos arba ligos arba su jomis susijusios būklės.

8. Produktas, skirtas naudoti pagal 7 punktą, kur infekcija arba liga, arba su jomis susijusi būklė yra parinkta iš grupės, susidedančios iš odos ir žaizdų infekcijų, vidurinės ausies infekcijos, skrandžio ir žarnyno trakto infekcijų, pilvaplėvės membranos infekcijos, urogenitalinės sistemos infekcijų, minkštųjų burnos audinių infekcijos, dantų apnašų formavimosi, akių infekcijų, endokarditų, cistinės fibrozės infekcijų ir invazinių medicinos priemonių infekcijų.

9. Produktas, skirtas naudoti pagal bet kurį vieną iš 7 ir 8 punktų, kur infekcija yra gleivinės terpės infekcija.

10. Produktas, skirtas naudoti pagal 9 punktą, kur infekcija yra bakterinė infekcija, susijusi su cistine fibroze.

11. Produktas, skirtas naudoti pagal bet kurį iš 7-10 punktų, kur infekcija yra sąlygota bakterijos, parinktos iš grupės, susidedančios iš *Pseudomonas* spp., *Staphylococcus* spp., *Haemophilus influenzae* spp., *Burkholderia* spp., *Streptococcus* spp. ir *Propionibacterium* spp.

12. Produktas, skirtas naudoti pagal 11 punktą, kur bakterija yra *Pseudomonas* spp.

13. Produktas, skirtas naudoti pagal 11 punktą, kur bakterija yra *Burkholderia* spp.

14. Produktas, skirtas naudoti pagal 11 punktą, kur bakterija yra *Staphylococcus* spp.

---

(51) Int.Cl. ***A61K 33/44*** (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/14 (2006.01)
A61K 9/16 (2006.01)
A61M 3/02 (2006.01)
A61M 3/00 (2006.01)

(11) **2763684**

(96) 12769649.0

(96) 2012-10-03

(97) 2014-08-13

(97) 2016-02-10

(86) PCT/EP2012/069513

(86) 2012-10-03

(87) WO 2013/050404

(87) 2013-04-11

(30) 11183665, 2011-10-03, EP
201117148, 2011-10-03, GB

(72) HALSKOV, Soren, SE
EKELUND, Mats, SE

(73) Ferring BV, 2132 JX Hoofddorp, NL

(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT

(54) Kompozicija, skirta fistulės gydymui
Apibrėžties punktai: 6, brėžiniai: 0.

(57) 1. Kompozicija, skirta panaudoti fistulės gydymui, kur kompozicija apima nuo 0,15 iki 1 mm dalelių dydžio aktyvuotą anglį, kur kompozicija yra skirta vartoti rektaliai kaip sausa dozė.

2. Kompozicija, skirta panaudoti pagal 1 punktą, kur aktyvuota anglis yra nuo 0,15 iki 0,3 mm vidutinio dalelių dydžio.

3. Kompozicija, skirta panaudoti pagal 1 arba 2 punktą, kur 85 % arba daugiau aktyvuotos anglies dalelių turi diametrą intervale nuo 0,152 mm iki 0,297 mm.

4. Kompozicija, skirta panaudoti pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, skirta panaudoti rektalinės arba analinės fistulės gydymui.

5. Kompozicija, skirta panaudoti pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, apimanti nuo 450 µg iki 10 g aktyvuotos anglies.

6. Kompozicija, apimanti aktyvuotą anglį, skirta panaudoti fistulės gydymui, kur kompozicija apima nuo 0,05 iki 0,15 mm dalelių dydžio aktyvuotą anglį, kur kompozicija yra skirta vartoti rektaliai, kaip sausa dozė, naudojant dujas kaip nukreipiantį srautą.

---

(51) Int.Cl. ***A61K 39/04*** (2006.01)
(11) **2651437**
(96) 11799673.6
(96) 2011-12-14
(97) 2013-10-23
(97) 2016-02-10
(86) PCT/EP2011/072816
(86) 2011-12-14
(87) WO 2012/080369
(87) 2012-06-21
(30) 422723 P, 2010-12-14, US
(72) GODART, Stephane Andre Georges, BE
LAANAN, Amina, BE
LEMOINE, Dominique Ingrid, BE
(73) GlaxoSmithKline Biologicals S.A., 1330 Rixensart, BE
(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
(54) Mikobakterinė antigeninė kompozicija
Apibrėžties punktai: 23, brėžiniai: 0.

(57) 1. Imunogeninė kompozicija, apimanti su M72 susijusį antigeną, kur su M72 susijęs antigenas apima seką, turinčią mažiausiai 90 % identiškumo su SEQ ID Nr. 1, kur minėtos kompozicijos pH yra intervale nuo 7,0 iki 9,0 ir kompozicijos specifinis laidumas yra 5 mS/cm arba mažiau.

2. Imunogeninė kompozicija pagal 1 punktą, kur kompozicijos specifinis laidumas yra 4 mS/cm arba mažiau.

3. Imunogeninė kompozicija pagal 2 punktą, kur kompozicijos specifinis laidumas yra 3 mS/cm arba mažiau.

4. Imunogeninė kompozicija pagal bet kurį iš 1 – 3 punktų, kur minėtos kompozicijos druskų koncentracija yra 40 mM arba mažiau.

5. Imunogeninė kompozicija pagal bet kurį iš 1 – 4 punktų, papildomai apimanti nejoninį tonuso agentą.

6. Imunogeninė kompozicija pagal 5 punktą, kur nejoninis tonuso agentas yra poliolis.

7. Imunogeninė kompozicija pagal 6 punktą, kur poliolis yra sorbitolis ir kur sorbitolio koncentracija yra tarp apie 4 ir apie 6(w/v) %.

8. Imunogeninė kompozicija pagal bet kurį iš 1 – 7 punktų, kur cukrozės koncentracija yra tarp apie 4 ir apie 6(w/v) %.

9. Imunogeninė kompozicija pagal bet kurį iš 1 – 8 punktų, papildomai apimanti vieną arba daugiau imunostimuliantų.

10. Imunogeninė kompozicija pagal 9 punktą, kur imunogeninė kompozicija apima QS21.

11. Imunogeninė kompozicija pagal 9 arba 10 punktą, kur imunogeninė kompozicija apima 3-de-O-acilintą monofosforillipidą A.

12. Imunogeninė kompozicija pagal bet kurį iš 1 – 11 punktų, kur osmosiškumas yra nuo 250 iki 750 mOsm/kg.

13. Imunogeninė kompozicija pagal bet kurį iš 1 – 12 punktų, kur kompozicija yra paruošta kaip vaisto dozė tarp 50 ul ir 1 ml.

14. Imunogeninė kompozicija pagal 13 punktą, kur vaisto dozė turi nuo 5 iki 50 ug su M72 susijusio baltymo.

15. Imunogeninė kompozicija pagal 13 arba 14 punktą, kur vaisto dozė yra žmogaus dozė ir turi tarp 1 ir 100 ug 3D-MPL.

16. Imunogeninė kompozicija pagal bet kurį iš 13 – 15 punktų, vaisto dozė yra žmogaus dozė ir turi tarp 1 ir 100 ug QS21.

17. Imunogeninė kompozicija pagal bet kurį iš 1 – 16 punktų, kur minėtos kompozicijos pH yra intervale tarp 7,5 ir 8,5.

18. Imunogeninė kompozicija pagal bet kurį iš 1 – 17 punktų, kur su M72 susijęs antigenas apima SEQ ID Nr. 3 amonirūgščių seką.

19. Imunogeninė kompozicija pagal bet kurį iš 1 – 17 punktų, kur su M72 susijęs antigenas susideda iš sekos, turinčios mažiausiai 90 % identiškumą su SEQ ID Nr. 1.

20. Imunogeninė kompozicija pagal 19 punktą, kur su M72 susijęs antigenas susideda iš SEQ ID Nr. 3 sekos.

21. Imunogeninė kompozicija pagal bet kurį iš 1 – 20 punktų, skirta panaudoti medicinoje.

22. Imunogeninė kompozicija pagal bet kurį iš 1 – 21 punktų, skirta panaudoti mikobakterinės infekcijos profilaktikos, gydymo arba palengvinimo būdui.

23. Imunogeninė kompozicija, skirta panaudoti pagal 21 arba 22 punktą, skirta vartoti žmogui.

---

(51) Int.Cl. ***A61L 15/62*** (2006.01)
D01F 8/06 (2006.01)
A61F 13/15 (2006.01)
A61L 15/60 (2006.01)
A61L 15/26 (2006.01)

(11) **2305862**

(96) 09742444.4

(96) 2009-05-08

(97) 2011-04-06

(97) 2016-01-06

(86) PCT/IB2009/005526

(86) 2009-05-08

(87) WO 2009/136271

(87) 2009-11-12

(30) 2008006155, 2008-05-09, MX

(72) CANALES ESPINOSA DE LOS MONTEROS, Carlos, MX
ZAMUDIO AHUMADA, Andrés, MX
SANCHEZ FERNANDEZ, Lucia, MX

(73) Grupo P.I. Mabe, S.A. de C.V., 72230 Puebla, MX

(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

(54) Ekologiškas vienkartinis sugeriamasis gaminys

Apibrėžties punktai: 23, brėžiniai: 3.

(57) 1. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, apimantis pralaidų viršutinį lakštą, nepralaidų apatinį lakštą, vidurinį sugeriamąjį sluoksnį, esantį tarp viršutinio ir apatinio lakšto, sudarytą iš superabsorbcinės medžiagos pluošto bei dalelių, išorinių hermetiškų apvadų, juosmens ir kojų elastinių priemonių, susegimo sistemos bei sujungiamųjų priemonių; b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad bent 50% minėtų elementų sudėtyje yra biologiškai skaidžių junginių, tokių kaip biologiškai skaidūs junginiai, sudaryti iš natūralių junginių, kurie po tam tikro liko suyra ir transformuojasi į mažiau sudėtingus junginius bei, galiausiai, į pačius paprasčiausius komponentus ir kur biologiškai skaidūs junginiai yra parinkti iš:

gaminio viršutinio lakšto – neaustinių medžiagų, kurių sudėtyje yra polilaktidinės rūgšties (PLA) ar poli-hidroksil-alkanoatų (PHA) arba neaustinių medžiagų, kurių sudėtyje yra skaidumą didinančios medžiagos;

gaminio apatinio lakšto: vandens nepraleidžiančių plėvelių, kurių sudėtyje yra polilaktidinės rūgšties (PLA), poli-hidroksil-alkanoatų (PHA), polietileno su skaidumą didinančia medžiaga; sluoksniuotų medžiagų iš vandens nepraleidžiančios plėvelės ir neaustinės medžiagos, kur vandens nepraleidžiančios plėvelės sudėtyje yra PLA, PHA arba polietileno su skaidumą didinančia medžiaga, o neaustinės medžiagos sudėtyje yra PLA, PHA, medvilnės arba skaidumą didinančia medžiagos;

sugeriamojo vidurinio sluoksnio, kaip superbsorbcinės medžiagos – dalelių, iš kurių bent 20% yra biologiškai skaidžios;

hermetiškų apvadų – neaustinių medžiagų, kurių sudėtyje yra PLA, PHA arba skaidumą didinančios medžiagos;

elastinių priemonių – latekso, natūralios gumos arba elastinių medžiagų, kurių sudėtyje yra poliolefino ir skaidumą didinančios medžiagos;

susegimo sistemos – poros juostų ir juostos, pagamintos iš PHA, PLA, polietileno arba polipropileno su skaidumą didinančios medžiaga;

sujungiamųjų priemonių – klijų, kurių sudėtyje yra PHA arba PLA ir kur gaminio viršutinis lakštas pagamintas iš neaustinės medžiagos, kurios svoris yra nuo 10 iki 15 g/m^2, suformuotos iš dvikomponenčio viduriniojo sluoksnio ir apvalkalo pluošto, kur viduriniojo sluoksnio sudėtyje yra 80–100% polilaktidinės rūgšties, o apvalkalo sudėtyje – 80–100% polipropileno.

2. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas pirmesniame punkte, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad nepralaidus apatinis lakštas yra plėvelė iš mažatankio polietileno, kurio svoris yra maždaug 10–25 g/m2, su skaidumą didinančia medžiaga, kurios sudėtyje muilintų riebalų rūgščių ir kalcio.

3. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš punktų nuo 1 iki 2, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad nepralaidus apatinis lakštas yra plėvelė, pagaminta iš polilaktidinės rūgšties.

4. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš punktų nuo 1 iki 2, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad nepralaidus apatinis lakštas yra plėvelė, sudaryta iš polihidroksilalkanoatų.

5. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš punktų nuo 1 iki 2, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad nepralaidus apatinis lakštas yra iš daugiasluoksnės medžiagos su neaustine, maždaug 10 ir 15 g/m2 svorio medžiaga ir sudarytas iš dvikomponenčio vidurinio sluoksnio bei apvalkalo pluošto, kur vidurinio sudėtyje yra maždaug 80–100% polilaktidinės rūgšties, o apvalkalo sudėtyje – maždaug 80–100% polipropileno.

6. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš punktų nuo 1 iki 2, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad nepralaidus apatinis lakštas yra iš daugiasluoksnės medžiagos su neaustine, maždaug 10 ir 15 g/m2 svorio medžiaga ir sudarytas iš dvikomponenčio vidurinio sluoksnio bei apvalkalo pluošto, kur vidurinio sudėtyje yra maždaug 80–100% polihidroksialkanoato, o apvalkalo sudėtyje – maždaug 80–100% polipropileno.

7. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš punktų nuo 1 iki 2, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad nepralaidus apatinis lakštas yra laminuotas neaustine, maždaug 10 ir 15 g/m2 svorio medžiaga, sudaryta iš bent maždaug 20% medvilnės pluošto.

8. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad superabsorbcinis vidurinis sluoksnis yra sudarytas iš celiuliozės pluošto ir dviejų tipų homogeniškai sumaišytų dalelių:

a) natrio arba kalio poliakrilato dalelių;

b) sugeriamųjų dalelių, gautų iš kukurūzų krakmolo.

9. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas 8 punkte, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad mišinio sudėtyje yra maždaug 50–95% natrio arba kalio poliakrilato dalelių ir maždaug 5–50% sugeriamųjų dalelių, gautų iš kukurūzų krakmolo.

10. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad išoriniai hermetiški apvadai yra iš neaustinės, maždaug 10 - 15 g/m^2 svorio medžiagos plėvelės, sudarytos iš dvikomponenčio vidurinio sluoksnio bei apvalkalo pluošto, kur vidurinio sluoksnio sudėtyje yra maždaug 80–100% polilaktidinės rūgšties, o apvalkalo sudėtyje – maždaug 80–100% polipropileno.

11. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš punktų nuo 1 iki 10, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad išoriniai hermetiški apvadai yra iš neaustinės, maždaug 10 - 15 g/m^2 svorio medžiagos, sudarytos iš dvikomponenčio vidurinio sluoksnio bei apvalkalo pluošto, kur vidurinio sluoksnio sudėtyje yra maždaug 80–100% polihidroksialkanoatų, o apvalkalo sudėtyje – maždaug 80–100% polipropileno.

12. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš punktų nuo 1 iki 10, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad išoriniai hermetiški apvadai yra iš neaustinės, maždaug 10–15 g/m^2 svorio medžiagos, sudarytos iš bent maždaug 15% medvilnės pluošto.

13. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad gaminio kojų ir juosmens elastinės priemonės yra iš latekso arba natūralios gumos.

14. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš punktų nuo 1 iki 12, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad gaminio kojų ir juosmens elastinės priemonės yra pagamintos iš poliolefinų su skaidumą didinančia medžiaga.

15. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad gaminio susegimo sistema yra sudaryta iš poros susegimo juostelių, dedamų ant nugarinės juosmens pusės, ir juostos, dedamos ant išorinės priekinės juosmens pusės taip, kad susegimo juostelės ir (arba) juosta yra sudaryta iš poliolefinų su skaidumą didinančia medžiaga, kurios sudėtyje yra muilintų riebalų rūgščių ir kalcio.

16. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš punktų nuo 1 iki 14, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad susegimo sistema yra sudaryta iš poros susegimo juostelių, dedamų ant gaminio nugarinės juosmeninės dalies, ir juostos, dedamos ant jo išorinės priekinės juosmeninės dalies taip, kad šių susegimo juostelių ir (arba) juostos sudėtyje būtų polilaktidinės rūgšties arba polihidroksialkanoatų.

17. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jame yra išsitempiančios sritys, sudarytos iš tarp dviejų plėvelių įdėtos elastomerinės medžiagos; elastomerinė medžiaga yra poliolefinas su muilintomis riebalų rūgštimis ir skaidumą didinančia medžiaga, kurios sudėtyje yra muilintų riebalų rūgščių bei kalcio, o plėvelės yra pagamintos iš neaustinės medžiagos.

18. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš punktų nuo 1 iki 16, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jame yra išsitempiančios sritys, sudarytos iš tarp dviejų plėvelių įdėtos elastomerinės medžiagos; elastomerinė medžiaga yra poliolefinas su muilintomis riebalų rūgštimis ir skaidumą didinančia medžiaga, kurios sudėtyje yra muilintų riebalų rūgščių bei kalcio, o plėvelės yra pagamintos iš neaustinės, maždaug 10-15 g/m^2 svorio medžiagos, sudarytos iš dvikomponenčio vidurinio sluoksnio ir apvalkalo pluošto, kur viduriniame sluoksnyje yra maždaug 80–100% polilaktidinės rūgšties, o apvalkale – 80–100% polipropileno.

19. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš punktų nuo 1 iki 16, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jame yra išsitempiančios sritys, sudarytos iš tarp dviejų plėvelių įdėtos elastomerinės medžiagos; elastomerinė medžiaga yra poliolefinas su muilintomis riebalų rūgštimis ir skaidumą didinančia medžiaga, kurios sudėtyje yra muilintų riebalų rūgščių bei kalcio, o plėvelės yra pagamintos iš neaustinės, maždaug 10-15 g/m^2 svorio medžiagos, sudarytos iš dvikomponenčio vidurinio sluoksnio ir apvalkalo pluošto, kur viduriniame sluoksnyje yra maždaug 80–100% polihidroksialkanoato, o apvalkale – 80–100% polipropileno.

20. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš punktų nuo 1 iki 17, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jame yra išsitempiančios sritys, sudarytos iš tarp dviejų plėvelių įdėtos elastomerinės medžiagos; elastomerinė medžiaga yra poliolefinas su muilintomis riebalų rūgštimis ir skaidumą didinančia medžiaga, kurios sudėtyje yra muilintų riebalų rūgščių bei kalcio, o plėvelės yra pagamintos iš neaustinės, maždaug 10-15 g/m^2 medžiagos, kurios sudėtyje yra bent 20% medvilnės pluošto.

21. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jame yra odos priežiūros preparato, kurio sudėtyje yra augalinių aliejų, daugiausiai – avokadų ir saldžiųjų migdolų aliejaus.

22. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jame yra odos priežiūros preparato, kurio sudėtyje yra eterinių aliejų mišinio.

23. Vienkartinis sugeriamasis gaminys, aprašytas bet kuriame iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jame yra chlorofilo arba jo darinių, atliekančių dezodoranto funkciją.

---

(51) Int.Cl. ***A61M 37/00*** (2006.01)
G10K 15/04 (2006.01)
(11) **2699304**
(96) 12723274.2
(96) 2012-04-19
(97) 2014-02-26

(97) 2015-12-16
(86) PCT/PT2012/000013
(86) 2012-04-19
(87) WO 2012/144916
(87) 2012-10-26
(30) 2011105635, 2011-04-19, PT
(72) FERREIRA DE S , Gonēalo Fernando, PT
DE SERPA SOARES, Carlos Alberto Lourenēo, PT
DA SILVA ARNAUT MOREIRA, Lu s Guilherme, PT
(73) Universidade De Coimbra, 3004-531 Coimbra, PT
(74) Stanislava TELEIŠIENĖ, 31, UAB „Brainera“, Savanorių pr. 217, LT-02300 Vilnius, LT
(54) Įrenginys efektyviam junginių perdavimui į arba per odą arba biologinį barjerą naudojant šviesą sugeriančias plonas plėveles

Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 1.

(57) 1. Atitinkamo impulsinio lazerio šaltinio (2) skleidžiamo lazerio impulso (1) energijos keitimo į galingo impulso ir plačiajuostį trumpalaikį akustinį signalą įrenginys, galintis padėti perduoti bent vieną tinkamos farmakologinės formulės junginį (A) į arba per tikslinį biologinį barjerą (B), įskaitant odą ar minkštuosius audinius,

charakterizuojamas

tuo, kad minėtojo lazerio impulso (1) optinės galios tankio diapazonas yra nuo 0,1 iki 40 MW/cm2 ir geriausia, kai jis yra nuo l iki 10 MW/cm2,

minėtąjį įrenginį sudaro:

– plonas keitimo medžiagos sluoksnis (4), įskaitant bent vieną molekulinę sistemą, kuriame molekulinė sistema sugeria bent dalį energijos, tiekiamos minėtojo lazerio impulso (1), ir minėtoje keitimo medžiagoje dėl termotampriojo plėtimosi ir (arba) struktūrinio tūrinio plėtimosi ir (arba) fotoskaidymosi sugeneruoja galingo impulso ir plačiajuostį trumpalaikį garsinį signalą;

– konstrukcinis ir (arba) jungiamasis elementas (6), išdėstytas taip, kad ploną keitimo medžiagos sluoksnį (4) ir, pageidautina, lango elementą (3) ir laikantįjį elementą (5) laikytų gerai prigludusius vieną prie kito ir taip užtikrintų akustinį ryšį tarp visų šių trijų dalių;

– minėtasis impulsinio lazerio šaltinis (2), išdėstytas taip, kad ploną keitimo medžiagos sluoksnį (4) gerai apšviestų minėtuoju lazerio impulsu (1), ir minėtojo lazerio impulso (1) bangos ilgis būtų toks, kad jį gerai sugertų minėtasis plonas keitimo medžiagos sluoksnis (4).

2. Įrenginys pagal 1 punktą, charakterizuojamas tuo, kad plonas keitimo medžiagos sluoksnis (4) yra nanokristalinio mezoskopinio oksido arba chalkogenido dalelių su dideliais vidinio paviršiaus plotais plėvelė, kurioje yra bent vieno, sugerto ant nanodalelių, fotoakustinio etaloninio junginio sluoksnis, kur minėtasis fotoakustinis etaloninis junginys sugeria bent dalį lazerio impulso (1).

3. Įrenginys pagal 1 punktą, charakterizuojamas tuo, kad plonas keitimo medžiagos sluoksnis (4) yra polimerų plėvelė, kurioje yra bent vienas fotoakustinis etaloninis junginys, kur minėtasis fotoakustinis etaloninis junginys sugeria bent dalį lazerio impulso (1).

4. Įrenginys pagal 1 punktą, charakterizuojamas tuo, kad plonas keitimo medžiagos sluoksnis (4) yra tirpalo sluoksnis, kuriame yra bent viena molekulinė sistema, sugerianti bent dalį lazerio impulso (1), ir pageidautina, kad tirpiklis būtų itin termotamprus, bent jau atitinkantis Grüneiseno parametrą.

5. Įrenginys pagal 1 punktą, charakterizuojamas tuo, kad plonas keitimo medžiagos sluoksnis (4) yra polimerų plėvelė, kurios abliacija prasideda, pageidautina, esant mažesniam nei 50 mJ/cm² nanosekundinių impulsinių lazerių įtėkiui.

6. Įrenginys pagal bet kurį iš 1–5 punktų, charakterizuojamas tuo, kad plono keitimo medžiagos sluoksnio (4) storis yra nuo 0,01 iki 400 μm, pageidautina, nuo 0, 1 iki 20 μm, ir įrenginį dar sudaro tarp minėtojo plono keitimo medžiagos sluoksnio (4) ir minėtojo impulsinio lazerio šaltinio (2) esantis lango elementas (3); minėtasis lango elementas (3) yra labai tvirtas ir labai laidus minėtajam lazerio impulsui (1), o jo kompleksinė akustinė varža yra didelė plono keitimo medžiagos sluoksnio (4) atžvilgiu, ir lango elementas riboja trumpalaikio garso plitimą ar prasiskverbimą savo pusėje su plonu keitimo medžiagos sluoksniu (4).

7. Įrenginys pagal bet kurį iš 1–5 punktų, charakterizuojamas tuo, kad plonas keitimo medžiagos sluoksnis (4) keitimo medžiagos pirmuosiuose gylio 100 μm sugeria daugiau nei 99 % krintančio lazerio impulso, kai keitimo medžiagą

veikia minėtasis lazerio impulsas (1), pageidautina, infraraudonųjų spindulių, kurie skatina elektroninį ir (arba) vibracinį ir (arba) rotacinį minėtojo plono keitimo medžiagos sluoksnio (4) sužadinimą ir įrenginyje papildomai yra lango elementas (3).

8. Įrenginys pagal bet kurį iš 1–7 punktų, charakterizuojamas tuo, kad įrenginio lazerio šaltinis (2) generuoja lazerio impulsus, kurių trukmė nuo 0,1 iki 100 ns, pageidautina, nuo 0,5 iki 20 ns.

9. Įrenginys pagal bet kurį iš 1–7 punktų, charakterizuojamas tuo, kad impulsinio lazerio šaltinis (2) per vieną impulsą generuoja nuo 0,1 iki 100 mJ/cm2 energijos, pageidautina nuo 0,5 iki 50 mJ/cm2.

10. Įrenginys pagal bet kurį iš 1–9 punktų, charakterizuojamas tuo, kad jį taip pat sudaro laikantysis elementas (5), kuris lango elemento (3) atžvilgiu yra kitoje plono keitimo medžiagos sluoksnio (4) pusėje, tarp plono keitimo medžiagos sluoksnio (4) ir tikslinio biologinio barjero (B); minėtasis laikantysis elementas (5) išvengia tiesioginės lazerio spinduliuotės, specialiai apsaugo minėtąjį tikslinį biologinį barjerą (B) nuo tiesioginės lazerio spinduliuotės, ir turi iš anksto nustatytą kompleksinę akustinę varžą, specialiai pritaikytą tikslinio biologinio barjero (B) diapazonui ir (arba) artimą jam ir pasižymi tokiomis veidrodinėmis savybėmis, kad didelę lazerio impulso (1) dalį, kuri nebuvo sugerta minėtojo plono sluoksnio (4), atspindi atgal per minėtąjį ploną sluoksnį (4) ir minėtąjį lango elementą (3), ir taip sukuria antrąją lazerio impulso (1) pereigą per įrenginį.

11. Įrenginys pagal bet kurį iš 1–10 punktų, charakterizuojamas tuo, kad laikančiojo elemento (5), papildomai veidrodinio, storis yra nuo 0,1 iki 10 mm, geriausiai, nuo 0,2 iki 2 mm.

12. Įrenginys pagal bet kurį iš 1–10 punktų, charakterizuojamas tuo, kad konstrukcinis ir (arba) jungiamasis elementas (6) gali būti labai tvirta arba lanksti konstrukcija, arba sandarinimo medžiaga, arba klijai.

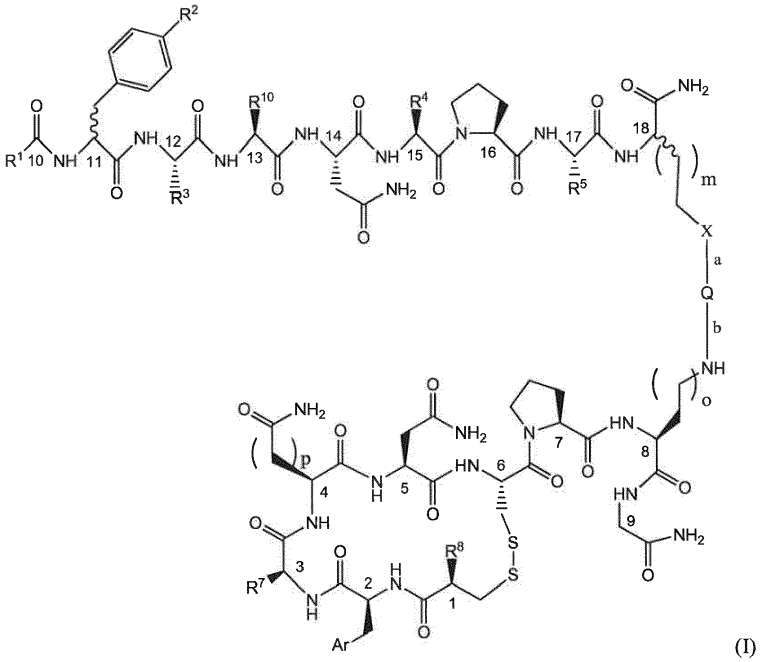
13. Įrenginys pagal bet kurį iš 1–12 punktų, charakterizuojamas tuo, kad jį taip pat sudaro optinis kreipiklis (7), galintis gerokai pakreipti lazerio impulsą (1) iš minėtojo impulsinio lazerio šaltinio (2) į minėtąjį ploną keitimo medžiagos sluoksnį (4); pageidautina, optinis kreipiklis (7) yra bent viena optinė skaidula, kurios artimasis galas, sujungtas su impulsinio lazerio šaltiniu (2), o tolimasis galas nukreiptas į lango elementą (3).

14. Įrenginys pagal bet kurį iš 1–13 punktų, charakterizuojamas tuo, kad, optinis kreipiklis (7) yra judinamas arba nukreiptas į judinamą optinį įtaisą, ir, valdant iš išorės ar nuotoliniu būdu, įskaitant konstrukcinio elemento (6) priemones, lazerio impulsus (1) nukreipia į mažesnes ir įvairias plono sluoksnio (4) dalis, sugeriančias bent dalį lazerio impulso (1); taigi lazerio impulsų seka sugeriama skirtingose dalyse, tačiau didžioji plono sluoksnio dalis (4) veikiama spinduliuotės.

---

(51) Int.Cl. ***A61P 1/16*** (2016.01)
A61P 9/02 (2006.01)
(11) **2847210**
(96) 13729826.1
(96) 2013-05-09
(97) 2015-03-18
(97) 2016-02-17
(86) PCT/US2013/040414
(86) 2013-05-09
(87) WO 2013/170077
(87) 2013-11-14
(30) 201261645558 P, 2012-05-10, US
(72) WISNIEWSKI, Kazimierz, US
HARRIS, Geoffrey S., US
GALYEAN, Robert Felix, US
(73) Ferring BV, 2132 JX Hoofddorp, NL
(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
(54) V1A receptoriaus agonistai
Apibrėžties punktai: 11, brėžiniai: 0.

(57) 1. Junginys, kurio formulė (I):



(I)

arba jo druska, kur:

R^1 yra parinkta iš (C_1-C_{10})alkilo, (C_1-C_{10})alkoksi, (C_1-C_{10})alkilNH, Ar^1-L^1- ir nepakeisto arba pakeisto cikloalkilo,

Ar^1-L^1- yra parinkta iš Ar^1-, Ar^1-CH_2-, Ar^1-CH_2CH_2-, Ar^1-O-, Ar^1-CH_2O-, Ar^1-NH- ir Ar^1-CH_2NH-;

Ar^1 yra nepakeistas arilas arba pakeistas arilas;

R^2 yra parinkta iš vandenilio, (C_1-C_6)alkilo, hidroksi, (C_1-C_6)alkoksi ir halogeno;

R^3 yra parinkta iš (C_1-C_6)alkilo, nepakeisto arba pakeisto cikloalkilo ir Cy^3-CH_2-;

Cy^3- yra nepakeistas arba pakeistas arilas arba nepakeistas arba pakeistas cikloalkilas;

R^4 yra parinkta iš (C_1-C_6)alkilo, (C_2-C_6)alkenilo, (C_2-C_6)alkinilo, (C_1-C_6)haloalkilo, -((C_1-C_6)alkilen)-OR^{4a}, -((C_1-C_6)alkilen)-$NR^{4a}{}_2$, -((C_1-C_6)alkilen)-S(C_1-C_6)alkilo, -((C_1-C_6)alkilen)-C(=O)$OR^{4a}{}_2$, -((C_1-C_6)alkilen)-C(=O)$NR^{4a}{}_2$, -((C_1-C_6)alkilen)-C(=NR^{4a})$NR^{4a}{}_2$, -((C_1-C_6)alkilen)-OC(=O)R^{4a}, -((C_1-C_6)alkilen)-OC(=O)OR^{4a}, -((C_1-C_6)alkilen)-OC(=O)$NR^{4a}{}_2$, -((C_1-C_6)alkilen)-NR^{4a}C(=O)R^{4a}, -((C_1-C_6)alkilen)-NR^{4a}C(=O)OR^{4a}, -((C_1-C_6)alkilen)-NR^{4a}C(=O)$NR^{4a}{}_2$, -((C_1-C_6)alkilen)-NR^{4a}C(=NR^{4a})$NR^{4a}{}_2$, Ar^4 ir -((C_1-C_6)alkilen)-Ar^4;

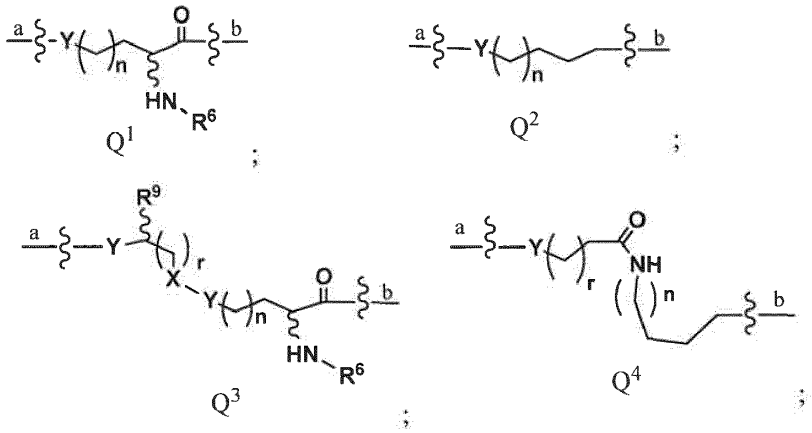
kiekviena R^{4a} nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio ir (C_1-C_6)alkilo;

Ar^4 yra parinkta iš nepakeisto arba pakeisto arilo ir nepakeisto arba pakeisto heteroarilo;

R^5 yra parinkta iš -((C_1-C_6)alkilen)-$NR^{5a}{}_2$ ir -((C_1-C_6)alkilen)-NR^{5a}C(=NR^{5a})$NR^{5a}{}_2$;

kiekviena R^{5a} nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio ir (C_1-C_6)alkilo;

Q yra parinkta iš Q^1, Q^2, Q^3 ir Q^4 grupių:



a ir b reiškia jungtis, jungiančias Q prie molekulės liekanos;

R^6 yra parinkta iš vandenilio, $(C_1\text{-}C_6)$alkilo ir -C(=NR^{6a})NR^{6a}_2; kiekviena R^{6a} yra vandenilis arba $(C_1\text{-}C_6)$alkilas;

R^7 yra parinkta iš $(C_1\text{-}C_6)$alkilo, nepakeisto arilo, pakeisto arilo, nepakeisto cikloalkilo ir pakeisto cikloalkilo;

R^8 yra parinkta iš NH_2 ir hidroksilo;

R^9 yra parinkta iš vandenilio, $(C_1\text{-}C_6)$alkilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkenilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkinilo, $(C_1\text{-}C_6)$haloalkilo, -((C_1-C_6)alkilen)-OR^{9a}, -((C_1-C_6)alkilen)-NR^{9a}_2, -((C_1-C_6)alkilen)-SR^{9a}, -((C_1-C_6)alkilen)-C(=O)OR^{9a}_2, -((C_1-C_6)alkilen)-C(=O)NR^{9a}_2, -((C_1-C_6)alkilen)-C(=NR^{9a})NR^{9a}_2, -((C_1-C_6)alkilen)-OC(=O)R^{9a}, -((C_1-C_6)alkilen)-OC(=O)OR^{9a}, -((C_1-C_6)alkilen)-OC(=O)NR^{9a}_2, -((C_1-C_6)alkilen)-NR^{9a}C(=O)R^{9b}, -((C_1-C_6)alkilen)-NR^{9a}C(=O)OR^{9a}, -((C_1-C_6)alkilen)-NR^{9a}C(=O)NR^{9a}_2, -((C_1-C_6)alkilen)-NR^{9a}C(=NR^{9a})NR^{9a}_2, Ar^9 ir -((C_1-C_6)alkilen)-Ar^9;

kiekviena R^{9a} nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio ir $(C_1\text{-}C_6)$alkilo;

kiekviena R^{9b} nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio ir $(C_1\text{-}C_{10})$alkilo;

Ar^9 yra parinkta iš nepakeisto arilo, pakeisto arilo, nepakeisto heteroarilo, pakeisto heteroarilo;

R^{10} yra parinkta iš -((C_1-C_6)alkilen)-OR^{10a}, -((C_1-C_6)alkilen)-C(=O)NR^{10a}_2 ir Ar^{10}-CH_2-;

Ar^{10} yra nepakeistas heteroarilas arba pakeistas heteroarilas;

kiekviena R^{10a} yra parinkta iš vandenilio ir $(C_1\text{-}C_6)$alkilo;

Ar yra parinkta iš arilo arba pakeisto arilo;

kiekviena X yra NH ir kiekviena Y yra C=O; arba

kiekviena X yra C=O ir kiekviena Y yra NH;

m yra 0, 1, 2, 3, 4 arba 5;

n yra 0, 1, 2, 3 arba 4;

o yra 1 arba 2;

p yra 1, 2 arba 3; ir

r yra 0, 1, 2, 3, 4, 5 arba 6; su sąlyga, kad R^9 yra vandenilis, jeigu r yra didesnis, negu vienas.

2. Junginys arba jo druska pagal 1 punktą, kur:

R^1 yra parinkta iš $(C_1\text{-}C_{10})$alkilo, $(C_1\text{-}C_{10})$alkoksi, $(C_1\text{-}C_{10})$alkilNH, Ar^1-L^1- ir Cy^1;

Cy^1 yra nepakeistas cikloalkilas arba cikloalkilas, pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš $(C_1\text{-}C_6)$alkilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkenilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkinilo, halogeno, $(C_1\text{-}C_6)$haloalkilo, -OR^{1a} ir okso;

Ar^1 yra nepakeistas arilas arba arilas, pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš $(C_1\text{-}C_6)$alkilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkenilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkinilo, halogeno, $(C_1\text{-}C_6)$haloalkilo, -CN, -NO_2, -OR^{1a}, -NR^{1a}_2 ir -NR^{1a}C(=O)R^{1a};

kiekviena R^{1a} nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio ir $(C_1\text{-}C_6)$alkilo;

Cy^3 yra Ar^3 arba nepakeistas cikloalkilas arba cikloalkilas, pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš $(C_1\text{-}C_6)$alkilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkenilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkinilo, halogeno, $(C_1\text{-}C_6)$haloalkilo, -OR^{3a} ir okso;

Ar^3- yra nepakeistas arilas arba arilas, pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš C_1-C_6)alkilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkenilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkinilo, halogeno, $(C_1\text{-}C_6)$haloalkilo, -CN, -NO_2, -OR^{3a}, -NR^{3a}_2 ir NR^{3a}C(=O)R^{3a};

kiekviena R^{3a} nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio ir $(C_1\text{-}C_6)$alkilo;

Ar^4 yra parinkta iš nepakeisto arilo, nepakeisto heteroarilo ir arilo ir heteroarilo, pakeisto 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš $(C_1\text{-}C_6)$alkilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkenilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkinilo, halogeno, $(C_1\text{-}C_6)$haloalkilo, -CN, -NO_2, -OR^{4b}, -NR^{4b}_2 ir -NR^{4b}C(=O)R^{4b};

kiekviena R^{4b} yra parinkta iš vandenilio ir $(C_1\text{-}C_6)$alkilo;

R^7 yra parinkta iš $(C_1\text{-}C_6)$alkilo, Ar^7 ir Cy^7;

Cy^7 yra nepakeistas cikloalkilas arba cikloalkilas, pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš $(C_1\text{-}C_6)$alkilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkenilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkinilo, halogeno, $(C_1\text{-}C_6)$haloalkilo, OR^{7a} ir okso;

Ar^7 yra nepakeistas arilas arba arilas, pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš $(C_1\text{-}C_6)$alkilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkenilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkinilo, halogeno, $(C_1\text{-}C_6)$haloalkilo, -CN, -NO_2, -OR^{7a}, -NR^{7a}_2 ir -NR^{7a}C(=O)R^{7a};

kiekviena R^{7a} nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio ir $(C_1\text{-}C_6)$alkilo;

Ar^9 yra parinkta iš nepakeistas arilo, nepakeisto heteroarilo ir arilo ir heteroarilo, pakeisto 1, 2 arba 3 pakaitais, parinktais iš $(C_1\text{-}C_6)$alkilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkenilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkinilo halogeno, $(C_1\text{-}C_6)$haloalkilo, -CN, -NO_2, -OR^{9c}, -NR^{9c}_2 ir -NR^{9c}C(=O)R^{9c};

kiekviena R^{9c} yra parinkta iš vandenilio ir $(C_1\text{-}C_6)$alkilo;

Ar^{10} yra parinkta iš nepakeisto heteroarilo ir heteroarilo, pakeisto 1, 2 arba 3 pakaitais, parinktais iš $(C_1\text{-}C_6)$alkilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkenilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkinilo, halogeno, $(C_1\text{-}C_6)$haloalkilo, -CN, -NO_2, -OR^{10b}, -NR^{10b}_2 ir -NR^{10b}C(=O)R^{10b};

kiekviena R^{10b} nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio ir $(C_1\text{-}C_6)$alkilo;

Ar yra parinkta iš nepakeisto arilo ir arilo, pakeisto 1, 2 arba 3 pakaitais, parinktais iš $(C_1\text{-}C_6)$alkilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkenilo, $(C_2\text{-}C_6)$alkinilo, halogeno, $(C_1\text{-}C_6)$haloalkilo, -CN, -NO_2, -OR^{Ar}, -NR^{Ar}_2 ir -NR^{Ar}C(=O)R^{Ar}; ir

kiekviena R^{Ar} nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio ir $(C_1\text{-}C_6)$alkilo.

3. Junginys arba jo druska pagal bet kurį iš 1 ir 2 punktų, kur R^1 yra (C_1-C_{10})alkilas, (C_5-C_7)cikloalkilas, Ar^1-CH_2-, izobutilas, *n*-heksilas, cikloheksilas arba benzilas; ir/arba kur R^2 yra parinkta iš hidroksi, (C_1-C_6)alkoksi, halogeno ir metoksi; ir/arba kur R^3 yra parinkta iš (C_1-C_6)alkilo ir Ar^3-CH_2-, kur Ar^3- yra nepakeistas arba pakeistas arilas; ir/arba kur Ar^3 yra nepakeistas arilas, halo pakeistas arilas arba fenilas; ir/arba kur R^3 yra parinkta iš (C_1-C_6)alkilo ir Ar^3-CH_2-, kur Ar^3 yra fenilas arba halo pakeistas fenilas, pavyzdžiui, kur R^3 yra parinkta iš s-butilo, neopentilo, benzilo ir 4-chlorbenzilo; ir/arba kur R^4 yra parinkta iš (C_1-C_6)alkilo, -((C_1-C_6)alkilen)-OR^{4a}, -((C_1-C_6)alkilen)-$NR^{4a}{}_2$, -((C_1-C_6)alkilen)-C(=O)$NR^{4a}{}_2$, -((C_1-C_6)alkilen)-NR^{4a}C(=O)$NR^{4a}{}_2$, -((C_1-C_6)alkilen)-NR^{4a}C(=NR^{4a})$NR^{4a}{}_2$ ir -((C_1-C_6)alkilen)-Ar^4; ir/arba kur R^4 yra parinkta iš (C_1-C_6)alkilo, -$(CH_2)_{1-6}$-OR^{4a}, -$(CH_2)_{1-6}$-$NR^{4a}{}_2$, -$(CH_2)_{1-6}$-C(=O)$NR^{4a}{}_2$, -$(CH_2)_{1-6}$-NR^{4a}C(=O)$NR^{4a}{}_2$, -$(CH_2)_{1-6}$-NR^{4a}C(=NR^{4a})$NR^{4a}{}_2$ ir -$(CH_2)_{1-6}$-Ar^4, pavyzdžiui, kur R^4 yra parinkta iš (C_1-C_6)alkilo, -(CH_2)-OR^{4a}, -$(CH_2)_{2-4}$-$NR^{4a}{}_2$, -$(CH_2)_{1-3}$-C(=O)$NR^{4a}{}_2$, -$(CH_2)_{2-4}$-NR^{4a}C(=O)$NR^{4a}{}_2$, -$(CH_2)_{2-4}$-NR^{4a}C(=NR^{4a})$NR^{4a}{}_2$ ir -(CH_2)-Ar^4; ir/arba kur Ar^4 yra nepakeistas heteroarilas, imidazolilas arba indolilas; ir/arba kur kiekviena R^{4a} nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio ir metilo; ir/arba kur kiekviena R^{4a} yra vandenilis; ir/arba kur R^4 yra parinkta iš Me, izobutilo, -CH_2OH, -$(CH_2)_2$-NH_2, -$(CH_2)_3$-NH_2, -$(CH_2)_4$-NH_2, -$(CH_2)_2$-C(=O)NH_2, -$(CH_2)_3$-NHC(=NH)NH_2, -$(CH_2)_3$-NHC(=O)NH_2 ir -CH_2(1H-imidazol-4-il); ir/arba kur R^5 yra parinkta iš -$(CH_2)_{1-6}$-$NR^{5a}{}_2$ ir - $(CH_2)_{1-6}$-NR^{5a}C(=NR^{5a})$NR^{5a}{}_2$; ir/arba kur kiekviena R^{5a} nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio ir metilo; ir/arba kur kiekviena R^{5a} yra vandenilis; ir/arba kur R^5 yra -$(CH_2)_2$-NH_2, -$(CH_2)_3$-NH_2, -$(CH_2)_4$-NH_2 arba -$(CH_2)_3$-NHC(=NH)NH_2; ir/arba kur R^7 yra (C_1-C_6)alkilas, (C_4-C_7)cikloalkilas-butilas; ir/arba kur R^{10} yra parinkta iš -$(CH_2)_{1-6}$-C(=O)$NR^{10a}{}_2$ ir Ar^{10}-CH_2-; ir/arba kur Ar^{10} yra nepakeistas heteroarilas ir/arba piridilas; ir/arba kur kiekviena R^{10a} yra vandenilis arba metilas, pavyzdžiui, kur kiekviena R^{10a} yra vandenilis; ir/arba kur R^{10} yra parinkta iš 1-hidroksietilo, -$(CH_2)_2$-C(=O)NH_2 ir 3-piridil-CH_2-; ir/arba kur Ar yra fenilas arba pakeistas fenilas.

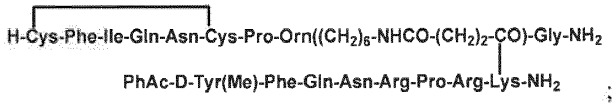
4. Junginys arba jo druska pagal bet kurį iš 1 – 3 punktų, kur Q yra Q^1 ir kur n yra 1, 2 arba 3; ir/arba kur Q^1 yra ^{a}-$NH(CH_2)_4CH(NH_2)$-C(=O)-^{b}, ^{a}-$NH(CH_2)_4CH(NHC(=NH)NH_2)$-C(=O)-^{b} ^{a}-C(=O)$(CH_2)_2CH(NH_2)$-C(=O)-^{b}, ^{a}-$NH(CH_2)_4C^{(S)}H(NH_2)$-C(=O)-^{b}, ^{a}-$NH(CH_2)_4C^{(S)}H(NHC(=NH)NH_2)$-C(=O)-^{b} arba ^{a}-C(=O)$(CH_2)_2C^{(S)}H(NH_2)$-C(=O)-^{b} arba ^{a}-C(=O)$(CH_2)_2C^{(R)}H(NH_2)$-C(=O)-^{b}.

5. Junginys arba jo druska pagal bet kurį iš 1 – 3 punktų, kur Q yra Q^3, ir kur n yra 3; ir/arba kur r yra 0; ir/arba kur R^9 yra parinkta iš vandenilio, (C_1-C_6)alkilo, (C_2-C_6)alkenilo, (C_2-C_6)alkinilo, (C_1-C_6)haloalkilo, -$(CH_2)_{1-6}$-OR^{9a}, -$(CH_2)_{1-6}$-$NR^{9a}{}_2$, -$(CH_2)_{1-6}$-SR^{9a}, -$(CH_2)_{1-6}$-C(=O)$OR^{9a}{}_2$, -$(CH_2)_{1-6}$-C(=O)$NR^{9a}{}_2$, -$(CH_2)_{1-6}$--C(=NR^{9a})$NR^{9a}{}_2$, -$(CH_2)_{1-6}$-OC(=O)R^{9b}, -$(CH_2)_{1-6}$-OC(=O)OR^{9a}, -$(CH_2)_{1-6}$-OC(=O)$NR^{9a}{}_2$, -$(CH_2)_{1-6}$-NR^{9a}C(=O)R^{9b}, -$(CH_2)_{1-6}$-NR^{9a}C(=O)OR^{9a}, -$(CH_2)_{1-6}$-NR^{9a}C(=O)$NR^{9a}{}_2$, -$(CH_2)_{1-6}$-NR^{9a}C(=NR^{9a})$NR^{9a}{}_2$, Ar^9 ir -$(CH_2)_{1-6}$--Ar^9; ir/arba kur R^9 yra parinkta iš -((C_1-C_6)alkilen)-C(=O)$NR^{9a}{}_2$ ir -((C_1-C_6)alkilen)-NR^{9a}C(=O)R^{9b}; ir/arba kur R^9 yra parinkta iš -$(CH_2)_{1-6}$-$NR^{9a}{}_2$ ir -$(CH_2)_{1-6}$-NR^{9a}C(=O)R^{9b}; ir/arba kur kiekviena R^{9b} nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio ir (C_1-C_6)alkilo; ir/arba kur kiekviena R^{9a} yra vandenilis; ir/arba kur r yra 3; ir/arba kur R^6 yra vandenilis arba -C(=NR^{6a})$NR^{6a}{}_2$; ir/arba kur R^{6a} yra vandenilis arba metilas; ir/arba kur mažiausiai dvi R^{6a} yra vandeniliai; ir/arba kur kiekviena R^{6a} yra vandenilis; ir/arba kur R^6 yra vandenilis arba -C(=NH)NH_2; ir/arba kur Q^3 yra ^{a}-$NH(CH_2)_4$-C(=O)-NH-$(CH_2)_4CH(NH_2)$-C(=O)^b, ^{a}-NHCH($(CH_2)_4NH_2$)-C(=O)-NH-$(CH_2)_4CH(NH_2)$- arba ^{a}-NHCH($(CH_2)_4$NHHeptanoil)-C(=O)-NH-$(CH_2)_4CH(NH_2)$-C(=O)-^{b}; ir/arba kur Q^3 yra ^{a}-$NH(CH_2)_4$-C(=O)-NH-$(CH_2)_4C^{(S)}H(NH_2)$-C(=O)^b, ^{a}-$NHC^{(S)}H((CH_2)_4NH_2)$-C(=O)-NH-$(CH_2)_4C^{(S)}H(NH_2)$-C(=O)-^{b}, ^{a}-$NHC^{(S)}H((CH_2)_4$NHAc)-C(=O)-NH-$(CH_2)_4C^{(S)}H(NH_2)$-C(=O)-^{b}, ^{a}-$NHC^{(S)}H((CH_2)_4$NHAc)-C(=O)-NH-$(CH_2)_4C^{(R)}H(NH_2)$-C(=O)- arba ^{a}-$NHC^{(S)}H((CH_2)_4$NHHeptanoil)-C(=O)-NH-$(CH_2)_4C^{(S)}H(NH_2)$-C(=O)-^{b}.

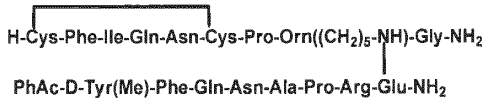
6. Junginys arba jo druska pagal bet kurį iš 1 – 3 punktų, kur Q yra Q^2, ir kur n yra 0, 1, 2 arba 3 ir/arba kur Q^2 yra ^{a}-$NH(CH_2)_4$-^{b}, ^{a}-$NH(CH_2)_5$-^{b}, ^{a}-$NH(CH_2)_6$-b, ^{a}-C(=O)-$(CH_2)_3$-^{b} arba ^{a}-C(=O)-$(CH_2)_5$-^{b}.

7. Junginys arba jo druska pagal bet kurį iš 1 – 3 punktų, kur Q yra Q^4, ir kur n yra 1, 2 arba 3, ir/arba kur r yra 1, 2 arba 3; ir/arba kur Q^4 yra ^{a}-NH-$(CH_2)_2$-C(=O)-NH-$(CH_2)_5$-^{b}, ^{a}-NH-$(CH_2)_4$-C(=O)-NH-$(CH_2)_6$-^{b}, ^{a}-C(=O)-$(CH_2)_2$-C(=O)-NH-$(CH_2)_6$-^{b} arba ^{a}-C(=O)-$(CH_2)_3$-C(=O)-NH-$(CH_2)_4$-^{b}.

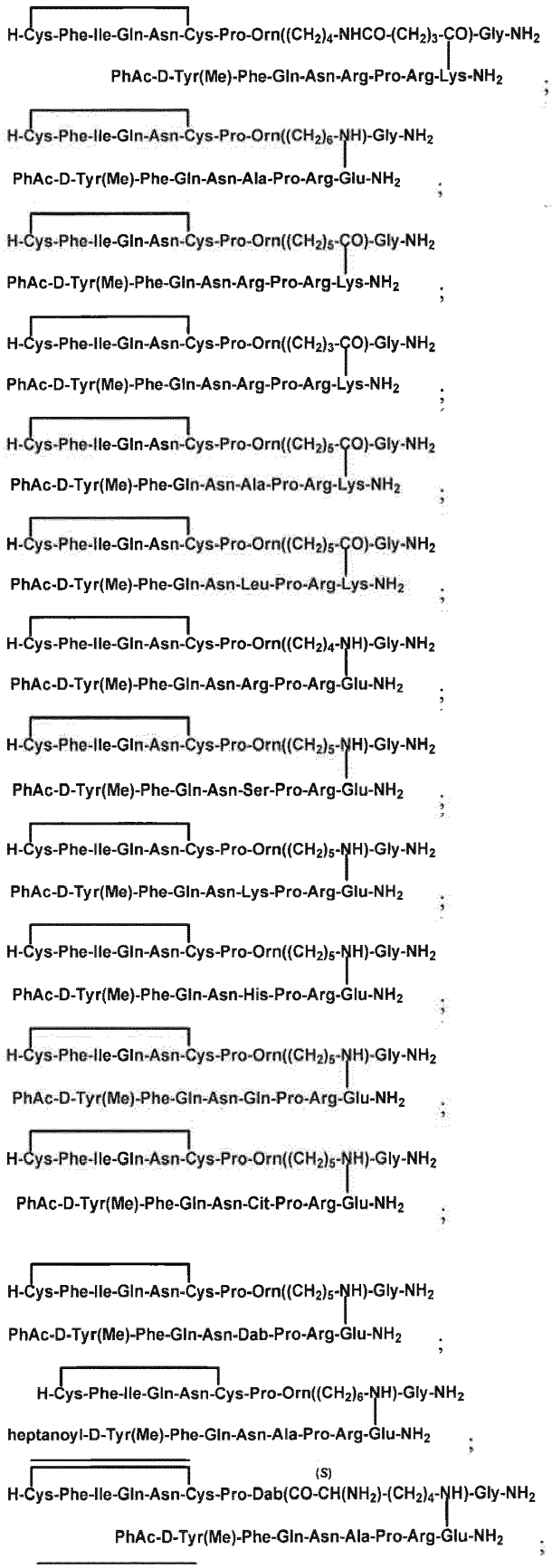
8. Junginys, parinktas iš šių formulių junginių ir jų druskų:

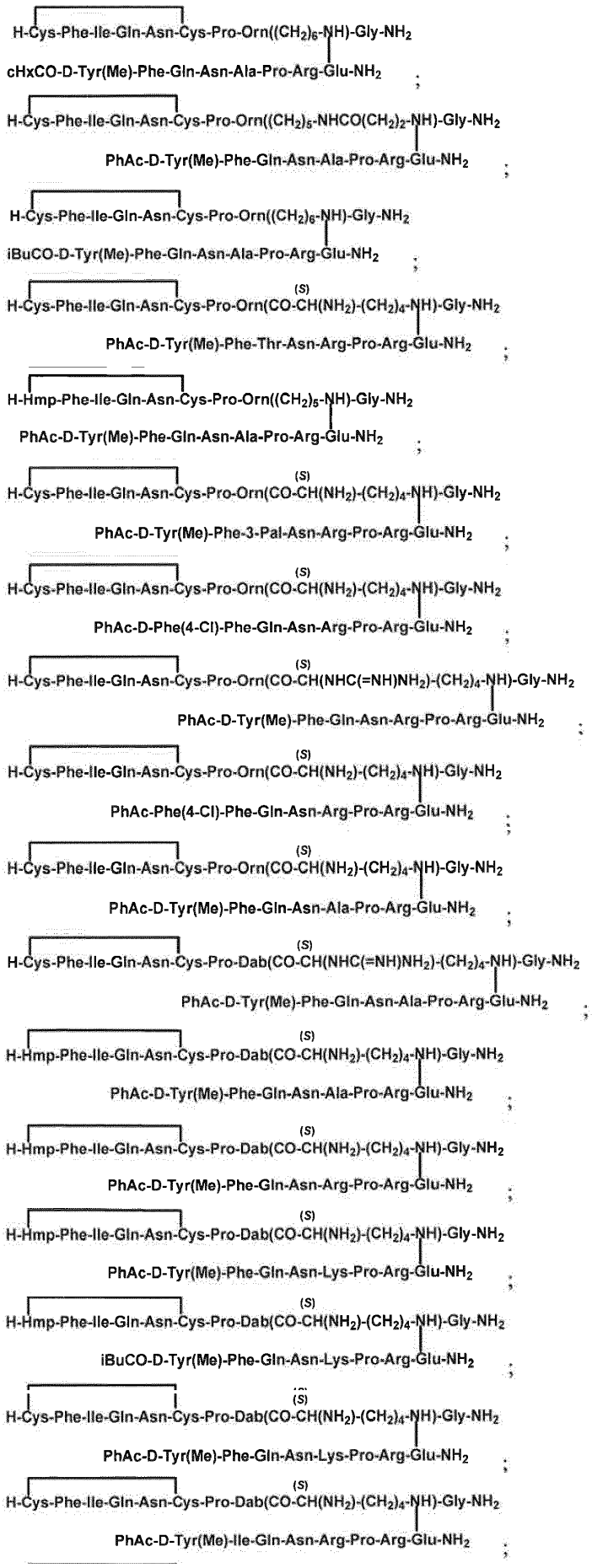


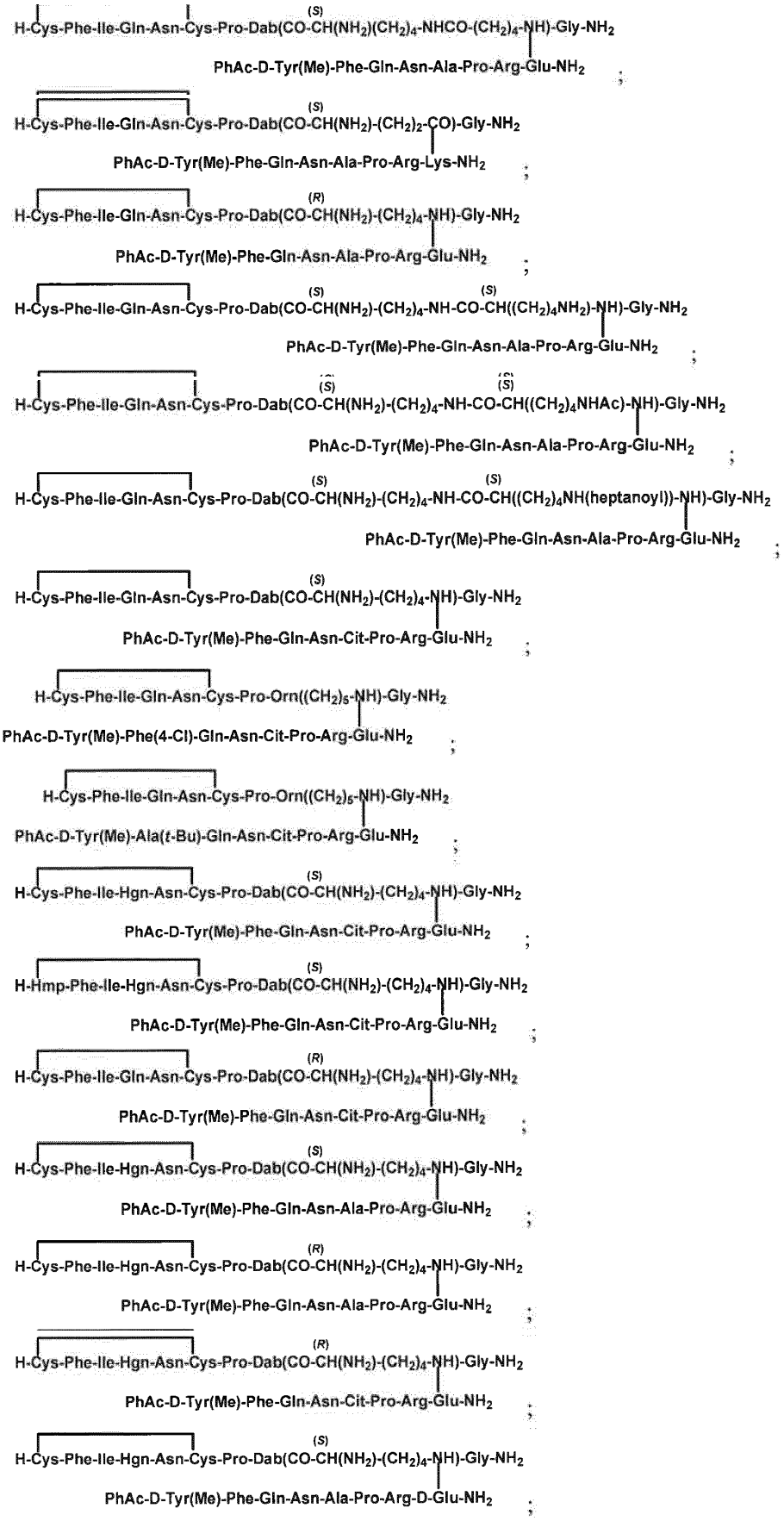
;

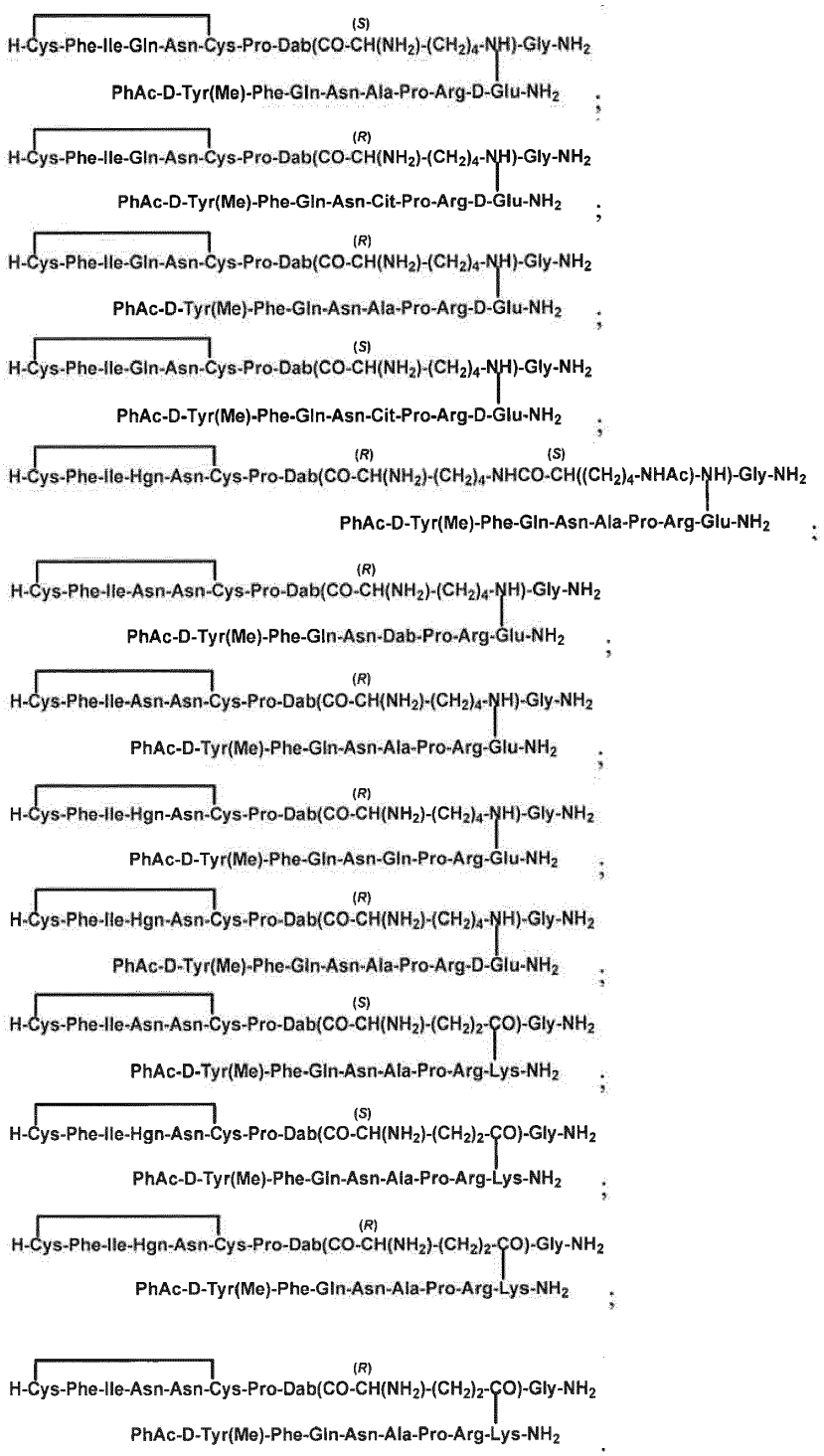


;


H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)4-NHCO-(CH2)3-CO)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Arg-Pro-Arg-Lys-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)6-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)5-CO)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Arg-Pro-Arg-Lys-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)3-CO)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Arg-Pro-Arg-Lys-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)5-CO)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Lys-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)5-CO)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Leu-Pro-Arg-Lys-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Arg-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)5-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ser-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)5-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Lys-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)5-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-His-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)5-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Gln-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)5-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Cit-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)5-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Dab-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)6-NH)-Gly-NH2
heptanoyl-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
(S)
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2 ;


H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)6-NH)-Gly-NH2
cHxCO-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)5-NHCO(CH2)2-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)6-NH)-Gly-NH2
iBuCO-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Thr-Asn-Arg-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Hmp-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)5-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-3-Pal-Asn-Arg-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Phe(4-Cl)-Phe-Gln-Asn-Arg-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn(CO-CH(NHC(=NH)NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Arg-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-Phe(4-Cl)-Phe-Gln-Asn-Arg-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NHC(=NH)NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Hmp-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Hmp-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Arg-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Hmp-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Lys-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Hmp-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
iBuCO-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Lys-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Lys-Pro-Arg-Glu-NH2 ;
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Ile-Gln-Asn-Arg-Pro-Arg-Glu-NH2 ;


H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)(CH2)4-NHCO-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)2-CO)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Lys-NH2
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH-CO-CH((CH2)4NH2)-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH-CO-CH((CH2)4NHAc)-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH-CO-CH((CH2)4NH(heptanoyl))-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Cit-Pro-Arg-Glu-NH2
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)5-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe(4-Cl)-Gln-Asn-Cit-Pro-Arg-Glu-NH2
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Orn((CH2)5-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Ala(t-Bu)-Gln-Asn-Cit-Pro-Arg-Glu-NH2
H-Cys-Phe-Ile-Hgn-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Cit-Pro-Arg-Glu-NH2
H-Hmp-Phe-Ile-Hgn-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Cit-Pro-Arg-Glu-NH2
H-Cys-Phe-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Cit-Pro-Arg-Glu-NH2
H-Cys-Phe-Ile-Hgn-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2
H-Cys-Phe-Ile-Hgn-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-Glu-NH2
H-Cys-Phe-Ile-Hgn-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Cit-Pro-Arg-Glu-NH2
H-Cys-Phe-Ile-Hgn-Asn-Cys-Pro-Dab(CO-CH(NH2)-(CH2)4-NH)-Gly-NH2
PhAc-D-Tyr(Me)-Phe-Gln-Asn-Ala-Pro-Arg-D-Glu-NH2



ir

9. Farmacinė kompozicija, apimanti junginį pagal bet kurį iš 1-8 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską ir farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį.

10. Junginys pagal bet kurį iš 1-8 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti dėl cirozės atsirandančios komplikacijos gydymui, pavyzdžiui, skirti panaudoti komplikacijos gydymui, kur kraujospūdžio padidinimas yra terapiniu požiūriu naudingas, arba skirti panaudoti komplikacijos, kuri yra spontaninis bakterinis peritonitas, II tipo hepatorenalinis sindromas (HRS2) arba refraktoriniai ascitai, gydymui.

11. Junginys pagal bet kurį iš 1-8 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti padidinto kraujospūdžio gydymui, arba skirti panaudoti ligos parinktos iš hipovoleminio šoko; vazodiliatacinio šoko;

kraujuojančių ezofaginių išsiplėtusių venų varices; hepatorenalinio sindromo; I tipo hepatorenalinio sindromo; II tipo hepatorenalinio sindromo; anestezijos sukeltos hipotenzijos; paracentezės sukeltos cirkuliacinės disfunkcijos; intraoperacinio kraujo praradimo; ūmios hemoragijos; kraujo praradimo, susijusio su žaizdos chirurginiu išvalymu; kraujo praradimo, susijusio su epistaksiu; spontaninio bakterinio peritonito; refraktorinių ascitų; hipertenzinio gastropatinio kraujavimo; sepsio; sunkaus sepsio; septinio šoko; hipotenzijos; širdies paralyžiaus; su trauma susijusio kraujo praradimo; vazodilliatacinio šoko, sukelto širdies-plaučių šuntavimu; milrinono sukelto vazodilliatacinio šoko, esant kongestiniam širdies nepakankamumui; anafilaktio šoko; kardiovaskulinio nestabilumo sukeltos smegenų mirties; ūmaus respiracinio distreso sindromo; ūmaus plaučių pažeidimo; šoko, sukelto metformino intoksikacija; šoko, sukelto mitochondrine liga; šoko, sukelto apsinuodijimu cianidu; šoko, sukelto kraujagyslių pralaidumo sindromu, sukeltu interleukin-2, kitu citokinu, denileukino diftitoksu arba kitais imunotoksinais, arba kiaušidžių hiperstimuliaciniu sindromu; hipotenzijos, sukeltos paskutinės stadijos inkstų liga; uždegiminės žarnyno ligos; reperfuzijos pažeidimo; kūdikių respiracinio distreso sindromo; sunkaus ūmaus respiracinio sindromo; ascitų; vazodepresinės sinkopės; vazovagalinės sinkopės; toksinio šoko sindromo; ir idiopatinio sisteminio kapiliarų pralaidumo sindromo; arba skirti panaudoti kardiopulmonarinio gaivinimo pagerinimo gydymui.

---

(51) Int.Cl. ***B01D 19/00*** (2006.01)
B01D 19/02 (2006.01)
A01J 11/04 (2006.01)

(11) **2522411**

(96) 11165478.6

(96) 2011-05-10

(97) 2012-11-14

(97) 2016-01-06

(72) Magyar, Laurent, FR
Magyar, Daniel, FR

(73) Etablissements MAGYAR, 21000 Dijon, FR

(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

(54) Talpykla skysčiams surinkti

Apibrėžties punktai: 7, brėžiniai: 2.

(57) 1. Talpykla skysčiams surinkti, apimanti talpyklos korpusą (10), tinkamą skysčiams laikyti, besitęsiantį išilgai atskaitos ašies (20) ir turintį viršutinę sienelę, papildomai apimanti siurblių sistemą skysčiams pumpuoti iš išorės į talpyklos korpusą, turinčią:

- išcentrinį siurblį (30) skysčiams pumpuoti;

- nudujinimo įtaisą (40), sujungtą su išcentriniu siurbliu (30), kur nudujinimo įtaisas (40) pritaikytas oro kiekiui pumpuojamuose skysčiuose sumažinti;

- difuzorių (50) vakuumui sukurti nudujinimo įtaise (40);

b e s i s k i r i a n t i tuo, kad difuzorius (50) yra įtaisytas ant talpyklos korpuso (10) viršutinės sienelės (60) tam tikru atstumu statmena atskaitos ašiai kryptimi ne mažiau kaip per metrą virš nudujinimo įtaiso (40) ir tuo, kad talpykla turi vėdinimo liniją (11), difuzorius (50) turi išleidimo angą (52), difuzoriaus (50) išleidimo anga (52) yra sujungta su talpyklos vėdinimo linija (11).

2. Talpykla pagal pirmesnį punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad siurblių sistema turi tik vieną difuzorių (50).

3. Talpykla pagal vieną iš pirmesnių punktų, kur difuzorius (50) yra sujungtas su nudujinimo įtaisu (40) vamzdžiu (80), besitęsiančiu iš esmės statmena atskaitos ašiai (10) kryptimi.

4. Talpykla pagal pirmesnį punktą, kur vamzdis (80) yra standus.

5. Talpykla pagal 4 punktą, kur vamzdis (80) yra lankstus.

6. Talpykla pagal vieną iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad ji papildomai apima jutiklį (70) pumpuojamų skysčių kiekiui matuoti.

7. Talpykla pagal pirmesnį punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad jutiklis (70) yra magnetinis indukcinis jutiklis.

---

(51) Int.Cl. ***B08B 9/00*** (2006.01)
F02M 35/10 (2006.01)
F02M 25/00 (2006.01)
(11) **2539086**
(96) 11747818.0
(96) 2011-02-25
(97) 2013-01-02
(97) 2016-02-24
(86) PCT/US2011/000346
(86) 2011-02-25
(87) WO 2011/106097
(87) 2011-09-01
(30) 660433, 2010-02-26, US
(72) HANSON, Matthew, N., US
FANDREI, Philip, F., US
(73) Auto-Mark, Inc., Eden Prairie, MN 55347, US
(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Kryptinė vamzdžio kreipiančioji atrama
Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 9.

(57) 1. Tiekimo sistema (50) atomizuotam apdorojimo agentui (52) iškrauti į uždaros mechaninės sistemos vidų, turinti skystinančiųjų dujų įleidimo žiedą (64), sudurtą su uždėtine dujų tiekimo žarna (28) per ID/OD jungiamąją movą dujoms per dujų tiekimo žarną (28) praleisti į uždarą mechaninę sistemą išilgine kryptimi ir apimanti:

(a) slėginį indą (54), kuriame yra atomizuotas apdorojimo agentas (52) vidiniam paviršiui arba darbinei daliai, esančiai uždaros mechaninės sistemos viduje, apdoroti;

(b) lankstųjį vamzdį (70) atomizuotam apdorojimo agentui (52) tiekti iš indo (54) į uždarą mechaninę sistemą; ir

(c) kur atomizuotas apdorojimo agentas (52) yra tiekiamas per vamzdį (70) iš slėginio indo (54) į uždaros mechaninės sistemos vidų;

tiekimo sistema, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad:

(d) lanksčiojo vamzdžio (82) kreipiančioji atrama (70) apima:

(i) lenktą dalį (84) viename jos gale;

(ii) kablio formos dalį (88) kitame jos gale;

(iii) kanalą (94), einantį vidinėje pusėje per visą kreipiančiosios atramos ilgį (82), kur kanalo (94) kanalo matmenys yra tokie, kad jis apimtų lanksčiojo vamzdžio (70) išorinį paviršių;

(iv) kreipiančiosios atramos (82) lenktoji dalis (84) yra įtaisyta tarp uždaros mechaninės sistemos skystinančiųjų dujų įleidimo žiedo (64) ir dujų tiekimo žarnos (28), o dėl kablio formos dalies (88) lankstusis vamzdis (70) tęsiasi į uždaros mechaninės sistemos vidų taip, kad jo tolimasis galas yra nukreiptas ta pačia kryptimi, kaip ir skystinančiųjų dujų srautas;

(e) kur lankstusis vamzdis (70) yra įtaisytas kreipiančiosios atramos (82) kanalo viduje, kad kreipiančioji atrama (82) apsaugotų vamzdį (70) nuo gniuždymo.

2. Tiekimo sistema pagal 1 punktą, kur uždara mechaninė sistema yra vidaus degimo variklis.

3. Tiekimo sistema pagal 1 punktą, kur uždara mechaninė sistema yra mechanizmo arba įrenginio dalis.

4. Tiekimo sistema pagal 1 punktą, kur uždara mechaninė sistema yra priverstinio orinio šildymo, vėdinimo arba oro kondicionavimo kanalas.

5. Tiekimo sistema pagal 1 punktą, kur atomizuotas apdorojimo agentas yra valiklis.

6. Tiekimo sistema pagal 1 punktą, kur atomizuotas apdorojimo agentas yra tepalas.

7. Tiekimo sistema pagal 1 punktą, kur atomizuotas apdorojimo agentas yra priemonė pelėsiams arba grybeliams naikinti.

8. Tiekimo sistema pagal 1 punktą, kur atomizuotas apdorojimo agentas yra kondensacijos arba drėgmės mažinimo priemonė.

9. Tiekimo sistema pagal 1 punktą, kur atomizuotas apdorojimo agentas yra oro gaiviklis arba kvapiklis.

10. Tiekimo sistema pagal 1 punktą, kur atomizuotas apdorojimo agentas yra tiekiamas per vamzdį aerozolio pavidalu.

11. Tiekimo sistema pagal 1 punktą, kur atomizuotas apdorojimo agentas yra tiekiamas per vamzdį, naudojant suslėgtas dujas.

12. Tiekimo sistema pagal 1 punktą, kur skystinančiosios dujos yra oras.

13. Tiekimo sistema pagal 1 punktą, kur skystinančiosios dujos yra techninės dujos.

14. Tiekimo sistema pagal 2 punktą, kur valiklis yra iškraunamas į vidaus degimo variklio oro sklendės korpusą nepageidaujamoms apnašoms, esančioms ant variklio vidinio paviršiaus arba darbinės dalies, tirpdyti.

15. Tiekimo sistema pagal 2 punktą, kur tepalas yra iškraunamas į vidaus degimo variklio oro sklendės korpusą variklio darbinei daliai sutepti.

---

(51) Int.Cl. ***B41M 3/00*** (2006.01)
B41M 5/28 (2006.01)
G09F 3/00 (2006.01)
B65D 79/02 (2006.01)

(11) **2373490**

(96) 09749138.5

(96) 2009-11-13

(97) 2011-10-12

(97) 2016-02-17

(86) PCT/EP2009/065108

(86) 2009-11-13

(87) WO 2010/060812

(87) 2010-06-03

(30) 08425749, 2008-11-25, EP

(72) MASCIAMBRUNI, Roberto, IT

(73) Aziende Chimiche Riunite Angelini Francesco A.C.R.A.F. S.p.A., 00181 Roma, IT

(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

(54) Pakavimo medžiaga su spalvotu elementu, kurio spalvai iš dalies pasikeitus esant tam tikrai temperatūrai, išryškėja ženklas, taip pat šios medžiagos gamybos būdas

Apibrėžties punktai: 11, brėžiniai: 4.

(57) 1. Farmacijos produktų pakavimo medžiaga (11), kur minėta pakavimo medžiaga (11) turi spalvotą elementą (12), kurio spalvai iš dalies pasikeitus esant nustatytai temperatūrai, kuri yra žemesnė už farmacijos produkto laikymo temperatūrą, išryškėja ženklas(12'), kur:

(a) minėtas elementas (12) yra suformuotas iš pirmosios dalies, apimančios minėtą ženklą (12'), atspausdintą paprastu rašalu, ir antrosios dalies (12"), atspausdintos termochrominiu rašalu;

(b) minėtas termochrominis rašalas yra spalvotas esant žemesnei už nustatytąją temperatūrai, o ją pasiekus arba viršijus, tampa bespalvis;

(c) minėta pirmoji dalis (12') ir antroji dalis (12") yra išdėstytos taip, kad minėta pirmoji dalis (12') yra iš esmės nematoma esant žemesnei už nustatytąją temperatūrai ir tampa matoma pasiekus arba viršijus minėtą nustatytąją temperatūrą; b e s i s k i r i a n t i tuo, kad:

(d) spalvoto elemento (12) minėta pirmoji dalis (12') ir antroji dalis (12") yra išdėstytos išilgai viena kitos.

2. Pakavimo medžiaga (11) pagal 1 punktą, kur termochrominis rašalas yra grįžtamojo tipo.

3. Pakavimo medžiaga (11) pagal 1 punktą, kur, jei pirmojoje dalyje (12') yra paprastu rašalu nepadengtų vietų, spalvoto elemento (12) antroji dalis (12") uždengia ir minėtas vietas.

4. Pakavimo medžiaga (11) pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 3, kur termochrominio rašalo spalva esant žemesnei už nustatytąją temperatūrai iš esmės nesiskiria nuo paprasto rašalo spalvos.

5.Pakavimo medžiaga (11) pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 3, kur termochrominio rašalo spalva esant žemesnei už nustatytąją temperatūrai yra kiek įmanoma panašesnė į paprasto rašalo spalvą.

6. Farmacijos produktų pakavimo medžiagos (11), kur minėta pakavimo medžiaga (11) turi spalvotą elementą (12), kurio spalvai iš dalies pasikeitus, esant nustatytai temperatūrai, kuri yra žemesnė už farmacijos produkto laikymo temperatūrą, išryškėja ženklas(12'), gamybos būdas, kur spalvoto elemento (12) gamyba apima šiuos etapus:

a) pakavimo medžiagos (11) gavimą;

b) minėto ženklo (12') spausdinimą ant jos, naudojant paprastą rašalą;

c) padengimą termochrominiu rašalu, kuris yra spalvotas esant žemesnei už nustatytąją temperatūrai, o pasiekus arba viršijus minėtą nustatytąją temperatūrą tampa bespalvis, kad minėtas ženklas (12") būtų iš esmės nematomas esant žemesnei už nustatytąją temperatūrai ir taptų matomas pasiekus arba viršijus minėtą nustatytąją temperatūrą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad padengimas minėtu termochrominiu rašalu vykdomas, suformuojant sluoksnį (12") išilgai minėto ženklo (12').

7. Būdas pagal 6 punktą, kur termochrominis rašalas yra grįžtamojo tipo.

8. Būdas pagal pirmesnį 6 punktą, kur, jei pirmojoje dalyje (12') yra paprastu rašalu nepadengtų vietų, minėtos vietos yra taip pat padengiamos termochrominio rašalo sluoksniu (12").

9. Būdas pagal bet kurį iš punktų nuo 6 iki 8, kur termochrominio rašalo spalva, esant žemesnei už nustatytąją temperatūrai, iš esmės nesiskiria nuo paprasto rašalo, kuriuo atspausdintas ženklas (12'), spalvos.

10. Būdas pagal bet kurį iš punktų nuo 6 iki 8, kur termochrominio rašalo spalva, esant žemesnei už nustatytąją temperatūrai, yra kiek įmanoma panašesnė į paprasto rašalo, kuriuo atspausdintas ženklas (12'), spalvą.

11. Būdas pagal bet kurį iš punktų nuo 6 iki 10, kur etapai b) ir c) vykdomi, naudojant trafaretinės arba fleksografinės spaudos technologiją.

---

(51) Int.Cl. ***B61F 19/04*** (2006.01)
B61D 15/06 (2006.01)
B61D 17/06 (2006.01)

(11) **2792570**

(96) 12857013.2

(96) 2012-10-22

(97) 2014-10-22

(97) 2016-02-10

(86) PCT/CN2012/083296

(86) 2012-10-22

(87) WO 2013/086898

(87) 2013-06-20

(30) 201110424043, 2011-12-16, CN

(72) FAN, Letian, CN
ZHANG, Guoping, CN
WANG, Jiangong, CN
MA, Jijun, CN
GUAN, Quanmei, CN
ZHANG, Qinggang, CN
LI, Peng, CN

(73) Tangshan Railway Vehicle Co., Ltd, Tangshan, Hebei 063035, CN

(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA", Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT

(54) Gedimo lokalizavimo ir energijos absorbavimo įrenginys ir traukinio vagono su varikliu sekcijos priekinis vagonas
Apibrėžties punktai: 10, brėžiniai: 8.

(57) 1. Kliūties pašalinimo ir energijos absorbavimo įrenginys, apimantis kliūties pašalinimo atramą (6) ir buferinę skersę (15), kurios yra sukonstruotos priešpriešiais, energijos absorbavimo vamzdžio montažas su energijos absorbavimo vamzdžiu (9) yra fiksuotai įjungtas tarp kliūties pašalinimo atramos (6) ir buferinės skersės (15), montavimo pagrindas (8) yra fiksuotai sujungtas su energijos absorbavimo vamzdžio (9) vienu galu, tuo tarpu spaudimo atrama (13) yra įsriegta į energijos absorbavimo vamzdžio (9) kitą galą, spaudimo atrama (13) yra numatyta su kintamu diametru per angą, spaudžianti išgaubtoji dalis (20) yra numatyta kintamo diametro kiaurinėje angoje, įgaubtoji dalis (21) suderinta su spaudžiančia išgaubtąja dalimi (20) yra sukonstruota ties galo dalimi, kur energijos absorbavimo vamzdis (9) yra įsiskverbęs į spaudimo atramą (13), montavimo pagrindas (8) yra fiksuotai sujungtas su kliūties pašalinimo atrama (6) ir spaudimo atrama (13) yra fiksuotai sujungta su buferine skerse (15).

2. Kliūties pašalinimo ir energijos absorbavimo įrenginys pagal 1 punktą, kuriame kliūties pašalinimo įrenginys dar yra numatytas su energijos absorbavimo vamzdžio spaudimo – deformavimo kreipiamuoju įrenginiu, energijos absorbavimo vamzdžio spaudimo – deformavimo kreipiamasis įrenginys yra numatytas su slydimo bloku (11) ir kreipiančiuoju bėgiu (12), kurie yra vienas su kitu slydimo suleidime, slydimo blokas (11) yra fiksuotai sujungtas su kliūties pašalinimo atrama (6), kreipiančiojo bėgio (12) vedančioji kryptis yra suderinta su energijos absorbavimo vamzdžio (9) ašine kryptimi.

3. Kliūties pašalinimo ir energijos absorbavimo įrenginys pagal 1 arba 2 punktą, kuriame bamperio skersė (15) yra numatyta su energijos absorbavimo vamzdžio antrine energijos absorbavimo ertme (23), energiją absorbuojančiam įrenginiui (9) skverbtis kiaurinė anga yra numatyta ant energijos absorbavimo vamzdžio antrinės energijos absorbavimo ertmės (23) ertmės sienos proksimaliai energijos absorbavimo vamzdžiui (9), ir energijos absorbavimo vamzdžio antrinis deformavimo veikimo paviršius (25) pasuktas į energijos absorbavimo vamzdį (9), yra numatytas ant energijos absorbavimo vamzdžio antrinės energijos absorbavimo ertmės (23) ertmės sienos distaliniu būdu į energiją absorbuojantį vamzdį (9).

4. Kliūties pašalinimo ir energijos absorbavimo įrenginys pagal 1 arba 2 punktą, kuriame bamperio skersė (15) yra dar numatyta su tvirtinimo plokšte (18), tvirtinimo plokštė (18) yra numatyta su tvirtinimo kiauraja anga, kurios ašinė kryptis yra ta pati su energiją absorbuojančio vamzdžio (9) ašine kryptimi.

5. Kliūties pašalinimo ir energijos absorbavimo įrenginys pagal 1 arba 2 punktą, kuriame energiją absorbuojantis vamzdis (9) yra apskritas vamzdis.

6. Kliūties pašalinimo ir energijos absorbavimo įrenginys pagal 1 arba 2 punktą, kuriame energiją absorbuojantis vamzdis (9) yra užpildytas aliuminio putomis.

7. Kliūties pašalinimo ir energijos absorbavimo įrenginys pagal 1 arba 2 punktą, kuriame kliūties pašalinimo atramos (6) abu galai yra fiksuotai sujungti su veleno atraminiu paviršiumi (16), veleno atraminis paviršius (16) yra besisukančiai sujungtas su bamperio skerse (15).

8. Kliūties pašalinimo ir energijos absorbavimo įrenginys pagal 7 punktą, kuriame kliūties pašalinimo atrama (6) yra numatyta su kliūties pašalinimo tiesia atrama (7), kliūties pašalinimo tiesios atramos abu galai (7) yra fiksuotai sujungti su kliūties pašalinimo išlenkta atrama, ir veleno atraminis plotas (16) yra fiksuotai sujungtas su kliūtį pašalinančia išlenkta atrama.

9. Traukinio vagono su varikliu sekcijos priekinis vagonas, apimantis vagono korpusą (19) ir kliūties pašalinimo ir energijos absorbavimo įrenginį pagal bet kurį vieną 1 – 8 punktą, kuriame kliūties pašalinimo ir energijos absorbavimo įrenginio bamperio skersė (15) yra fiksuotai sujungta su vagono korpuso (19) priekinio galo apatine dalimi ir kliūties pašalinimo ir energijos absorbavimo įrenginio kliūties pašalinimo atrama (6) yra sukonstruota link priekinio vagono judėjimo krypties.

10. Traukinio vagono su varikliu sekcijos priekinis vagonas pagal 9 punktą, kuriame, kai kliūties pašalinimo ir energijos absorbavimo įrenginys yra numatytas su energijos absorbavimo vamzdžio spaudimo deformacijos kreipiančiuoju įrenginiu, kliūties pašalinimo ir energijos absorbavimo įrenginio kreipiantysis bėgis (12) yra fiksuotai sujungtas su vagono korpusu (19).

(51) Int.Cl. ***B65B 29/02*** (2006.01)
B65B 7/28 (2006.01)
B65D 85/804 (2006.01)

(11) **2889224**

(96) 13199515.1

(96) 2013-12-24

(97) 2015-07-01

(97) 2016-02-24

(72) Deuber, Louis, CH
Rupfle, Roland, AT
Ternitė, Rüdiger, DE
Stein, Robert, DE

(73) Qbo Coffee GmbH, 8304 Wallisellen, CH

(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT

(54) Porcijinė kapsulė užplikintam produktui paruošti ir būdas jai gaminti

Apibrėžties punktai: 12, brėžiniai: 9.

(57) 1. Būdas gaminti porcijos kapsulei (1), kuri yra užpildyta ekstrakcijos medžiaga ir kuri yra užplikintam produktui sukurti, apimantis šiuos žingsnius:

- pagrindinio plastikinio korpuso (2) su apačios sritimi (5), su periferine šono sienele (6) ir su periferiniu pagrindinio korpuso sandarikliu (41), sujungtu su periferine šonine sienele, numatymą, kuriame pagrindinis korpusas turi iš esmės stačiakampį skerspjūvį pagrindinio korpuso sandariklio srityje;

- plastikinio dangtelio (3) numatymą, kuriame dangtelis, prijungtas prie periferinio dangtelio sandariklio (34), formuoja išorėn nukreiptą arką, kur periferinis dangčio lankelis jo matmenimis yra priderintas prie pagrindinio korpuso sandariklio (41);

- pagrindinio korpuso (2) užpildymą ekstrakcijos medžiaga, ir

- dangtelio (3) uždėjimą ant pagrindinio korpuso (2) taip, kad dangtelio sandariklis atsigultų ant pagrindinio korpuso sandariklio, ir dangtelio sandariklio tvirtinimą ant pagrindinio korpuso sandariklio ultragarsiniu suvirinimu,
b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad

- bent dangtelis (3) yra gaminamas giluminio tempimo būdu, kad dangtelis yra numatytas su bent vienu grioveliu (11), kuris yra periferinis ant išorinės pusės, dangtelio sandariklio srityje, ir tuo, kad dangtelis (3) yra numatytas su energijos krypties valdikliu (23), kuris fokusuoja ultragarso energiją ultragarsinio suvirinimo metu.

2. Būdas pagal 1 punktą, kuriame dangtelis (3) ir pagrindinis korpusas (2) yra pagaminti iš to paties plastiko.

3. Būdas pagal bet kurį vieną ankstesnį punktą, kuriame energijos krypties valdiklis (23) turi periferinės briaunos formą.

4. Būdas pagal bet kurį vieną ankstesnį punktą, kuriame bent dangtelis (3) yra pagamintas per didelių matmenų ir atsikišusios sritys (31) yra atskirtos vėliau po suvirimo arba tuo pat metu.

5. Būdas pagal bet kurį vieną ankstesnį punktą, kuriame dangtelis (3) yra numatytas su pozicionavimo priemone (32, 35), dėl kurios dangtelis (3) yra išlyginamas pagrindinio korpuso (23) atžvilgiu uždėjimo ant jo metu.

6. Porcijos kapsulė (1), kuri yra užpildyta ekstrakcijos medžiaga ir yra užplikintam produktui sukurti, porcijos kapsulė (1) visų pirma gali būti pagaminta būdu pagal vieną iš ankstesnių punktų, apimanti

- pagrindinį plastikinį korpusą (2) su apačios sritimi (5), su periferine šono sienele (6) ir su periferiniu pagrindinio korpuso sandarikliu (41), sujungtu su periferine šonine sienele, kuriame pagrindinis korpusas turi iš esmės stačiakampį skerspjūvį pagrindinio korpuso sandariklio srityje;

- plastikinį dangtelį (3), kuris yra pritvirtintas prie pagrindinio korpuso išilgai periferinio sandariklio,

- kuriame sandariklis yra pagamintas pagrindinio korpuso sandariklio (41) ir dangtelio sandariklio (34) ultragarsinio suvirinimo būdu;

- kuriame dangtelis formuoja išorėn nukreiptą arką taip, kad dangtelis prisidėtų prie kapsulės tūrio,
b e s i s k i r i a n t i tuo, kad

- dangtelis (3) yra pagamintas giluminio tempimo būdu, kad dangtelis yra numatytas su bent vienu grioveliu (11), kuris yra periferinis ant išorinės pusės, dangtelio sandariklio srityje, ir tuo, kad energijos krypties valdiklis (23) yra integruotas į dangtelio sandariklį (34).

7. Porcijos kapsulė pagal 6 punktą, kuri išskyrus sandariklį (4) yra iš esmės kubo formos arba kuboidas.

8. Porcijos kapsulė pagal vieną 6 arba 7 punktą, kurioje arkos pagrindas (12) yra atsvara į vidų lyginant su šoninės sienelės (6) dalimi, prie kurios prisijungia sandariklio dalis (4).

9. Porcijos kapsulė pagal vieną iš 6 – 8 punktų, kurioje dangtelis iš išorės į vidų apima sandariklio sritį, lanko formos perėjimo sritį ir plokščią sritį (9), minėta sandariklio sritis, formuojanti paviršių (8), atsuktą link dangtelio pusės ir minėta plokščia sritis (9) yra nustatyta nuo paviršiaus (8) plokštumos.

10. Porcijos kapsulė pagal 9 punktą, kur plokščia sritis (9) prisiima bent 40 % dangtelio paviršiaus.

11. Porcijos kapsulė pagal vieną iš 6 – 10 punktų, kurioje sandariklis (4) atsikiša šoniniu būdu tarp 0,8 mm ir 2 mm.

12. Porcijos kapsulė pagal vieną iš ankstesnių 6 – 11 punktų, kurioje pagrindinis korpusas (2) ir dangtelis (3) yra pagaminti iš to paties plastiko.

---

(51) Int.Cl. ***B65D 19/40*** (2006.01)
B65D 19/00 (2006.01)
(11) **2722285**
(96) 12188830.9
(96) 2012-10-17
(97) 2014-04-23
(97) 2016-04-06
(72) Metzler, Richard, DE
Mueller, Stefan, DE
Ramon, Gat, DE
Wedeward, Stephanie, DE
Stegeman, Sebastian, DE
(73) Cabka GmbH & Co. KG, 07806 Weira, DE
Lidl Stiftung & Co. KG, 74172 Neckarsulm, DE
(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Plastikinis padėklas su standinamuoju elementu
Apibrėžties punktai: 10, brėžiniai: 4.
(57) 1. Plastikinis padėklas (1), apimantis
- plokštę (2) gabenamiems daiktams sudėti,
- kojas (4, 5), kurios yra tokios formos, kad išsikiša po plokštės (2) apatine puse (3),
- apatines pavažas (6), kurios yra tokios formos, kad jungia bent dvi kojas (4, 5) iš apačios,
b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad
- bent vienos iš apatinių pavažų (6) apatinėje pusėje yra bent viena išėma (7), einanti išilgai apatinių atramų (6),
- į bent vieną išėmą (7) yra įstatytas sutvirtinamasis elementas (8), pagamintas iš medžiagos, kurios tamprumo modulis yra didesnis, nei tos, iš kurios pagamintos apatinės pavažos (6),
- sutvirtinamasis elementas (8) yra užfiksuotas išėmoje (7) tvirtinimo priemonėmis,
- bent vienas stabilizuojamasis elementas (9) yra prijungtas prie sutvirtinamojo elemento (8) ir įtaisytas nustatytu nekintamu kampu jo atžvilgiu,
- bent vienas stabilizuojamasis elementas (9) yra pritaikytas sukibti su atitinkamu lizdu (10) vienoje iš kojų (4).

2. Plastikinis padėklas (1) pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad tvirtinimo priemonės apima bent vieną iškyšą, iš dalies dengiančią bent vieną išėmą (7) ir pozityviai užfiksuojančią sutvirtinamąjį elementą (8) išėmoje (7).

3. Plastikinis padėklas (1) pagal 1 arba 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad
- sutvirtinamasis elementas (8) yra strypo arba juostos formos ir
- stabilizuojamasis elementas (9) yra įtaisytas ties kiekvienu sutvirtinamojo elemento (8) galu.

4. Plastikinis padėklas (1) pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 3, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad

- lizdas (10) yra atviras iš plokštės (2) pusės ir

- tvirtinimo priemonės jungia bent vieną stabilizuojamąjį elementą (9) su lizdu (10), o jungtis yra atkabinama per prieigą nuo plokštės (2).

5. Plastikinis padėklas (1) pagal 4 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jungtis yra skląsčio tipo ir apima bent vieną auselę (12), esančią ant lizdo (10), kuri sukimba su bent vienu kablio formos skląsčiu (11), esančiu ant bent vieno stabilizuojamojo elemento (9), taip, kad bent vienas stabilizuojamasis elementas (9) yra užfiksuojamas lizde (10) geometrinio sukibimo būdu.

6. Plastikinis padėklas (1) pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 5, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad bent vienas stabilizuojamasis elementas (9) yra plokštelės, kurios šonai yra išdėstyti statmenai apatinių pavažų (6) išilginei krypčiai, formos.

7. Plastikinis padėklas (1) pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 6, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad bent vienas stabilizuojamasis elementas (9) yra sujungtas su sutvirtinamuoju elementu (8) suvirinimo siūle, klijais arba varžtais, bent vienas stabilizuojamasis elementas (9) ir sutvirtinamasis elementas (8) yra suformuoti kaip vientisa detalė arba bent vienas stabilizuojamasis elementas (9) yra sujungtas su sutvirtinamuoju elementu (8) išardoma įstatomąja jungtimi.

8. Plastikinis padėklas (1) pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 7, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad tarp sutvirtinamojo elemento (8) bei apatinės pavažos (6) ir (arba) tarp bent vieno stabilizuojamojo elemento (9) ir lizdo (10) sienelės esantys tarpai yra užpildyti putplasčiu.

9. Plastikinis padėklas (1) pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 8, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad į išėmą (7) įstatytas sutvirtinamasis elementas (8) išsikiša už apatinės pavažos (6) atraminio paviršiaus į išėmą (7), kurioje jis yra įstatytas.

10. Plastikinis padėklas (1) pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 9, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad sutvirtinamasis elementas (8) yra pagamintas iš aliuminio.

---

(51) Int.Cl. ***B65D 71/06*** (2006.01)
(11) **2164770**
(96) 08759310.9
(96) 2008-06-20
(97) 2010-03-24
(97) 2016-03-30
(86) PCT/EP2008/004996
(86) 2008-06-20
(87) WO 2008/155129
(87) 2008-12-24
(30) 200700313, 2007-06-21, BE
(72) HUYGHE, Michael, NL
(73) Combipac BV, 7772 BJ Hardenberg, NL
(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Iš anksto įtempta plėvelė
Apibrėžties punktai: 20, brėžiniai: 15.
(57) 1. Iš anksto įtemptos plėvelės rulono naudojimas vietoje tinklo ryšuliams vynioti, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėta plėvelė yra gaminama, ištempiant ją išilgine kryptimi iki bent 60% trūkimo ištysos taip, kad minėtos plėvelės likusi pailgėjimo išilgine kryptimi geba, išmatuota pagal ASTM D882, būtų ne didesnė kaip 180%.

2. Iš anksto įtemptos plėvelės rulono naudojimas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos plėvelės pailgėjimo išilgine kryptimi geba dabar yra ne didesnė kaip 160%.

3. Iš anksto įtemptos plėvelės rulono naudojimas pagal 1 arba 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos plėvelės pailgėjimo išilgine kryptimi geba dabar yra ne didesnė kaip 120%.

4. Iš anksto įtemptos plėvelės rulono naudojimas pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos plėvelės pailgėjimo išilgine kryptimi geba dabar yra ne didesnė kaip 80%.

5. Iš anksto įtemptos plėvelės rulono naudojimas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos plėvelės 2% kirstinės modulis išilgine kryptimi, išmatuotas pagal ASTM D882, yra bent 55N/15mm.

6. Iš anksto įtemptos plėvelės rulono naudojimas pagal 5 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos plėvelės 2% kirstinės modulis išilgine kryptimi yra bent 60N/15mm.

7. Iš anksto įtemptos plėvelės rulono naudojimas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos plėvelės 10% kirstinės modulis išilgine kryptimi, išmatuotas pagal ASTM D882, yra bent 35N/15mm.

8. Iš anksto įtemptos plėvelės rulono naudojimas pagal 7 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos plėvelės 10% kirstinės modulis išilgine kryptimi yra bent 45N/15mm.

9. Iš anksto įtemptos plėvelės rulono naudojimas pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad yra gaminama, tempiant ją išilgine kryptimi iki bent 70% jos trūkimo ištysos.

10. Iš anksto įtemptos plėvelės rulono naudojimas pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėta plėvelė yra polietileno arba etileno kopolimero plėvelė.

11. Iš anksto įtemptos plėvelės rulono naudojimas pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėta plėvelė yra pagaminta ekstruzijos su išpūtimu būdu.

12. Iš anksto įtemptos plėvelės rulono naudojimas pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos plėvelės storis yra ne didesnis kaip 16 µm.

13. Iš anksto įtemptos plėvelės rulonas, naudojamas vietoje tinklo ryšuliams vynioti, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėta plėvelė yra gaminama, ištempiant ją išilgine kryptimi iki bent 60% trūkimo ištysos taip, kad minėtos plėvelės likusi pailgėjimo išilgine kryptimi geba, išmatuota pagal ASTM D882, būtų ne didesnė kaip 180%.

14. Iš anksto įtemptos plėvelės rulonas pagal 13 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos plėvelės pailgėjimo išilgine kryptimi geba dabar yra ne didesnė kaip 160%.

15. Iš anksto įtemptos plėvelės rulonas pagal 13 arba 14 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos plėvelės pailgėjimo išilgine kryptimi geba dabar yra ne didesnė kaip 120%.

16. Iš anksto įtemptos plėvelės rulonas pagal bet kurį iš punktų nuo 13 iki 15, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos plėvelės pailgėjimo išilgine kryptimi geba dabar yra ne didesnė kaip 80%.

17. Iš anksto įtemptos plėvelės rulonas pagal bet kurį iš punktų nuo 13 iki 16, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad yra gaminama, tempiant ją išilgine kryptimi iki bent 70% jos trūkimo ištysos.

18. Iš anksto įtemptos plėvelės rulonas pagal bet kurį iš punktų nuo 13 iki 17, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėta plėvelė yra polietileno arba etileno kopolimero plėvelė.

19. Iš anksto įtemptos plėvelės rulonas pagal bet kurį iš punktų nuo 13 iki 18, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėta plėvelė yra pagaminta ekstruzijos su išpūtimu būdu.

20. Iš anksto įtemptos plėvelės rulonas pagal bet kurį iš punktų nuo 13 iki 19, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos plėvelės storis yra ne didesnis kaip 16 µm.

(51) Int.Cl. ***B65D 83/00*** (2006.01)
A47F 1/035 (2006.01)
A47F 1/08 (2006.01)
G07F 11/50 (2006.01)

(11) **2488425**

(96) 10823695.1

(96) 2010-10-13

(97) 2012-08-22

(97) 2015-12-23

(86) PCT/SE2010/051104

(86) 2010-10-13

(87) WO 2011/046501

(87) 2011-04-21

(30) 0950757, 2009-10-13, SE
1050482, 2010-05-17, SE

(72) GUNSTAD, Frida, SE
GUNSTAD, Mikael, SE
JUNKELL, Fredrik, SE

(73) Click Candy AB, 671 41 Arvika, SE

(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

(54) Granuliuotų maisto produktų išvadavimo įrenginys ir įdėklas, įdedamas į granuliuotų maisto produktų išdavimo įrenginį
Apibrėžties punktai: 11, brėžiniai: 24.

(57) 1. Granuliuotų maisto produktų (2), tokių kaip, pvz., saldainiai, išdavimo įrenginys (1), kur įrenginys (1) apima talpyklą (3), kur talpyklos (3) gale (5) yra išdavimo anga (14), per kurią granuliuoti maisto produktai palieka talpyklą (3), laikiklį arba dėklą (9), į kurį talpykla (3) yra įtaisyta taip, kad talpyklos ašis (L) būtų pasvirusi horizontaliosios plokštumos atžvilgiu 3°–80°, geriau – 5°–60°, o geriausia – 10°–25° kampu, talpykla (3) papildomai gali suktis aplink išilginę ašį (L) laikiklyje arba dėkle (9), talpyklos (3) viduje yra bent viena granuliuotų maisto produktų (2) kreipiamoji (17, 18, 19), užfiksuota talpyklos (3) atžvilgiu ir apimanti daugybę iškylų (27) ant talpyklos (3) vidinės sienelės paviršiaus (16), iškylos (27) iš esmės tęsiasi talpyklos (3) išilginės ašies (L) kryptimi, minėtos iškylos (27) talpykloje (3) yra išdėstytos taip, kad granuliuoti maisto produktai (2) nukreipiami išdavimo angos kryptimi (14), talpyklai (3) sukantis aplink savo išilginę ašį (L), tačiau lieka vietoje (3) jai nejudant, talpykla (3) apima žiedą (18) aplink išdavimo angą (14), besitęsiantį spinduliu į vidų link talpyklos spindulinės ašies (3), b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad talpyklos (3) viduje tam tikru atstumu prieš išdavimo angą (14) yra stabdymo plokštė (19), stabdymo plokštė (19) iš dalies blokuoja kelią link išdavimo angos (14) taip, kad srityje tarp žiedo (18) ir stabdymo plokštės (19) iš minėtų iškylų (27) ant talpyklos (3) vidinės sienelės paviršiaus (16) yra suformuoti atskiri skyriai granuliuotiems maisto produktams, ir tuo, kad stabdymo plokštė (19) yra nejudamai pritvirtinta prie vienos iš minėtų iškylų (27) arba įrengta taip, kad ją būtų galima paslinkti išilgai minėtų iškylų (27) ir užfiksuoti skirtingu atstumu nuo išdavimo angos (14).

2. Įrenginys (1) pagal 1 punktą, kur minėta bent viena kreipiamoji yra sraigtas / sliekas (17), nejudamai užfiksuotas talpyklos (3) atžvilgiu.

3. Įrenginys (1) pagal 1 punktą, kur minėtos iškylos (27) yra suformuotos iš išilgai besitęsiančių bėgelių.

4. Įrenginys (1) pagal 1 punktą, kur ant talpyklos (3) yra klostės, iš kurių suformuotos minėtos iškylos (27) ant talpyklos (3) vidinės sienelės paviršiaus (16).

5. Įrenginys (1) pagal 4 punktą, kur stabdymo plokštė (19) nukreipta priešinga kryptimi nuo išdavimo angos (14), ant stabdymo plokštės (19) yra įtaisyta spindulinė kreipiamoji (23), kuri tęsiasi statmena talpyklos (3) išilginei ašiai kryptimi bei susikerta su talpyklos išilgine ašimi, ir kur spindulinė kreipiamoji (23), pageidautina, tęsiasi bent iki vienos iš minėtų iškylų.

6. Įrenginys (1) pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 5, kur minėtos iškylos (27) yra suformuotos taip, kad spinduliu į vidų link talpyklos (3) išilginės ašies atstumas tarp dviejų gretimų iškylų yra pastovus arba didėjantis.

7. Įrenginys pagal 1 punktą, kur išilginės iškylos (27) tęsiasi link žiedo (18) taip, kad iš jų būtų suformuotos atskirų skyrių (21) skiriamosios sienelės.

8. Įrenginys pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 7, kuriame yra įtaisytas svėrimo įtaisas (100) talpykloje (3) esančių granuliuotų maisto produktų (2) svoriui aptikti ir kur svėrimo įtaisas (100), pageidautina, yra prijungtas prie kontrolės ir (arba) stebėsenos įtaiso (200), tokio kaip kompiuteris.

9. Įrenginys pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 8, kur įrenginys (1) apima variklį (6), skirtą talpyklai (3) sukti, ir jungiklį (12), kuris yra prijungtas prie variklio (6) taip, kad variklį (6) būtų galima paleisti jungikliu (12), ir kur įrenginys papildomai apima jutiklį (400), skirtą aptikti, ar tam tikra sąlyga yra tenkinama, bei kur jutiklis (400) yra prijungtas prie variklio (6) taip, kad variklio (6) negalima būtų paleisti jungikliu, prieš tai negavus jutiklio signalo, reiškiančio, kad minėta tam tikra sąlyga yra tenkinama.

10. Įrenginys pagal 9 punktą, kur yra įtaisytas jutiklis (400), skirtas aptikti, ar tara (350) granuliuotiems maisto produktams yra pakišta tinkamoje padėtyje po išdavimo anga (14), kad variklio (6) nebūtų galima paleisti, prieš tai negavus jutiklio (400) signalo, reiškiančio, jog tara (350) yra pakišta tinkamoje padėtyje po išdavimo anga (14).

11. Įdėklas, pritaikytas talpyklos (3) funkcijai atlikti ir įstatomas į granuliuotų maisto produktų (2) išdavimo įrenginio (1) pagal 1 punktą laikiklį arba dėklą (9), apimantis pailgą talpyklą (3), kuri yra bent iš dalies užpildyta granuliuotais maisto produktais (2) ir tęsiasi nuo pirmojo galo iki antrojo galo palei išilginę ašį, ant talpyklos vidinės sienelės paviršiaus (16) yra išilginės iškylos (27), kur iš iškylų (27) yra suformuotos kreipiamosios ir kur tam tikru atstumu nuo antrojo talpyklos galo yra sumontuota stabdymo plokštė (19), apimanti bent kelias iš minėtų iškylų (27) taip, kad granuliuoti maisto produktai (2) galėtų praeiti pro stabdymo plokštę (19) srityje tarp stabdymo plokštės (19) ir talpyklos (3) vidinės sienelės paviršiaus (16).

---

(51) Int.Cl. ***B66C 1/10*** (2006.01)
F03D 1/00 (2006.01)
(11) **2807107**
(96) 12810221.7
(96) 2012-12-18
(97) 2014-12-03
(97) 2016-03-16
(86) PCT/EP2012/076021
(86) 2012-12-18
(87) WO 2013/110417
(87) 2013-08-01
(30) 102012201088, 2012-01-25, DE
(72) KNOOP, Frank, DE
KUIPER, Gerrit, DE
(73) Wobben Properties GmbH, 26607 Aurich, DE
(74) Virgina Adolfina DRAUGELIENĖ, 8, UAB TARPINĖ, A.P.Kavoliuko g. 24-152, LT-04328 Vilnius, LT
(54) Vėjo jėgainės rotoriaus gaubto montavimo būdas ir įrenginys
Apibrėžties punktai: 11, brėžiniai: 4.
(57) 1. Vėjo jėgainės (100) rotoriaus gaubtas (1), turintis
-.manipuliatorių, skirtą rotoriaus gaubtui (1) pakelti kranine priemone tam, kad rotoriaus gaubtą (1) sumontuotų ant gondolos (104), kuri išdėstyta ant vėjo jėgainės bokšto, kur
- manipuliatorius paruoštas taip, kad kai keliamas į manipuliatoriaus tvirtinimo dalį (14), rotoriaus gaubtas (1) sukasi nuo vertikalios orientacijos su iš esmės vertikalia gaubto ašimi (28) į horizontalią orientaciją su iš esmės horizontalia gaubto ašimi (28), b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad manipuliatorius apima
- iš anksto sumontuotą stovą (2), skirtą rotoriaus gaubtui (1) laikyti horizontaliai orientuotą su
-šarnyrine dalimi (34), skirta rotoriaus gaubto (1) sukimui nukreipti iš vertikalios orientacijos į horizontalią orientaciją.

2. Rotoriaus gaubtas (1) pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s bent vienu mentės sujungimu, turinčiu žiedinį flanšą, skirtą tiesiogiai arba netiesiogiai rotoriaus mentei (108) tvirtinti
ir/arba gaubto korpusą (4), turintį bent vieną rotoriaus mentės angą (6), skirtą rotoriaus mentei (108) įstatyti, kur manipuliatoriaus tvirtinimo dalis (14) yra pritvirtinta prie žiedinio flanšo (24), ir/arba, sumontuota rotoriaus gaubte (1) tokiu būdu, kad ji išsikiša per rotoriaus mentės angą (6) arba, skirta rotoriaus gaubtui (1) kelti ir sukti nuo vertikalios į horizontalią orientaciją, krano kėlimo įtaisas (18) per rotoriaus mentės angą (6) yra pritvirtintas prie tvirtinimo dalies (14).

3. Rotoriaus gaubtas (1) pagal 1 punktą arba 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad iš anksto sumontuotas stovas (2) yra pritvirtintas prie rotoriaus flanšo, koncentriškai išdėstyto atžvilgiu gaubto ašies (28).

4. Rotoriaus gaubtas (1) pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad rotoriaus gaubtas (1) numatytas fiksuotai prijungti prie vėjo jėgainės (100) generatoriaus rotorio.

5. Rotoriaus gaubtas (1) pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad rotoriaus gaubtas (1) aprūpintas korpusu (4), o manipuliatorius sukonstruotas tokiu būdu, kad gaubto korpusas (4) nesusigadina sukimo metu iš vertikalios į horizontalią orientaciją, ypač nekontaktuoja su atraminiu paviršiumi, ant kurio jis stovi bei nekontaktuoja su kėlimo įtaisu (18), kuris yra pritvirtintas prie tvirtinimo dalies (14).

6. Rotoriaus gaubtas (1) pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad rotoriaus gaubte (1) iš anksto sumontuota kontaktinė žiedinė dalis, skirta elektros signalams perduoti tarp rotoriaus gaubto (1) ir gondolos, ir/arba tuo, kad iš anksto sumontuotas oro sraigto aptakinis korpusas.

7. Manipuliatorius, skirtas rotoriaus gaubtui (1) pakelti kranine priemone tam, kad rotoriaus gaubtą sumontuotų ant gondolos (104), kuri išdėstyta ant vėjo jėgainės bokšto (102), kur
- manipuliatorius yra paruoštas taip, kad, kai keliamas į manipuliatoriaus tvirtinimo dalį (14), rotoriaus gaubtas (1) sukasi nuo vertikalios orientacijos su iš esmės vertikalia gaubto ašimi (28) į horizontalią orientaciją su iš esmės horizontalia gaubto ašimi (28), b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad manipuliatorius apima
- iš anksto sumontuotą stovą (2), skirtą rotoriaus gaubtui (1) laikyti horizontaliai orientuotą su
-šarnyrine dalimi (34), skirta rotoriaus gaubto (1) sukimui nukreipti iš vertikalios orientacijos į horizontalią orientaciją.

8. Manipuliatorius pagal 7 punktą, kur manipuliatorius numatytas naudoti su rotoriaus gaubtu (1) pagal bet kuri iš 1-6 punktų, ir ypač turi manipuliatoriaus požymius pagal 1-6 punktus.

9. Transporto priemonė, skirta rotoriaus gaubtui tiekti, kur transporto priemonė turi manipuliatorių pagal 7 punktą arba 8 punktą.

10. Vėjo jėgainės (100) rotoriaus gaubto (1) surinkimo būdas apimantis šiuos etapus:
- vertikaliai orientuoto rotoriaus gaubto (1) su vertikalia gaubto ašimi parūpinimas,
- krano pakėlimo įtaiso (18) pritvirtinimas prie rotoriaus gaubto manipuliatoriaus tvirtinimo dalies (14),
- rotoriaus gaubto (1) kėlimas tiesiogiai iš vertikalios orientacijos tokiu būdu, kad, kai yra keliamas, rotoriaus gaubtas (1) sukasi nuo vertikalios orientacijos į horizontalią orientaciją su horizontalia gaubto ašimi (28), ir
- rotoriaus gaubto (1) montavimas ant gondolos (104), išdėstytos ant bokšto (102) arba stiebo,
be to, yra naudojamas manipuliatorius, kuris apima
- iš anksto sumontuotą stovą (2), skirtą rotoriaus gaubtui (1) laikyti horizontaliai orientuotą su
-šarnyrine dalimi (34), skirta rotoriaus gaubto (1) sukimui nukreipti iš vertikalios orientacijos į horizontalią orientaciją.

11. Būdas pagal 10 punktą, kuriame yra naudojamas rotoriaus gaubtas (1) pagal bet kurį iš 1-6 punktų ir/arba yra iš anksto sumontuota ar sumontuoti kontaktinė žiedinė dalis, sraigto aptakinis korpusas ir/arba gaubto korpusas (40).

---

(51) Int.Cl. ***B66D 1/74*** (2006.01)
(11) **2592038**
(96) 12191934.4
(96) 2012-11-09
(97) 2013-05-15
(97) 2016-02-03
(30) 201119582, 2011-11-11, GB
(72) Fields, Robert Graham, GB
Falconer, Oliver Peter Gregory, GB
(73) LEWMAR LIMITED, Havant, Hampshire PO9 1JJ, GB
(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Suktuvas
Apibrėžties punktai: 5, brėžiniai: 22.

(57) 1. Burinės valties suktuvas (200), apimantis:

atramą (206), tinkamą pritvirtinti suktuvą burinėje valtyje;

suktuvo būgną (202), pasukamą atramos atžvilgiu;

rankinės pavaros lizdą (302) alkūninei rankenai, skirtai suktuvui sukti rankiniu būdu, įstatyti;

variklį (212) suktuvui sukti mechaniniu būdu, kur suktuvas turi bent du rankinio sukimo pirmyn perdavimo skaičius, pasirenkamus pagal rankinės pavaros lizdo sukimosi kryptį, ir kur suktuvas teikia rankinio sukimo pirmyn ir rankinio sukimo atgal, naudojant variklio galią, galimybę,

b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad suktuvas turi fiksavimo priemones (G5), įsijungiančias įstačius alkūninę rankeną į pavaros lizdą (302), kad alkūninei rankenai esant pavaros lizde, būtų blokuojamas suktuvo sukimasis atgal.

2.Suktuvas pagal 1 punktą, kur net ir alkūninei rankenai esant pavaros lizde suktuvas vis tiek galėtų būti sukamas pirmyn naudojant variklį.

3. Suktuvas pagal 1 arba 2 punktą, kur alkūninei rankenai esant pavaros lizde, variklis gali suktis atgal ir apie tai, kad suktuvo būgnas sukasi ne atgal, operatorius yra informuojamas garso signalu.

4. Suktuvas pagal bet kurį vieną iš 1 – 3 punktų, kur sukimasis atgal vyksta tik tada, kai suktuvo būgnui sukimosi atgal sukimo momentas yra perduodamas per įtemptą lyną, suvyniotą ant suktuvo būgno ir kai alkūninė rankena nėra įstatyta į pavaros lizdą.

5. Suktuvas pagal bet kurį vieną iš 1 – 4 punktų, papildomai apimantis valdymo priemones varikliui valdyti, kur valdymo priemonės yra sudarytos tik iš dviejų pasirinktinai įjungiamų įjungimo / išjungimo valdiklių, priekinės eigos valdiklis yra skirtas tik suktuvo būgno sukimuisi pirmyn, naudojant variklį, valdyti, o atbulinės eigos valdiklis – tik suktuvo būgno sukimuisi atgal, naudojant variklį, valdyti.

---

(51) Int.Cl. ***B66D 1/74*** (2006.01)

(11) **2592039**

(96) 12191935.1

(96) 2012-11-09

(97) 2013-05-15

(97) 2016-03-02

(30) 201119583, 2011-11-11, GB

(72) FIELDS, Robert Graham, GB

FALCONER, Oliver Peter Gregory, GB

(73) LEWMAR LIMITED, Havant, Hampshire PO9 1JJ, GB

(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

(54) Suktuvas

Apibrėžties punktai: 9, brėžiniai: 22.

(57) 1. Burinės valties savaeigis suktuvas (200), apimantis:

atramą (102) suktuvui sumontuoti burinėje valtyje;

suktuvo būgną (202), besisukantį atramos atžvilgiu aplink sukimosi ašį ir

bendraašį savaeigį mechanizmą (220), įrengtą šalia suktuvo būgno,

kur savaeigis mechanizmas apima:

lyno kreipiamąjį griovelį (248), besitęsiantį aplink savaeigį mechanizmą, kur lyno kreipiamąjį griovelį riboja viršutinis (244) ir apatinis (246) lyno kreipiamasis žiedas, viršutinis bei apatinis lyno kreipiamasis žiedas sukasi kartu su būgnu ir yra pritaikyti lynui sugriebti lyno kreipiamajame griovelyje;

padavimo mechanizmo svirtį (242) lynui nukreipti tarp būgno ir lyno kreipiamojo griovelio, kuri yra nejudama atramos atžvilgiu, ir

atraminę kreipiamąją (260) lynui nukreipti tarp lyno kreipiamojo griovelio ir neapkrautojo lyno galo,

kur būgnas sukasi atraminės kreipiamosios atžvilgiu ir atraminė kreipiamoji yra sumontuota ant spyruoklės, kad galėtų judėti iš esmės lygiagrečiai suktuvo būgno sukimosi ašiai, ant atraminės kreipiamosios yra atraminė briauna (266), iš dalies besitęsianti aplink savaeigį mechanizmą taip, kad uždengtų dalį lyno kreipiamojo griovelio ir atraminė kreipiamoji papildomai riboja bent vieną angos (272), esančios šalia atraminės briaunos, pusę,

b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad suktuvas gali suktis pirmyn bei atgal ir šalia atraminės briaunos esančios angos dydis yra pritaikytas lynui per ją praleisti, suktuvui sukantis atgal, ir atraminė briauna laiko lyną lyno kreipiamajame

kanale, atraminė briauna tęsiasi daugiau kaip per 45° aplink savaeigį mechanizmą, kur atraminė briauna turi atbulinio vyniojimo kreipiamąją dalį (268), esančią šalia angos, pro kurią praleidžiamas lynas, ir atraminės briaunos priešiniame apskritimo formos gale yra kūginė dalis (270), atbulinio vyniojimo kreipiamoji dalis bei kūginė dalis yra nuolaidaus profilio nuo angos per visą atraminę briauną ašine kryptimi ir atbulinio vyniojimo kreipiamosios dalies nuolydis yra didesnis už kūginės dalies nuolydį.

2. Suktuvas pagal 1 punktą, kur bent viršutinis arba apatinis lyno kreipiamasis žiedas yra sumontuotas ant spyruoklės, kad jie būtų spaudžiami vienas prie kito.

3. Suktuvas pagal 2 punktą, kur atraminė kreipiamoji yra sumontuota per tą patį spyruoklinį įtaisą, kaip ir viršutinis ir (arba) apatinis lyno kreipiamasis žiedas.

4. Suktuvas pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 3, kur esant normalioms suktuvo naudojimo sąlygoms, lyno kreipiamojo griovelio plotis aplink savaeigį mechanizmą yra nekintamas.

5. Suktuvas pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 4, kur atraminė briauna tęsiasi mažiau nei per 180° aplink savaeigį mechanizmą.

6. Suktuvas pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 5, kur atraminė briauna tęsiasi daugiau nei per 90° aplink savaeigį mechanizmą.

7. Suktuvas pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 6, kur atraminė briauna, būgnui sukantis, yra nejudama dėl fiksuojamojo sukibimo su padavimo mechanizmo svirtimi.

8. Suktuvas pagal 7 punktą, kur fiksuojamasis sukibimas netrukdo atraminei kreipiamajai judėti ašine kryptimi link jos spyruoklinio įtaiso.

9. Suktuvas pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 8, kur savaeigis mechanizmas apima atbulinio lyno vyniojimo trauktuvą (276), besitęsiantį į lyno kreipiamąjį griovelį priešinga atbuliniam lyno vyniojimui kryptimi.

---

(51) Int.Cl. ***C07D 207/34*** (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
A61K 31/40 (2006.01)
A61K 31/4155 (2006.01)
A61K 31/4178 (2006.01)
A61K 31/422 (2006.01)
A61K 31/4245 (2006.01)
A61K 31/427 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)
A61P 3/06 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)
A61P 9/10 (2006.01)

(11) **2308838**
(96) 09794416.9
(96) 2009-07-07
(97) 2011-04-13
(97) 2016-02-17
(86) PCT/JP2009/062331
(86) 2009-07-07
(87) WO 2010/004972
(87) 2010-01-14

(30) 2008178377, 2008-07-08, JP

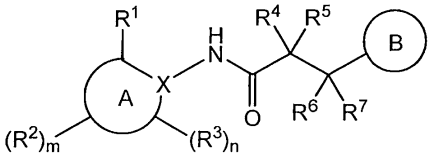
(72) SUZUKI, Keiko, JP
YAMAGUCHI, Takahiro, JP
TAMURA, Akihiro, JP
NISHIZAWA, Tomohiro, JP
YAMAGUCHI, Mitsuhiro, JP

(73) Daiichi Sankyo Company, Limited, Chuo-ku Tokyo 103-8426, JP

(74) Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

(54) Azoto turintis aromatinis heterociklinis junginys
Apibrėžties punktai: 35, brėžiniai: 0.

(57) 1. Junginys, išreikštas pateikta bendra formule (I) arba farmakologiškai priimtina jo druska



(I)

kur A įskaitant X reiškia pirolilo grupę ir X reiškia anglies atomą; arba A įskaitant X reiškia pirazolilo grupę,

R^1 reiškia karboksi grupę, karboksimetilo grupę arba tetrazolilo grupę,

kiekvienas R^2 nepriklausomai reiškia grupę, parinktą iš pakaito grupės α,

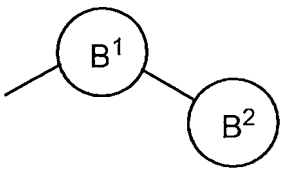
kiekvienas R^3 nepriklausomai reiškia fenilo grupę, pakeistą fenilo grupę, kur pakaitas (-ai) reiškia 1-4 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaito grupės α, 5- arba 6-narės aromatinės heterociklinės grupės, pakeistos 5- arba 6-narės aromatinės heterociklinės grupės, kur pakaitas (-ai) reiškia 1-4 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaito grupės α, fenil(C_1-C_6alkil) grupės, pakeistos fenil(C_1-C_6alkil) grupės, kur pakaitas (-ai) reiškia 1- 4 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaito grupės α, 5- arba 6-narės aromatinės heterociklil(C_1-C_6alkil) grupės arba pakeistos 5- arba 6-narės aromatinės heterociklil(C_1-C_6alkil) grupė, kur pakaitas (-ai) reiškia 1-4 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaito grupės α,

m reiškia 0, 1, 2 arba 3,

n reiškia 0 arba 1, su sąlyga, kad kai m yra 3, n yra 0,

kiekvienas iš R^4, R^5, R^6 ir R^7 nepriklausomai reiškia vandenilio atomą, C_1-C_6alkilo grupę, halogeno (C_1-C_6alkil) grupę, hidroksi grupę, C_1-C_6alkoksi grupę arba halogeno grupę,

B reiškia naftilo grupę, pakeistą naftilo grupę, kur pakaitas (-ai) reiškia 1-4 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaito grupės α, 9- arba 10-narės aromatinės heterociklinės grupės, pakeistos 9- arba 10-narės aromatinės heterociklinės grupės kur pakaitas (-ai) reiškia 1-4 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaitų grupės α arba grupės, išreikštos pateikta formule (II)

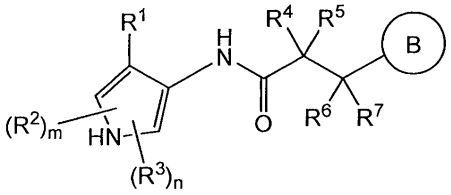


(II)

kur kiekvienas iš B^1 ir B^2 nepriklausomai reiškia fenilo grupę, pakeistą fenilo grupę, kur pakaitas (-ai) reiškia 1-4 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaito grupės α, 5- arba 6-narės aromatinės heterociklinės grupės arba pakeistos 5- arba 6-narės aromatinės heterociklinės grupės, kur pakaitas (-ai) reiškia 1-4 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaito grupės α, ir

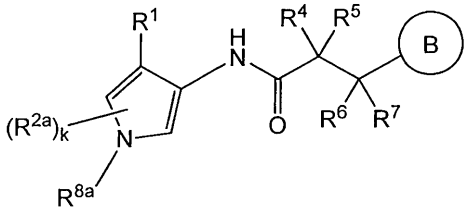
pakaito grupė α reiškia grupę, susidedančią iš C_1-C_6alkilo grupės, hidroksi(C_1-C_6alkil) grupės, (C_1-C_6alkoksi)-(C_1-C_6alkil) grupės, halogen(C_1-C_6alkil) grupės, (C_3-C_8cikloalkil)-(C_1-C_6alkil) grupės, C_3-C_8cikloalkilo grupės, C_2-C_6alkenilo grupės, C_2-C_6alkinilo grupės, hidroksi grupės, C_1-C_6alkoksi grupės, halogen(C_1-C_6alkoksi) grupės, C_1-C_6alkiltio grupės, C_1-C_6alkilsulfinilo grupės, C_1-C_6alkilsulfonilo grupės, amino grupės, C_1-C_6alkilamino grupės, di(C_1-C_6alkil) amino grupės, formilamino grupės, (C_1-C_6alkil)karbonilamino grupės, (C_1-C_6alkoksi)karbonilamino grupės, (C_1-C_6alkil) sulfonilamino grupės, formilo grupės, (C_1-C_6alkil)karbonilo grupės, karboksi grupės, (C_1-C_6alkoksi)karbonilo grupės, karbamoilo grupės, (C_1-C_6alkilamino)karbonilo grupės, di(C_1-C_6alkil)aminokarbonilo grupės, aminosulfonilo grupės, (C_1-C_6alkilamino)sulfonilo grupės, di(C_1-C_6alkil)aminosulfonilo grupės, ciano grupės, nitro grupės ir halogeno grupės.

2. Junginys pagal 1 punktą arba jo farmakologiškai priimtina druska, kuris yra išreikštas pateikta bendra formule (I-1)



(I-1)

3. Junginys pagal 1 punktą arba jo farmakologiškai priimtina druska, kuris yra išreikštas pateikta bendra formule (I-3):



(I-3)

kur R^{8a} reiškia vandenilio atomą, C_1-C_6alkilo grupę, hidroksi(C_1-C_6alkil) grupę, (C_1-C_6alkoksi)-(C_1-C_6alkil) grupę, halogen(C_1-C_6alkil) grupę, (C_3-C_8cikloalkil)-(C_1-C_6alkil) grupę, C_3-C_8cikloalkilo grupę, C_2-C_6alkenilo grupę, C_2-C_6alkinilo grupę, C_1-C_6alkilsulfonilo grupę, formilo grupę, (C_1-C_6alkil)karbonilo grupę, (C_1-C_6alkoksi)karbonilo grupę, karbamoilo grupę, (C_1-C_6alkilamino)karbonilo grupę, di(C_1-C_6alkil)aminokarbonilo grupę, aminosulfonilo grupę, (C_1-C_6alkilamino) sulfonilo grupę arba di(C_1-C_6alkil)aminosulfonilo grupę,

kiekvienas R^{2a} nepriklausomai reiškia C_1-C_4 alkilo grupę, halogen(C_1-C_4alkil) grupę, (C_3-C_6cikloalkil)-(C_1-C_4alkil) grupę, C_3-C_6cikloalkilo grupę, C_2-C_4alkenilo grupę, C_2-C_4alkinilo grupę, hidroksi grupę, C_1-C_4alkoksi grupę, formilo grupę, (C_1-C_4alkil)karbonilo grupę, ciano grupę arba halogeno grupę, ir

k reiškia 0, 1 arba 2.

4. Junginys pagal 3 punktą arba jo farmakologiškai priimtina druska, kur

R^{8a} reiškia vandenilio atomą, C_1-C_4alkilo grupę, (C_1-C_2alkoksi)-(C_1-C_4alkil) grupę, (C_3-C_6cikloalkil)-(C_1-C_4alkil) grupę, halogen(C_1-C_4alkil) grupę, C_3-C_6cikloalkilo grupę, C_2-C_4alkenilo grupę arba C_2-C_4alkinilo grupę,

kiekvienas R^{2a} reiškia C_1-C_2alkilo grupę, halogen(C_1-C_2alkil) grupę, kur halogeno grupė reiškia 1-5 grupes, parinktas iš grupės, susidedančios iš fluoro grupės ir chloro grupės, C_3-C_4cikloalkilo grupės, ciano grupės, fluoro grupės arba chloro grupės, ir

k reiškia 0 arba 1.

5. Junginys pagal 3 punktą arba jo farmakologiškai priimtina druska, kur

R^{8a} reiškia C_1-C_4alkilo grupę, ir

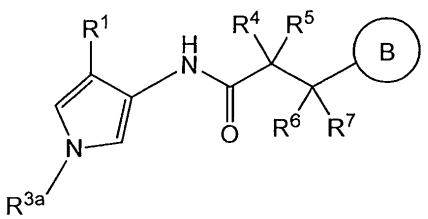
k reiškia 0.

6. Junginys pagal 3 punktą arba jo farmakologiškai priimtina druska, kur

R^{8a} reiškia etilo grupę, ir

k reiškia 0.

7. Junginys pagal 1 punktą arba jo farmakologiškai priimtina druska, kuris yra išreikštas pateikta bendra formule (I-4)



(I-4)

kur R^{3a} reiškia fenil(C_1-C_2alkil) grupę arba pakeistą fenil(C_1-C_2alkil) grupę, kur pakaitas (-ai) reiškia 1-3 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaito grupės α1, ir

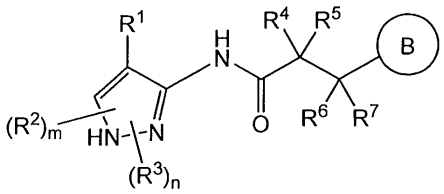
pakaito grupė α1 reiškia grupę, susidedančią iš C_1-C_2alkilo grupės, halogen(C_1-C_2alkil) grupės, kur halogeno grupė (-ės) reiškia 1-5 grupes, parinktas iš grupės, susidedančios iš fluoro grupės ir chloro grupės, fluoro grupės, ir chloro grupės.

8. Junginys pagal 7 punktą arba jo farmakologiškai priimtina druska, kur

R^{3a} reiškia fenilmetilo grupę arba pakeistą fenilmetilo grupę, kur pakaitas (-ai) reiškia 1-3 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaito grupės α2, ir

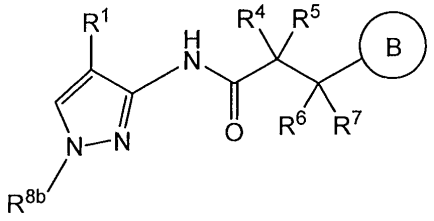
pakaito grupė α2 reiškia grupę, susidedančią iš metilo grupės, trifluormetilo grupės, ir fluoro grupės.

9. Junginys pagal 1 punktą arba jo farmakologiškai priimtina druska, kuris yra išreikštas pateikta bendra formule (I-2)



(I-2)

10. Junginys pagal 1 punktą arba jo farmakologiškai priimtina druska, kuris yra išreikštas pateikta bendra formule (I-5)



(I-5)

kur R^{8b} reiškia vandenilio atomą, C_1-C_4alkilo grupę, (C_1-C_2alkoksi)-(C_1-C_4alkil) grupę, halogen(C_1-C_4alkil) grupę, C_3-C_6cikloalkilo grupę, C_2-C_4alkenilo grupę arba C_2-C_4alkilo grupę.

11. Junginys pagal 10 punktą arba jo farmakologiškai priimtina druska, kur R^{8b} reiškia C_1-C_4alkilo grupę.

12. Junginys pagal bet kurį iš 1-11 punktų arba jo farmakologiškai priimtina druska, kur R^1 reiškia karboksi grupę.

13. Junginys pagal bet kurį iš 1-12 punktų arba jo farmakologiškai priimtina druska, kur kiekvienas iš R^4, R^5, R^6 ir R^7 nepriklausomai reiškia vandenilio atomą, C_1-C_2alkilo grupę, halogen(C_1-C_2alkil) grupę, kur halogeno grupė (-ės) reiškia 1-5 grupes, parinktas iš grupės, susidedančios iš fluoro grupės ir chloro grupės, fluoro grupės arba chloro grupės.

14. Junginys pagal bet kurį iš 1-12 punktų arba jo farmakologiškai priimtina druska, kur kiekvienas iš R^4, R^5, R^6 ir R^7 nepriklausomai reiškia vandenilio atomą arba fluoro grupę.

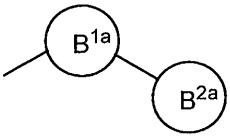
15. Junginys pagal bet kurį iš 1-12 punktų arba jo farmakologiškai priimtina druska, kur kiekvienas iš R^4 ir R^5 nepriklausomai reiškia vandenilio atomą arba fluoro grupę ir R^6 ir R^7 kiekvienas reiškia vandenilio atomą.

16. Junginys pagal bet kurį iš 1-15 punktų arba farmakologiškai priimtina druska, kur

B reiškia naftilo grupę arba pakeistą naftilo grupę, kur pakaitas (-ai) reiškia 1-3 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaito grupės α3, ir

pakaito grupė α3 reiškia grupę, susidedančią iš C_1-C_2alkilo grupės, halogen(C_1-C_2alkil) grupės, kur halogeno grupė (-ės) reiškia 1-5 grupes, parinktas iš grupės, susidedančios iš fluoro grupės ir chloro grupės, hidroksi grupės, C_1-C_2alkoksi grupės, fluoro grupės ir chloro grupės.

17. Junginys pagal bet kurį iš 1-15 punktų arba farmakologiškai priimtina druska, kur B reiškia grupę, išreikštą šia formule (IIa)



(IIa)

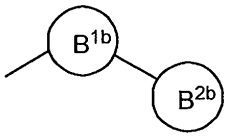
kur B^{1a} reiškia fenilo grupę, pakeistą fenilo grupę, kur pakaitas (-ai) reiškia 1-3 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaito grupės α4, 5-narės aromatinės heterociklinės grupės arba pakeistos 5-narės aromatinės heterociklinės grupės, kur pakaitas (-ai) reiškia 1-3 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaitų grupės α4,

B^{2A} reiškia fenilo grupę, pakeistą fenilo grupę, kur pakaitas (-ai) reiškia 1-3 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaitų grupės α5, piridilo grupės arba pakpakeistos piridilo grupės, kur pakaitas (-ai) reiškia 1-3 grupes, nepriklausomai pasirinktas iš pakaito grupės α5,

pakaito grupė α4 reiškia grupę, susidedančią iš C_1-C_4alkilo grupės, halogen(C_1-C_4alkil) grupės, (C_3-C_6cikloalkil)-(C_1-C_4alkil) grupės, C_3-C_6cikloalkilo grupės, C_1-C_4alkoksi grupės, formilo grupės, (C_1-C_4alkil)karbonilo grupės, ciano grupės, fluoro grupės, chloro grupės ir bromo grupės, ir

pakaito grupė α5 reiškia grupę, susidedančią iš C_1-C_4alkilo grupės, halogen(C_1-C_4alkil) grupės, hidroksi grupės, C_1-C_4alkoksi grupės, fluoro grupės, chloro grupės ir bromo grupės.

18. Junginys pagal bet kurį iš 1-15 punktų arba jo farmakologiškai priimtina druska, kur B reiškia grupę, išreikštą šia formule (IIb)



(IIb)

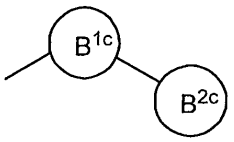
kur B^{1b} reiškia azoto turinčią 5-narę aromatinę heterociklinę grupę arba pakeistą azoto turinčią 5-narę aromatinę heterociklinę grupę, kur pakaitas (-ai) reiškia 1 arba 2 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaito grupės α6,

B^{2b} reiškia fenilo grupę, pakeistą fenilo grupę, kur pakaitas (-ai) reiškia 1 arba 2 grupes, nepriklausomai parinktas iš pakaito grupės α7, piridilo grupės arba pakeistos piridilo grupės, kur pakaitas (-ai) reiškia 1 arba 2 grupes, nepriklausomai pasirinktas iš pakaito grupės α7,

pakaito grupė α6 reiškia grupę, susidedančią iš C_1-C_4alkilo grupės, halogen(C_1-C_2 alkil) grupės, kur halogeno grupė (-ės) reiškia 1-5 grupes, parinktas iš grupės, susidedančios iš fluoro grupės ir chloro grupės, (C_3-C_4cikloalkil)-(C_1-C_2alkil) grupės, C_3-C_4cikloalkilo grupės, (C_1-C_2alkil)karbonilo grupės, ciano grupės, fluoro grupės ir chloro grupės, ir

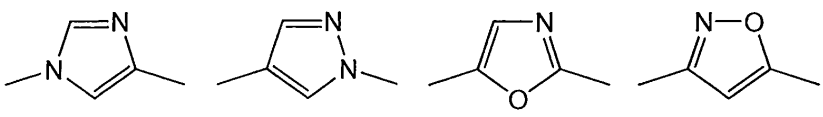
pakaito grupė α7 reiškia grupę, susidedančią iš C_1-C_2alkilo grupės, hidroksi grupės, fluoro grupės ir chloro grupės.

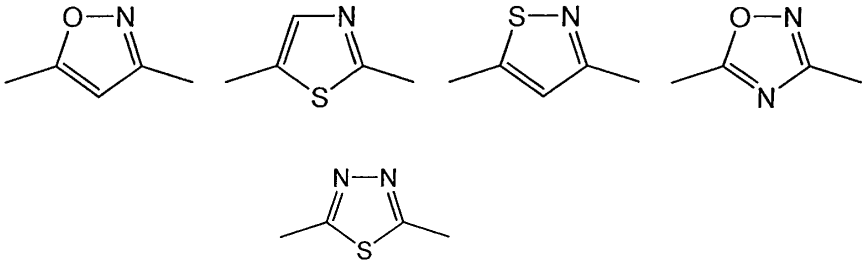
19. Junginys pagal bet kurį iš 1-15 punktų arba jo farmakologiškai priimtina druska, kur B reiškia grupę, išreikštą pateikta formule (IIc)



(IIc)

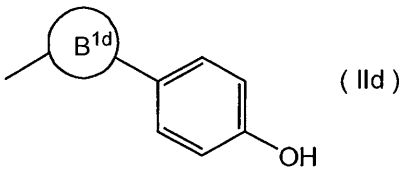
kur B^{1c} reiškia grupę, parinktą iš toliau pateiktų grupių arba grupės, kuri yra parinkta iš toliau pateiktų grupių ir pakeista, kur pakaitas reiškia vieną grupę, nepriklausomai parinktą iš pakaito grupės α8





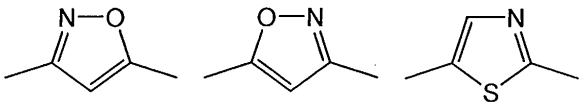
B^{2C} reiškia fenilo grupę arba 4-hidroksifenilo grupę, ir
pakaito grupė α8 reiškia grupę, susidedančią iš C_1-C_4alkilo grupės, halogen(C_1-C_2alkil) grupės, kur halogeno grupė (-s) reiškia 1-5 grupes, parinktas iš grupės, susidedančios iš fluoro grupės ir chloro grupės, ciklopropilo grupės, metilkarbonilo grupės, ciano grupės, fluoro grupės ir chloro grupės.

20. Junginys pagal bet kurį iš 1-15 puktų arba jo farmakologiškai priimtina druska, kur B reiškia grupę, išreikštą pateikta formule (IId)



(IId)

kur B^{1D} reiškia grupę, parinktą iš toliau pateiktų grupių arba grupės, kuri yra parinkta iš toliau pateiktų grupių ir pakeista, kur pakaitas reiškia vieną grupę, parinktą iš pakaito grupės α9



ir pakaito grupė α9 reiškia grupę, susidedančią iš metilo grupės, etilo grupės ir chloro grupės.

21. Junginys pagal 1 punktą arba jo farmakologiškai priimtina druska, kuris yra parinktas iš grupės, susidedančios iš
4-{3-[2-(4-hidroksifenil)tiazol-5-il]propanoil}amino-1-etilpirolo-3-karboksirūgšties;
4-{3-[2-(4-hidroksifenil)tiazol-5-il]-2-fluorpropanoil}amino-1-etilpirolo-3-karboksirūgšties;
4-{3-[3-(4-hidroksifenil)-4-etilizoksazol-5-il]propanoil}amino-1-etilpirolo-3-karboksirūgšties;
4-{3-[4-chlor-(4-hidroksifenil)izoksazol-5-il]propanoil}amino-1-etilpirolo-3-karboksirūgšties;
4-{3-[4-etil-(4-hidroksifenil)izoksazol-5-il]propanoil}amino-1-etilpirolo-3-karboksirūgšties;
4- 3-[(4-hidroksifenil)-4-metilizoksazol-5-il]propanoil}amino-1-etilpirolo-3-karboksirūgšties;
4-{3-[2-(4-hidroksifenil)tiazol-5-il]-2,2-difluorpropanoil}amino-1-etilpirolo-3-karboksirūgšties;
4-{3-[4-etil-3-(4-hidroksifenil)izoksazol-5-il]-2,2-difluorpropanoil}amino-1-etilpirolo-3-karboksirūgšties;
4-{3-[4-etil-5-(4-hidroksifenil)izoksazol-3-il]-2,2-difluorpropanoil}amino-1-etilpirolo-3-karboksirūgšties;
4- {3-[4-chlor-5-(4-hidroksifenil)izoksazol-3-il]-2,2-fluorpropanoil}amino-1-etilpirolo-3-karboksirūgšties;
4-{3-[3-(4-hidroksifenil)izoksazol-5-il]-2-fluorpropanoil}amino-1-etilpirolo-3-karboksirūgšties; ir
4- {3-[3-(4-hidroksifenil)izoksazol-5-il]-2,2-difluorpropanoil}amino-1-etilpirolo-3-karboksirūgšties.

22. Farmacinė kompozicija, apimanti, kaip aktyvų ingredientą, junginį pagal bet kurį iš 1-21 punktų arba jo farmakologiškai priimtiną druską.

23. Farmacinė kompozicija pagal 22 punktą, kuri yra skirta naudoti hiperlipidemijos, dislipidemijos, lipidų metabolizmo sutrikimo, aterosklerozės arba II tipo cukrinio diabeto gydyme arba profilaktikoje.

24. Farmacinė kompozicija pagal 22 punktą, kuri yra skirta naudoti dislipidemijos gydyme arba profilaktikoje.

25. Farmacinė kompozicija pagal 22 punktą, kuri yra skirta naudoti lipidų metabolizmo sutrikimo gydyme arba profilaktikoje.

26. Farmacinė kompozicija pagal 22 punktą, kuri yra skirta naudoti hipertrigliceridemijos arba nealkoholinio steatohepatito gydyme arba profilaktikoje.

27. Junginys pagal bet kurį iš 1-21 punktų arba jo farmakologiškai priimtina druska, skirti naudoti hiperlipidemijos, dislipidemijos, lipidų metabolizmo sutrikimo, aterosklerozės arba II tipo cukrinio diabeto gydyme arba profilaktikoje.

28. Junginys pagal bet kurį iš 1-21 punktų arba jo farmakologiškai priimtina druska, skirti naudoti dislipidemijos gydyme arba profilaktikoje.

29. Junginys pagal bet kurį iš 1-21 punktų arba jo farmakologiškai priimtina druska, skirti naudoti lipidų metabolizmo sutrikimo gydyme arba profilaktikoje.

30. Junginys pagal bet kurį iš 1-21 punktų arba jo farmakologiškai priimtina druska, skirti naudoti hipertrigliceridemijos arba nealkoholinio steatohepatito gydyme arba profilaktikoje.

31**.** Junginys pagal bet kurį iš 1-21 punktų arba jo farmakologiškai priimtina druska, skirti naudoti kaip vaistas.

32. Junginio pagal bet kurį iš 1-21 punktų arba jo farmakologiškai priimtinos druskos panaudojimas vaisto, skirto naudoti hiperlipidemijos, dislipidemijos, lipidų metabolizmo sutrikimo, aterosklerozės arba II tipo cukrinio diabeto gydyme arba profilaktikoje, gamyboje.

33. Junginio pagal bet kurį iš 1-21 punktų arba jo farmakologiškai priimtinos druskos panaudojimas vaisto, skirto naudoti dislipidemijos gydyme arba profilaktikoje, gamyboje.

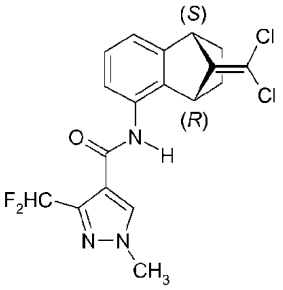
34. Junginio bet kurį iš 1-21 punktų arba jo farmakologiškai priimtinos druskos panaudojimas vaisto, skirto naudoti lipidų metabolizmo sutrikimo gydyme arba profilaktikoje, gamyboje.

35. Junginio bet kurį iš 1-21 punktų arba jo farmakologiškai priimtinos druskos panaudojimas vaisto, skirto naudoti hipertrigliceridemijos arba nealkoholinio steatohepatito gydyme arba profilaktikoje, gamyboje.

---

(51) Int.Cl. ***C07D 231/14*** (2006.01)
(11) **2814813**
(96) 13703616.6
(96) 2013-02-13
(97) 2014-12-24
(97) 2016-02-10
(86) PCT/EP2013/052803
(86) 2013-02-13
(87) WO 2013/120860
(87) 2013-08-22
(30) 12155526, 2012-02-15, EP
12173642, 2012-06-26, EP
12177606, 2012-07-24, EP
12182799, 2012-09-03, EP
(72) SMEJKAL, Tomas, CH
(73) Syngenta Participations AG, 4058 Basel, CH
(74) Liudmila GERASIMOVIČ, 9, IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius, LT
(54) Pirazolo karboksamido stereoselektyvios gamybos būdas
Apibrėžties punktai: 13, brėžiniai: 0.

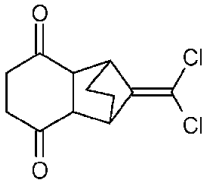
(57) 1**.** 3-difluormetil-1-metil-1H-pirazol-4-karboksirūgšties ((1S,4R)-9-dichlormetilen-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metano-naftalen-5-il)amido formulės Ib



(Ib),

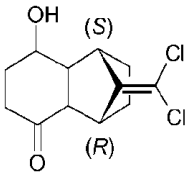
enantioselektyvios gamybos būdas, kuriame:

a) junginį formulės II



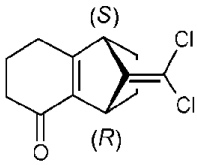
(II),

redukuoja enantioselektyviu reagentu, siekiant gauti junginį formulės IIIe



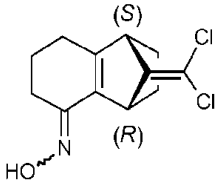
(IIIe),

b) junginį formulės IIIe dehidratuoja esant rūgščiai, siekiant gauti junginį formulės IVa



(IVa),

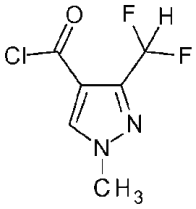
c) junginį formulės IVa veikia hidroksilaminu, siekiant gauti junginį formulės Va:



(Va),

ir

d) junginio formulės Va oksimo deguonį acilina esant tirpikliui ir acilinimo agentui ir po to gautą produktą veikia junginiu formulės VI:



(VI),

arba

e) junginį formulės V veikia junginio formulės VI pertekliumi.

2. Būdas pagal 1 punktą, kur junginį formulės II enantioselektyviai redukuoja hidrinimu esant pereinamojo metalo katalizatoriui.

3. Būdas pagal 1 punktą, kur junginį formulės II enantioselektyviai redukuoja hidrinimu su perkėlimu esant pereinamojo metalo katalizatoriui.

4. Būdas pagal 1 punktą, kur enantioselektyvus reagentas yra rutenio katalizatorius.

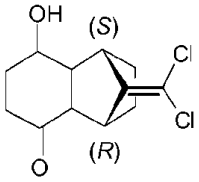
5. Būdas pagal 2 punktą, kur enantioselektyvus reagentas yra rutenio katalizatorius.

6. Būdas pagal 3 punktą, kur enantioselektyvus reagentas yra rutenio katalizatorius.

7. Būdas pagal 1 punktą, kur enantioselektyvus reagentas yra chlor{(R)-(+)-2,2'-bis[di(3,5-ksilil)fosfino]-1,1'-binaftil} [(2R)-(-)-1-(4-metoksifenil)-1'-(4-metoksifenil-kC)-3-metil-1,2-butandiamin]rutenis(II).

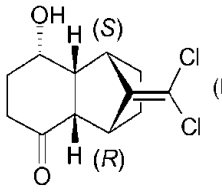
8. Būdas pagal 1 punktą, kur enantioselektyvus reagentas yra dichlor[(4S,5S)-(+)-4,5-bis(difenilfosfinometil)-2,2-dimetil-1,3-dioksolan][(S)-(-)-2-(α-metilmetanamin)-1H-benzimidazol]rutenis (II).

9. Junginys (1*S*,4*R*)-9-dichlormetilen-8-hidroksi-oktahidro-1,4-metanonaftalen-5-onas, kurio formulė IIIe

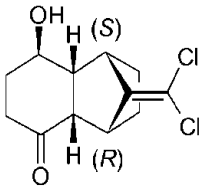


(IIIe),

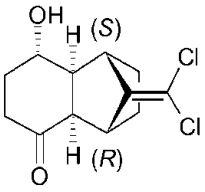
ir jo izomerai, kurių formulės IIIf - IIIm:



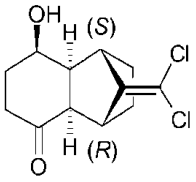
(IIIf)



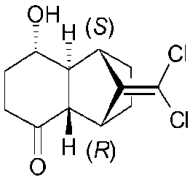
(IIIg)



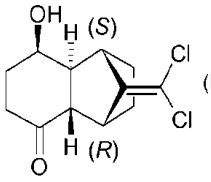
(IIIh)



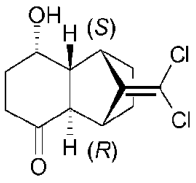
(IIIi)



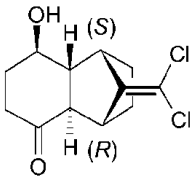
(IIIj)



(IIIk)

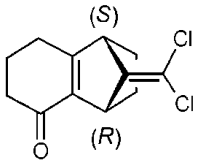


(IIIL)



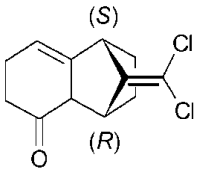
(IIIm)

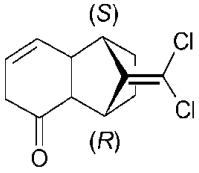
10. Junginys (1S,4R)-9-dichlormetilen-2,3,4,6,7,8-heksahidro-1H-1,4-metanonaftalen-5-onas, kurio formulė

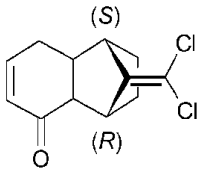


(IVa),

ir jo izomerai, kurių formulės IVb, IVc ir IVd

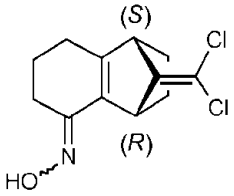


(IVb)


(IVc)


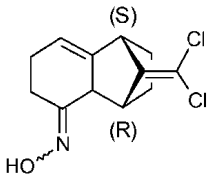
(IVd).

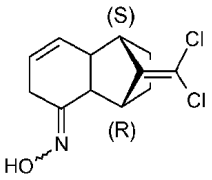
11. Junginys (1S,4R)-9-dichlormetilen-2,3,4,6,7,8-heksahidro-1H-1,4-metanonaftalen-5-ono oksimas, kurio formulė Va

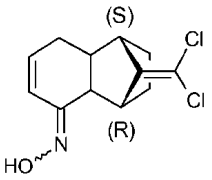


(Va),

ir jo izomerai, kurių formulės Vb, Vc ir Vd:

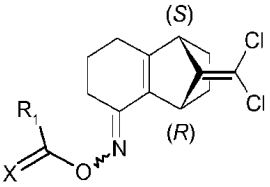


(Vb)


(Vc)


(Vd).

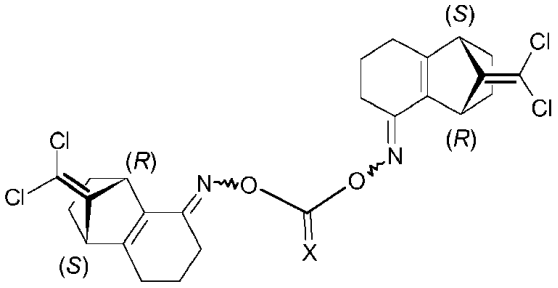
12. Junginys, kurio formulė XXIIIa



(XXIIIa),

kur X yra deguonis arba siera, R_1 yra C_1-C_6-alkoksi, CH_3-C(=CH_2)-O-, fenoksi arba trichlormetoksi.

13. Junginys, kurio formulė XXIVa



(XXIVa),

kur X yra deguonis arba siera.

(51) Int.Cl. ***C07D 231/54*** (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
A61K 31/416 (2006.01)
A61K 31/435 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)
A61P 13/00 (2006.01)

(11) **2262777**

(96) 09718101.0

(96) 2009-03-06

(97) 2010-12-22

(97) 2016-02-24

(86) PCT/EP2009/052660

(86) 2009-03-06

(87) WO 2009/109654

(87) 2009-09-11

(30) 08425141, 2008-03-07, EP

(72) GUGLIELMOTTI, Angelo, IT
FURLOTTI, Guido, IT
MANGANO, Giorgina, IT
CAZZOLLA, Nicola, IT

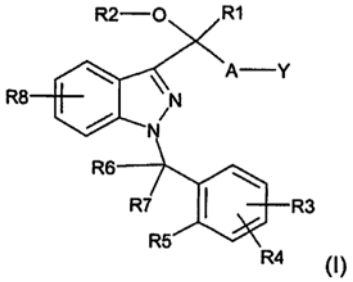
(73) Aziende Chimiche Riunite Angelini Francesco A.C.R.A.F. S.p.A., 00181 Roma, IT

(74) Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

(54) 1-Benzil-3-hidroksimetilindazolo dariniai ir jų panaudojimas gydyme ligų, pagristų MCP-1 ir CX3CR1

Apibrėžties punktai: 19, brėžiniai: 0.

(57) 1. Junginys, kurio formulė (I)



(I)

kurioje:

A gali būti $-X_1-$ arba $-X_1-O-X_2-$, kurioje

X_1 gali būti alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, pasirinktinai pakeistus viena arba daugiau alkilo grupėmis, turinčiomis 1-5 anglies atomus arba viena arba daugiau alkoksi grupėmis, turinčiomis 1-3 anglies atomus, ir

X_2 gali būti alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, pasirinktinai pakeistus viena arba daugiau alkilo grupėmis, turinčiomis 1-5 anglies atomus,

Y gali būti vandenilis, -OH, $-N(R_{11})(R_{12})$, $-N(R_{11})O(R_{12})$, kur

R_{11} gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, alkoksi grupė, turinti 1-3 anglies atomus, arba R_{11} kartu su R_{12} sudaro 4-7-narį heterociklą,

R_{12} gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, alkoksi grupė, turinti 1-3 anglies atomus, COR', COOR', CON(R')(R") kur R' ir R", kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, arba R_{12} kartu su R_{11}, sudaro 4-7-narį heterociklą,

R_1 ir R_2, kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus,

R_3, R_4 ir R_8, kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, alkoksi grupė, turinti 1-3 anglies atomus, halogeno atomas, -OH, -N(R')(R"), -N(R')COR", -CN, -CONR'R", $-SO_2NR'R"$, $-SO_2R'$, nitro ir trifluormetilą; kur R' ir R", kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus,

R_5 gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, alkoksi grupė, turinti 1-3 anglies atomus, halogeno atomas, -OH, - N(R')(R"), -N(R')COR", nitro ir trifluormetilas, arba R5 kartu su vienu iš R6 ir R7 sudaro žiedą, turintį 5 arba 6 anglies atomus; kur R' ir R", kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus,

R_6 ir R_7, kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, arba kartu sudaro grupę C=O, arba vienas iš R_6 ir R_7, kartu su R_5, sudaro žiedą, turintį 5 arba 6 anglies atomus.

2. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad X_1 gali būti alkilo grupė, turinti 1-4 anglies atomus, pasirinktinai pakeistus viena arba daugiau alkilo grupėmis, turinčiomis 1-3 anglies atomus, ir X_2 yra alkilo grupė, turinti 1-4 anglies atomus, pasirinktinai pakeistus viena arba daugiau alkilo grupių, turinčių 1-3 anglies atomus arba vieną arba daugiau alkoksi grupių, turinčių 1 arba 2 anglies atomus.

3. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad X_1 yra parinktas iš grupės, apimančios grupę CH_2, grupę CH_2CH_2, grupę $C(CH_3)_2$, arba grupę $C(CH_3)_2CH_2$ ir X_2 yra parinktas iš grupės, apimančios grupę CH_2, grupę CH_2CH_2, grupę $CH_2CH_2CH_2$, grupę $C(CH_3)_2$, grupę $C(CH_3)_2CH_2$ arba grupę $CH_2C(CH_3)_2CH_2$.

4. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad A liekana yra parinkta iš grupės, apimančios grupę CH_2, grupę $C(CH_3)_2$, grupę $CH_2OCH_2CH_2$ ir grupę $CH_2OCH_2CH_2CH_2$.

5. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad R_{11} ir R_{12}, kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, yra vandenilio atomas, alkilo grupė, turinti 1-3 anglies atomus, arba kartu sudaro 5- arba 6-narį heterociklą.

6. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad R_1 ir R_2, kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, yra vandenilio atomas arba alkilo grupė, turinti 1-3 anglies atomus.

7. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad R_3, R_4 ir R_8, kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, yra parinkti iš grupės, apimančios vandenilio atomą, alkilo grupę, turinčią 1-3 anglies atomus, alkoksi grupę, turinčią 1 arba 2 anglies atomus, Br, Cl arba F atomą, OH grupę, nitro grupę, trifluorometilo grupę arba grupę N(R') (R“), -N(R')COR“, -CN, -CONR'R“, -SO_2NR'R“, -SO_2R', kur R' ir R“, kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, yra vandenilio atomas ir alkilo grupė, turinti 1-3 anglies atomus.

8. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad R_5 yra parinktas iš grupės, apimančios vandenilio atomą, alkilo grupę, turinčią 1-3 anglies atomus, alkoksi grupę, turinčią 1 arba 2 anglies atomus, halogeno atomą, OH grupę arba R_5, kartu su vienu iš R_6 ir R_7 sudaro žiedą, turintį 5 arba 6 anglies atomus.

9. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad R_6 ir R_7, kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, yra parinkti iš grupės, apimančios vandenilio atomą, alkilo grupę, turinčią 1-3 anglies atomus, arba kartu sudaryti grupę C=O, arba vienas iš R_6 ir R_7 kartu su R_5, sudaro žiedą, turintį 5 arba 6 anglies atomus.

10. Farmacinė kompozicija, apimanti junginį, kurio formulė (I) pagal bet kurį iš ankstesnių punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską arba esterį ir bent vieną farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį.

11. Farmacinė kompozicija pagal 10 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad minėta farmaciniu požiūriu priimtiną druska yra prisijungimo druska su fiziologiniu požiūriu priimtinomis organinėmis arba mineralinėmis rūgštimis arba bazėmis.

12. Farmacinė kompozicija pagal 11 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad minėtos fiziologiniu požiūriu priimtinos rūgštys yra parinktos iš grupės, apimančios vandenilio chlorido rūgštį, vandenilio bromido rūgštį, sieros rūgštį, fosforo rūgštį, azoto rūgštį, acto rūgštį, askorbo rūgštį, benzoinę rūgštę, citrinos rūgštį, skruzdžių rūgštį, pieno rūgštį, maleino rūgštį, metansulfonrūgštį, oksalo rūgštį, para-toluensulfonrūgštį, benzenesulfonrūgštį, gintaro rūgštį, tano rūgštį ir vyno rūgštį.

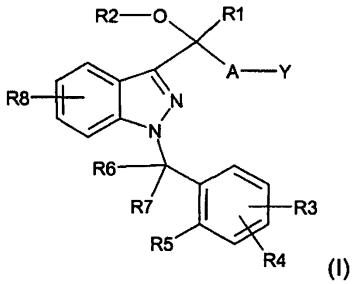
13. Farmacinė kompozicija pagal 11 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad minėtos fiziologiniu požiūriu priimtinos bazės yra parinktos iš grupės, apimančios amonio hidroksidą, kalcio hidroksidą, magnio karbonatą, natrio hidrokarbonatą, kalio hidrokarbonatą, argininą, betainą, kofeiną, choliną, N,N-dibenziletilendiaminą, dietilaminą, 2-dietilaminoetanolį, 2-dimetilaminoetanolį, etanolaminą, etilendiaminą, N-etilmorfoliną, N-etilpiperidiną, N-metilglukaminą, glukaminą, glukozaminą, histidiną, N-(2-hidroksietil)piperidiną, N-(2-hidroksietil)pirolidiną, izopropilaminą, liziną, metilglukaminą, morfoliną, piperaziną, piperidiną, teobrominą, trietilaminą, trimetilaminą, tripropilaminą ir trometaminą.

14. Farmacinė kompozicija pagal 10 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad minėtas farmaciniu požiūriu priimtinas esteris yra sudarytas su fiziologiniu požiūriu priimtinomis organinėmis rūgštimis, parinktomis iš grupės, apimančios acto rūgštį, askorbo rūgštį, benzoinę rūgštį, citrinos rūgštį, fumaro rūgštį, pieno rūgštį, maleino rūgštį, metansulfonrūgštį, oksalo rūgštį, para-toluensulfonrūgštį, benzensulfonrūgštį, gintaro rūgštį, tano rūgštį ir vyno rūgštį.

15. Farmacinė kompozicija pagal bet kurį iš 10-14 punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad minėta kompozicija turi junginio, kurio formulė (I), stereoizomerą arba enantiomerą arba farmaciniu požiūriu priimtiną druską, arba jo esterį, arba jų mišinį.

16. Farmacinė kompozicija pagal bet kurį iš 10-15 punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad minėtas farmaciniu požiūriu priimtinas nešiklis yra parinktas iš grupės, apimančios slydiklius, rišiklius, dezintegrantus, užpildus, skiediklius, kvapiąsias medžiagas, dažiklius, takumo agentus, riebiklius, konservuojančius agentus, drėkiklius, absorbentus ir saldiklius.

17. Panaudojimas junginio, kurio formulė (I)



(I)

kurioje:

A gali būti -X_1- arba -X_1-O-X_2-, kur

X_1 gali būti alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, pasirinktinai pakeistus viena arba daugiau alkilo grupių, turinčių 1-5 anglies atomus arba vieną arba daugiau alkoksi grupių, turinčių 1-3 anglies atomus, ir

X_2 gali būti alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, pasirinktinai pakeistus viena arba daugiau alkilo grupių, turinčių 1-5 anglies atomus,

Y gali būti vandenilis, -OH, -N(R_{11})(R_{12}), -N(R_{11})O(R_{12}), kur

R_{11} gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, alkoksi grupė, turinti 1-3 anglies atomus, arba R_{11} kartu su R_{12} sudaro 4-7-narį heterociklą,

R_{12} gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, alkoksi grupė, turinti 1-3 anglies atomus, COR', COOR', CON(R')(R") kur R' ir R", kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, arba R_{12} kartu su R_{11}, sudaro 4-7-narį heterociklą,

R_1 ir R_2, kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus,

R_3, R_4 ir R_8, kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, alkoksi grupė, turinti 1-3 anglies atomus, halogeno atomas, -OH, -N(R')(R"), -N(R')COR", -CN, -CONR'R", -SO_2NR'R", -SO_2R', nitro ir trifluormetilą; kur R' ir R", kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus,

R_5 gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, alkoksi grupė, turinti 1-3 anglies atomus, halogeno atomas, -OH, - N(R')(R"), -N(R')COR", nitro ir trifluormetilas, arba R_5 kartu su vienu iš R_6 ir R_7 sudaro žiedą, turintį 5 arba 6 anglies atomus; kur R' ir R", kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus,

R_6 ir R_7, kurie gali būti identiški arba skirtis vienas nuo kito, yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti 1-5 anglies atomus, arba kartu sudaro grupę C=O, arba vienas iš R_6 ir R_7, kartu su R_5, sudaro žiedą, turintį 5 arba 6 anglies atomus,

gamyboje farmacinės kompozicijos, skirtos gydymui ligų, pagrįstų MCP-1 ir CX3CR1 ekspresija, parinktų iš grupės, apimančios sąnarių ligas, inkstų ligas, širdies ir kraujagyslių ligas, metabolinį sindromą, nutukimą, diabetą, atsparumą insulinui ir vėžį.

18. Panaudojimas pagal 17 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos ligos, pagrįstos MCP-1 ekspresija, yra parinktos iš grupės, apimančios reumatoidinį artritą, virusinės infekcijos sukeltą artritą, psoriazinį artritą, artrozę, inkstų vilkligę, diabetinę nefropatiją, glomerulonefritą, policistinę inkstų ligą, intersticinę plaučių ligą, fibrozę, dauginę sklerozę, Alzheimerio ligą, su ŽIV susijusią demenciją, atopinį dermatitą, psoriazę, vaskulitą, restenozę, aterosklerozę, miokardo infarktą, anginą, ūmias koronarines ligas, adenomas, karcinomas ir metastazes, ir metabolines ligas.

19. Panaudojimas pagal 17 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos ligos, pagrįstos MCP-1 ekspresija, yra parinktos iš grupės, apimančios reumatoidinį artritą, inkstų vilkligę, diabetinę nefropatiją, Krono ligą, opinį kolitą, koronarines ligas, restenozes, aterosklerozę, miokardo infarktą ir anginą.

(51) Int.Cl. ***C07D 231/56*** (2006.01)
A61K 31/415 (2006.01)
A61P 13/00 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)

(11) **2254870**

(96) 09718467.5

(96) 2009-03-05

(97) 2010-12-01

(97) 2016-02-24

(86) PCT/EP2009/052590

(86) 2009-03-05

(87) WO 2009/109618

(87) 2009-09-11

(30) 08425139, 2008-03-07, EP

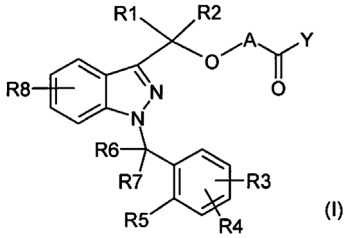
(72) GUGLIELMOTTI, Angelo, IT
FURLOTTI, Guido, IT
MANGANO, Giorgina, IT
CAZZOLLA, Nicola, IT
GAROFALO, Barbara, IT

(73) Aziende Chimiche Riunite Angelini Francesco A.C.R.A.F. S.p.A., 00181 Roma, IT

(74) Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

(54) 1-Benzil-3-hidroksimetilindazolo dariniai ir jų panaudojimas ligų, susijusių su MCP-1, CX3CR1 ekspresija, gydyme
Apibrėžties punktai: 25, brėžiniai: 0.

(57) 1. Junginys, kurio formulė (I)



(I)

kurioje:

A gali būti -X_1- arba -X_1-OC(R_9)(R_{10})-, kurioje

X_1 gali būti alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, pasirinktinai pakeista viena ar daugiau alkilo grupių, turinčių nuo 1 iki 5 anglies atomų, arba viena arba daugiau alkoksi grupių, turinčių nuo 1 iki 3 anglies atomų, ir R_9 ir R_{10}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų arba alkoksi grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų,

Y gali būti N(R_{11})(R_{12}), N(R_{13})O(R_{14}), N(R_{13})N(R_{14})(R_{15}), N(R_{13})-X_2-N(R_{14})(R_{15}), N(R_{13})-X_2-CO-X_3, kurioje

R_{11} gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, alkoksi grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų, arba R_{11} kartu su R_{12} sudaro nuo 4- iki 7-narį heterociklą,

R_{12} gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, alkoksi grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų, COR', COOR', CON(R')(R") su R' ir R", kurios gali būti vienodos arba skirtingos, yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, arba R_{12} kartu su R_{11} sudaro nuo 4- iki 7-narį heterociklą,

R_{13} ir R_{15}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, arba alkoksi grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų,

R_{14} gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, COR', COOR', CON(R')(R")

R' ir R", kurie gali būti vienodi arba skirtingi, -yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų.

X_3 gali būti OH, NH_2, NHOH arba $NHNH_2$,

R_1 ir R_2, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, arba alkoksi grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų,

R_3, R_4 ir R_8, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, arba alkoksi grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų, halogeno atomas, -OH, -N (R ') (R „), -N (R') COR", -CN, -COR'R", -SO_2NR'R „, -SO_2R", nitro ir trifluormetilo; R' ir R", kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų,

R_5 gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, alkoksi grupė, turinti nuo 1 iki 3, anglies atomų, halogeno atomas, -OH, -N (R ‘) (R „), -N (R’) COR „, nitro ir trifluormetilo, arba R_5 kartu su vienu iš R_6 ir R_7 sudaro žiedą, turintį 5 arba 6 anglies atomus; R’ ir R“, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų,

R_6 ir R_7, kurie gali būti vienodos arba skirtingi, gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, arba kartu sudaro C=O grupę,

arba vienas iš R_6 ir R_7 kartu su R_5 sudaro žiedą, turintį 5 arba 6 anglies atomus.

2. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad X_1 yra alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų, pasirinktinai pakeistų viena arba daugiau alkilo grupių, turinčių nuo 1 iki 3 anglies atomų, arba viena arba daugiau alkoksi grupių, turinčių 1 arba 2 anglies atomus.

3. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad X_1 yra parinktas iš grupės, susidedančios iš CH_2 grupės, CH_2CH_2 grupės arba $C(CH_3)_2$ grupės, ir R_9 ir R_{10}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilis arba CH_3 grupė.

4. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad A liekana yra pasirinkta iš grupės, susidedančios iš CH_2 grupės, CH_2CH_2 grupės, $C(CH_3)_2$ grupės, $CH_2CH_2OCH_2$ grupės, $CH_2CH_2OC(CH_3)_2$ grupės, ir $CH_2CH_2CH_2OC(CH_3)_2$ grupės.

5. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad R_{11} yra vandenilio atomas, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų, alkoksi grupė, turinti 1 arba 2 anglies atomus, arba R_{11} kartu su R_{12} sudaro 5- arba 6-narį heterociklą.

6. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad R_{12} yra vandenilio atomas, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų, alkoksi grupė, turinti 1 arba 2 anglies atomus, CON(R’) (R“), su R’ ir R“, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų, arba R_{12} kartu su R_{11} sudaro 5- arba 6-narį heterociklą.

7. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad R_{13} ir R_{15}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilio atomas, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų, arba alkoksi grupė, turinti 1 arba 2 anglies atomus.

8. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad R_{14} yra vandenilio atomas, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų, COR’, COOR’,CON (R’)(R“), R’ ir R“, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų.

9. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad X_2 yra alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų, pasirinktinai pakeistų viena arba daugiau alkilo grupių, turinčių nuo 1 iki 3 anglies atomų, arba viena arba daugiau alkoksi grupių, turinčių 1 arba 2 anglies atomus.

10. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad X_3 yra parinktas iš grupės, susidedančios iš OH, NH_2, NH OH ir NH_2.

11. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad R_1 ir R_2, kurios gali būti vienodos arba skirtingos, yra vandenilio atomas, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų, arba alkoksi grupė, turinti 1 arba 2 anglies atomus.

12. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad R_3, R_4 ir R_8, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra parinkti iš grupės, susidedančios iš vandenilio atomo, alkilo grupės, turinčios nuo 1 iki 3 anglies atomų, alkoksi grupės, turinčios 1 arba 2 anglies atomus, Br, Cl, F atomo, OH grupės, nitro grupės, trifluormetilo grupės arba N(R’)(R“) arba -N(R’)COR“, -CN, -CONR’R“, -SO_2NR’R“, -SO_2R’, R’ ir R“, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilio atomas ir alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų.

13. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad R_5 yra parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio atomo, alkilo grupės, turinčios nuo 1 iki 3 anglies atomų, alkoksi grupės, turinčios 1 arba 2 anglies atomus, halogeno atomo, OH grupės, arba R_5, kartu su vienu iš R_6 ir R_7, sudaro žiedą, turintį 5 arba 6 anglies atomus.

14. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad R_6 ir R_7, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra parinkti iš grupės, susidedančios iš vandenilio atomo, alkilo grupės, turinčios nuo 1 iki 3 anglies atomų, arba kartu sudaro C=O grupę, arba vienas iš R_6 ir R_7, kartu su R_5, sudaro žiedą, turintį 5 arba 6 anglies atomus.

15. Farmacinė kompozicija, apimanti junginį, kurio formulė (I) pagal bet kurį vieną iš ankstesnių punktų, arba farmaciniu požiūriu priimtiną jo druską, arba jo esterį, ir bent vieną farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį.

16. Farmacinė kompozicija pagal 15 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad minėta farmaciniu požiūriu priimtina druska yra papildoma druska su fiziologiškai priimtinomis organinėmis arba neorganinėmis rūgštimis arba bazėmis.

17. Farmacinė kompozicija pagal 16 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad minėtos fiziologiškai priimtinos rūgštys yra parinktos iš grupės, susidedančios iš druskos rūgšties, vandenilio bromido rūgšties, sieros rūgšties, fosforo rūgšties, azoto rūgšties, acto rūgšties, askorbo rūgšties, benzoinės rūgšties, citrinų rūgšties, fumaro rūgšties, pieno rūgšties, maleino rūgšties, metansulfonrūgšties, oksalo rūgšties, paratoluensulfoninės rūgšties, benzensulfonrūgšties, gintaro rūgšties, tanino rūgšties ir vyno rūgšties.

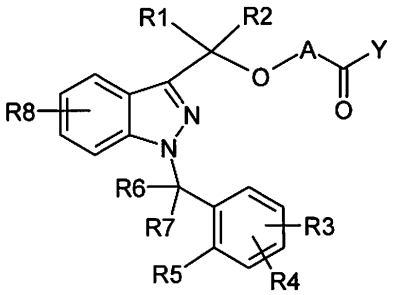
18. Farmacinė kompozicija pagal 16 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad minėtos fiziologiškai priimtinos bazės yra parinktos iš grupės, susidedančios iš amonio hidroksido, kalcio hidroksido, magnio karbonato, natrio hidrokarbonato, kalio hidrokarbonato, arginino, betaino, kofeino, cholino, N,N-dibenziletilendiamino, dietilamino, 2-dietilaminoetanolio, 2-dimetilaminoetanolio, etanolamino, etilendiamino, N-etilmorfolino, N-etilpiperidino, N-metilgliukamino, gliukamino, gliukozamino, histidino, N-(2-hidroksietil)piperidino, N-(2-hidroksietil)pirolidino, izopropilamino, lizino, metilgliukamino, morfolino, piperazino, piperidino, teobromino, trietilamino, trimetilamino, tripropilamino ir trometamino.

19. Farmacinė kompozicija pagal 15 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad minėtas farmaciniu požiūriu priimtinas esteris yra suformuotas su fiziologiškai priimtinomis organinėmis rūgštimis arba alkoholiais.

20. Farmacinė kompozicija pagal bet kurį iš nuo 15 iki 19 punktų b e s i s k i r i a n t i tuo, kad minėta kompozicija turi stereoizomerą arba enantiomerą junginio, kurio formulė (I), arba farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos arba jo esterio, arba jų mišinio.

21. Farmacinė kompozicija pagal bet kurį iš nuo 15 iki 20 punktų b e s i s k i r i a n t i tuo, kad minėtas farmaciniu požiūriu priimtinas nešiklis yra pasirinktas iš grupės, susidedančios iš slydiklių, rišiklių, dezintegruojančių agentų, užpildų, skiediklių, kvapiųjų medžiagų, dažiklių, plastifikatorių, tepalų, konservantų, drėkiklių, absorbentų ir saldiklių.

22. Panaudojimas junginio, kurio formulė (I)



(I)

kurioje:

A gali būti -X_1- arba -X_1-OC(R_9)(R_{10})- kurioje

X_1 gali būti alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, pasirinktinai pakeista viena arba daugiau alkilo grupių, turinčių nuo 1 iki 5 anglies atomų, arba viena arba daugiau alkoksi grupių, turinčių nuo 1 iki 3 anglies atomų ir

R_9 ir R_{10}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, arba alkoksi grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų,

Y gali būti N(R_{11})(R_{12}), N(R_{13})O(R_{14}), N(R_{13})N(R_{14})(R_{15}), N(R_{13})-X_2-N(R_{14})(R_{15}), N(R_{13})-X_2-CO-X_3, kurioje

R_{11} gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, alkoksi grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų arba R_{11} kartu su R_{12} sudaro nuo 4- iki 7-narį heterociklą,

R_{12} gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, alkoksi grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų, COR', COOR', CON(R')(R") R' ir R", kurios gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, arba R_{12} kartu su R_{11} sudaro nuo 4- iki 7-narį heterociklą,

R_{13} ir R_{15}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, arba alkoksi grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų,

R_{14} gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, COR', COOR', CON(R')(R") kur R' ir R", kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų,

X_2 gali būti alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, pasirinktinai pakeista viena arba daugiau alkilo grupių, turinčių nuo 1 iki 5 anglies atomų, arba viena arba daugiau alkoksi grupių, turinčių nuo 1 iki 3 anglies atomų,

X_3 gali būti OH, NH_2, NHOH arba $NHNH_2$,

R_1 ir R_2, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, arba alkoksi grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų,

R_3, R_4 ir R_8, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, alkoksi grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų, halogeno atomas, -OH, -N(R')(R"),-N(R')COR", -CN, -CONR'R", $-SO_2NR'R"$, $-SO_2R'$, nitro, trifluormetilas; R' ir R", kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, R_5 gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, alkoksi grupė, turinti nuo 1 iki 3 anglies atomų, halogeno atomas, -OH, -N(R')(R"),-N(R')COR", nitro, trifluormetilas, arba R_5 kartu su vienu iš R_6 ir R_7 sudaro žiedą, turintį 5 arba 6 anglies atomus; R' ir R", kurie gali būti vienodi arba skirtingi, yra vandenilis ir alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų,

R_6 ir R_7, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, gali būti vandenilis, alkilo grupė, turinti nuo 1 iki 5 anglies atomų, arba kartu sudaro C=O grupę, arba viena iš R_6 ir R_7 kartu su R_5 sudaro žiedą, turintį 5 arba 6 anglies atomus,

paruošimui farmacinės kompozicijos, skirtos ligų, susijusių su MCP-1, CX3CR1 ir p40 ekspresija gydymui, kur minėtos ligos susijusios su MCP-1 ir CX3CR1 ekspresija yra parinktos iš grupės, kurią sudaro sąnarių ligos, inkstų ligos, širdies ir kraujagyslių ligos, metabolinis sindromas, nutukimas, diabetas, atsparumas insulinui ir vėžys, ir minėtos ligos susijusios su p40 ekspresija yra parinktos iš grupės, kurią sudaro autoimuninės ligos, lėtinės degeneracinės uždegiminės ligos, ir vėžys.

23. Panaudojimas pagal 22 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos ligos, susijusios su MCP-1 ekspresija yra parinktos iš grupės, kurią sudaro reumatoidinis artritas, artritas sukeltas virusinių infekcijų, psoriazinis artritas, artrozė, vilkliginis nefritas, diabetinė nefropatija, glomerulonefritas, policistinė inkstų liga, intersticinės plaučių ligos, fibrozė, išsėtinė sklerozė, Alzheimerio liga, su ŽIV susijusios demencijos, atopinis dermatitas, psoriazė, vaskulitas, restenozė, aterosklerozė, miokardo infarktas, krūtinės angina, ūminės vainikinių arterijų ligos, adenoma, karcinomos ir metastazės, ir medžiagų apykaitos ligos.

24. Panaudojimas pagal 22 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos ligos, susijusios su CX3CR1 ekspresija yra parinktos iš grupės, apimančios reumatoidinį artritą, inkstų vilkligę, diabetinę nefropatiją, Krono ligą, opinį kolitą, koronarinius sutrikimus, restenozę, aterosklerozę, miokardo infarktą ir anginą.

25. Panaudojimas pagal 22 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos ligos, susijusios su p40 ekspresija, yra parinktos iš grupės, apimančios reumatoidinį artritą, psoriazę, glomerulonefritą, diabetą, raudonąją vilkligę, Krono ligą, ir navikus.

---

(51) Int.Cl. ***C07D 233/88*** (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 403/14 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)
A61K 31/505 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

(11) **2606034**

(96) 11743438.1

(96) 2011-07-19

(97) 2013-06-26

(97) 2016-03-09

(86) PCT/EP2011/003597

(86) 2011-07-19

(87) WO 2012/022408

(87) 2012-02-23

(30) 102010034699, 2010-08-18, DE

(72) HEINRICH, Timo, DE
ESDAR, Christina, DE

GREINER, Hartmut, DE
(73) Merck Patent GmbH, 64293 Darmstadt, DE
(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
(54) Pirimidino dariniai kaip FAK inhibitoriai
Apibrėžties punktai: 3, brėžiniai: 0.
(57) 1. Junginiai, parinkti iš grupės:

Nr.	Pavadinimas ir/arba struktūra
„A1“	N-(2-{2-[2-(4-metansulfonilfenilamino)pirimidin-4-il]etil}fenil)-N-metilmetansulfonamido
„A2“	N-metil-N-(2-{2-[2-(2-okso-1,2,3,4-tetrahidrochinolin-6-ilamino)pirimidin-4-il]etil}fenil) metansulfonamido
„A3“	6-{4-[2-(3-metansulfonilfenil)etil]pirimidin-2-il-amino}-3,4-dihidro-1H-chinolin-2-ono
„A4“	(4-metansulfonilfenil)-{4-[2-(3-metansulfonilfenil)etil]pirimidin-2-il}amino
„A5“	N-metil-N-(2-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-il-amino)pirimidin-4-il]etil}fenil)metansulfonamido
„A6“	N-metil-N-(3-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-il-amino)pirimidin-4-il]etil}piridin-2-il)metan-sulfonamido
„A7“	N-metil-N-(3-{2-[2-(2-okso-1,2,3,4-tetrahidrochinolin-6-il-amino)pirimidin-4-il]etil}piridin-2-il) metansulfonamido
„A8“	N-(3-{2-[2-(4-metansulfonilfenilamino)pirimidin-4-il]etil}piridin-2-il)-N-metilmetansulfonamido
„A9“	(2-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)pirimidin-4-il]etil}fenil)acetonitrilo
„A10“	N-metil-N-(3-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-il-amino)pirimidin-4-il]etil}piridin-2-il)acetamido
„A11“	(4-fluor-2-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-pirimidin-4-il]etil}fenil)acetonitrilo
„A12“	N-metil-N-(3-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-il-amino)pirimidin-4-il]etil}piridin-2-il)formamido
„A13“	1-(2-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-pirimidin-4-il]etil}fenil)ciklobutankarbonitrilo
„A14“	N-[2-(3-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-pirimidin-4-il]etil}piridin-2-ilamino)etil] formamido
„A15“	(2-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)pirimidin-4-il]etil}-5-trifluormetilfenil)acetonitrilo
„A16“	3-(3-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-pirimidin-4-il]etil}piridin-2-il)azetidin-3-karbonitrilo
„A17“	(2-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)pirimidin-4-il]etil}-4-trifluormetilfenil)acetonitrilo
„A18“	(5-fluor-2-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-pirimidin-4-il]etil}fenil)acetonitrilo
„A19“	1-(2-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-pirimidin-4-il]etil}-4-trifluormetilfenil)-ciklobutankarbonitrilo
„A20“	N-metil-N-(3-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidrobenzoksazol-6-il-amino)pirimidin-4-il]etil}piridin-2-il)-metansulfonamido

Nr.	Pavadinimas ir/arba struktūra
„A21“	N-metil-N-(3-{2-[2-(1-metil-2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)pirimidin-4-il]etil}piridin-2-il)-metansulfonamido
„A22“	N-(3-{2-[2-(3-cianofenilamino)pirimidin-4-il]etil}-piridin-2-il)-N-metilmetansulfonamido
„A23“	N-(3-{2-[2-(3-ciano-4-fluorfenilamino)pirimidin-4-il]-etil}piridin-2-il)-N-metilmetansulfonamido
„A24“	N-metil-N-[3-(2-{2-[(6-okso-1,6-dihidropiridazin-3-il-metil)amino]pirimidin-4-il}etil)piridin-2-il]-metansulfonamido
„A25“	N-(3-{2-[2-(1,3-dimetil-2-okso-2,3-dihidro-1H-benzimidazol-5-ilamino)pirimidin-4-il]etil}piridin-2-il)-N-metilmetansulfonamido
„A26“	N-(3-{[5-ciano-2-(2-okso-2,3-dihidrobenzoksazol-6-il-amino)pirimidin-4-ilamino]metil}piridin-2-il)-N-metilmetansulfonamido
„A27“	N-metil-N-(2-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidrobenzoksazol-6-il-amino)pirimidin-4-il]etil}fenil) metansulfonamido
„A28“	N-(2-{2-[2-(3-cianofenilamino)pirimidin-4-il]etil}-fenil)-N-metilmetansulfonamido
„A29“	N-(2-{2-[2-(3-ciano-4-fluorfenilamino)pirimidin-4-il]-etil}fenil)-N-metilmetansulfonamido
„A30“	N-metil-N-(2-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidrobenzotiazol-5-il-amino)pirimidin-4-il]etil}fenil) metansulfonamido
„A31“	N-(2-{2-[2-(1-acetil-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-pirimidin-4-il]etil}fenil)-N-metilmetansulfonamido
„A32“	2-[3-(4-{2-[2-(metansulfonilmetilamino)fenil]etil}-pirimidin-2-ilamino)fenil]-N-metilacetamido
„A33“	N-metil-N-[2-(2-{2-[4-(3-oksomorfolin-4-il)fenil-amino]pirimidin-4-il}etil)fenil]metansulfonamido
„A34“	N-[4-(4-{2-[2-(metansulfonilmetilamino)fenil]etil}-pirimidin-2-ilamino)fenil]nikotinamido
„A35“	N-metil-N-[2-(2-{2-[4-(2-oksopirolidin-1-il)fenilamino]-pirimidin-4-il}etil)fenil]metansulfonamido
„A36“	N-[2-(2-{2-[3,5-dichlor-4-(2-oksopirolidin-1-il)fenil-amino]pirimidin-4-il}etil)fenil]-N-metilmetansulfonamido
„A37“	N-[2-(2-{2-[3-ciano-4-(2-oksopiperidin-1-il)fenilamino]-pirimidin-4-il}etil)fenil]-N-metilmetansulfonamido
„A38“	N-[2-(2-{2-[4-(1,3-diokso-1,3-dihidroizoindol-2-il)fenil-amino]pirimidin-4-il}etil)fenil]-N-metilmetansulfonamido
„A39“	N-metil-N-[3-(2-{2-[4-(2-oksopirolidin-1-il)fenilamino]-pirimidin-4-il}etil)piridin-2-il] metansulfonamido
„A40“	N-[4-(4-{2-[2-(metansulfonilmetilamino)piridin-3-il]-etil}pirimidin-2-ilamino)fenil]nikotinamido
„A41“	N-metil-N-[3-(2-{2-[4-(3-oksomorfolin-4-il)fenil-amino]pirimidin-4-il}etil)piridin-2-il] metansulfonamido
„A42“	N-[3-(2-{2-[3-ciano-4-(2-oksopiperidin-1-il)fenilamino]-pirimidin-4-il}etil)piridin-2-il]-N-metilmetansulfonamido

Nr.	Pavadinimas ir/arba struktūra
„A43“	N-[3-(2-{2-[4-(1,3-diokso-1,3-dihidroizoindol-2-il)fenil-amino]pirimidin-4-il}etil)piridin-2-il]-N-metilmetansulfonamido
„A44“	N-metil-N-(5-metil-3-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)pirimidin-4-il]etil}piridin-2-il)-metansulfonamido
„A45“	1-(4-fluor-2-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-il-amino)pirimidin-4-il]etil}fenil) ciklobutankarbonitrilo
„A46“	1-(5-fluor-2-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-il-amino)pirimidin-4-il]etil}fenil) ciklobutankarbonitrilo
„A47“	1-(2-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-ilamino)-pirimidin-4-il]etil}-5-trifluormetilfenil)-ciklobutankarbonitrilo
„A48“	(5-fluor-4-fenetilpirimidin-2-il)fenilamino
„A49“	(5-metil-4-fenetilpirimidin-2-il)fenilamino
„A50“	(4-fenetil-5-trifluormetilpirimidin-2-il)fenilamino
„A52“	(5-brom-4-fenetilpirimidin-2-il)fenilamino
„A56“	6-{5-fluor-4-[2-(4-fluorfenil)etil]pirimidin-2-il-amino}-3,4-dihidro-1H-chinolin-2-ono
„A65“	6-{4-[2-(4-fluorfenil)etil]-5-metilpirimidin-2-il-amino}-3,4-dihidro-1H-chinolin-2-ono
„A71“	[5-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-4-fenetilpirimidin-2-il]-fenilamino
„A74“	5-{4-[2-(4-fluorfenil)etil]-5-trifluormetilpirimidin-2-ilamino}-1,3-dihidroindol-2-ono
„A77“	6-{4-[2-(4-fluorfenil)etil]-5-trifluormetilpirimidin-2-ilamino}-3,4-dihidro-1H-chinolin-2-ono
„A101“	6-(5-brom-4-fenetilpirimidin-2-ilamino)-3,4-dihidro-1H-chinolin-2-ono
„A102“	5-(4-fenetil-5-trifluormetilpirimidin-2-ilamino)-1,3-dihidroindol-2-ono
„A103“	6-(4-fenetil-5-trifluormetilpirimidin-2-ilamino)-3,4-dihidro-1H-chinolin-2-ono
„A104“	6-(5-metil-4-{2-[3-(propan-1-sulfonil)fenil]etil}pirimidin-2-ilamino)-3,4-dihidro-1H-chinolin-2-ono
„A105“	6-(5-fluor-4-{2-[3-(propan-1-sulfonil)fenil]etil}pirimidin-2-ilamino)-3,4-dihidro-1H-chinolin-2-ono
„A106“	[6-(4-tret-butilfenoksi)piridin-3-il]-(5-fluor-4-fenetilpirimidin-2-il)amino
„A107“	(5-fluor-4-fenetilpirimidin-2-il)-(6-trifluormetilpiridin-3-il)amino
„A108“	(5-fluor-4-fenetilpirimidin-2-il)-(6-fluorpiridin-3-il)amino
„A109“	5-(5-fluor-4-fenetilpirimidin-2-ilamino)piridin-2-karbonitrilo
„A110“	N-[5-(5-fluor-4-fenetilpirimidin-2-ilamino)piridin-2-il]-acetamido
„A111“	N-metil-N-(2-{2-[2-(2-okso-2,3-dihidro-1H-indol-5-il-amino)-5-trifluormetilpirimidin-4-il]etil}fenil)-metansulfonamido

ir jų farmaciniu požiūriu naudojamų druskų, tautomerų ir stereoizomerų, įskaitant jų mišinius visais santykiais.

2. Vaistai, apimantys mažiausiai vieną junginį pagal 1 punktą ir/arba jų farmaciniu požiūriu naudojamas druskas, tautomerus ir stereoizomerus, įskaitant jų mišinius visais santykiais, ir pasirinktinai užpildus ir/arba adjuvantus.

3. Junginiai pagal 1 punktą ir jų farmaciniu požiūriu naudojamos druskos, tautomerai ir stereoizomerai, įskaitant jų mišinius visais santykiais, skirti panaudoti navikų, vėžio, navikų susidarymo, augimo ir plėtimosi, arteriosklerozės, akių ligų, tokių kaip amžiaus sąlygota makulos degeneracija, choroidalinė neovaskuliarizacija ir diabetinė retinopatija, uždegiminių ligų, artrito, trombozės, fibrozės, glomerulonefrito, neurodegeneracijos, psoriazės, restenozės, žaizdų gijimo, transplantanto atmetimo, metabolinių ligų ir imuninės sistemos ligų, autoimuninių ligų, cirozės, diabetų ir kraujagyslių ligų gydymui.

---

(51) Int.Cl. ***C07D 253/08*** (2006.01)
C07D 401/06 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 409/14 (2006.01)
C07D 417/14 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
C07F 7/18 (2006.01)
A61K 31/53 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

(11) **2780332**

(96) 12783121.2

(96) 2012-10-30

(97) 2014-09-24

(97) 2016-02-24

(86) PCT/EP2012/004542

(86) 2012-10-30

(87) WO 2013/072015

(87) 2013-05-23

(30) 102011118830, 2011-11-18, DE

(72) MEDERSKI, Werner, DE
FUCHSS, Thomas, DE
EMDE, Ulrich, DE
BUCHSTALLER, Hans-Peter, DE

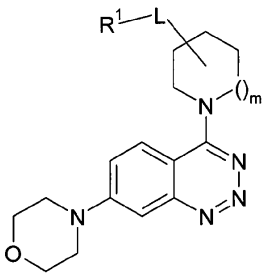
(73) Merck Patent GmbH, 64293 Darmstadt, DE

(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT

(54) Morfolinilbenzotriazinai, skirti panaudoti vėžio terapijai

Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 0.

(57) 1. Junginiai, kurių formulė (I):



(I)

kurioje:

R^1 reiškia Het^1 arba Ar;

R^2, R^3, nepriklausomai viena nuo kitos, reiškia Y arba OY arba kartu taip pat reiškia -O-$(CH_2)_n$-;

R^4 reiškia A arba $(CH_2)_nOA$;

L reiškia -CR^2R^3-, viengubą jungtį, -$(CH_2)_n$-, -CH(Hal)-, -$C(Hal)_2$-, -$(CH_2)_nCH(OY)$-, -$(CH_2)_nCO$-, -$(CH_2)_nNH$-, -$(CH_2)_nCONY_2$-, -NYCO-, -NHCO-NH-, -NR^4CO-, -$NYSO_2$-, -$C(=NR^4)$-, -C(=NCN)-, -$CY(NY_2)$-, -CY(CN)-, -CY(O-$(CH_2)_n$CN)-, -CY(Het^2)- arba -CY(O-$(CH_2)_nHet^2$)-;

Y reiškia H arba A;

A reiškia nešakotą arba šakotą alkilą, turintį 1-10 C atomus, kuriame, nepriklausomai vienas nuo kito, 1-7 H atomai gali būti pakeisti Hal;

Cik reiškia ciklinį alkilą, turintį 3-7 C atomus, kuriame, nepriklausomai vienas nuo kito, 1-4 H atomai gali būti pakeisti Hal;

Ar reiškia fenilą, kuris yra nepakeistas arba mono- arba dipakeistas Hal, $(CH_2)_pOY$, R^4, $(CH_2)_pOR^4$, COOY, NY_2, NYCOY ir/arba CN;

Het^1 reiškia mono- arba biciklinį heteroarilą, turintį 2-9 C atomus and 1-4 N, O ir/arba S atomus, kuris gali būti nepakeistas arba mono- arba dipakeistas Hal, $(CH_2)_pOY$, R^4, $(CH_2)_pOR^4$, =O, COOY, NY_2, NYCOY, $CONY_2$, Cik, Het^2 ir/arba CN;

Het^2 reiškia monociklinį sotų heterociklą, turintį 2-7 C atomus ir 1-4 N, O ir/arba S atomus, kuris gali būti nepakeistas arba monopakeistas A;

Hal reiškia F, Cl, Br arba I;

m reiškia 0, 1 arba 2; ir

n, p, nepriklausomai viena nuo kitos, reiškia 0, 1, 2, 3, 4 arba 5,

ir/arba jų fiziologiniu požiūriu priimtinos druskos, tautomerai ir/arba stereoizomerai, įskaitant jų mišinius visais santykiais.

2. Junginiai pagal 1 punktą, kuriuose:

R^1 reiškia Het^1.

3. Junginiai pagal 1 arba 2 punktą, kuriuose:

R^2, R^3, nepriklausomai viena nuo kitos, reiškia Y arba OY.

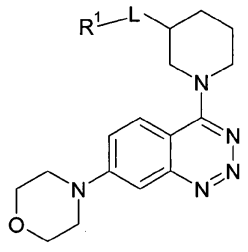
4. Junginiai pagal vieną iš 1 – 3 punktų, kuriuose:

L reiškia -CR^2R^3-.

5. Junginiai pagal vieną iš 1 – 4 punktų, kuriuose:

Het^1 reiškia mono- arba biciklinį heteroarilą, turintį 2-8 C atomus ir 1-3 N, O ir/arba S atomus, kuris gali būti nepakeistas arba mono- arba dipakeistas Hal, $(CH_2)_pOI$, A ir/arba =O.

6. Junginiai pagal 1 punktą, turintys sub-formulę (IA):



(IA)

kurioje:

R^1 reiškia Het^1 arba Ar;

R^2 reiškia Y arba OY;

R^3 reiškia OY arba A;

R^2, R^3 kartu taip pat reiškia -O-$(CH_2)_n$-;

L reiškia -CR^2R^3-;

Y reiškia H arba A;

A reiškia nešakotą arba šakotą alkilą, turintį 1-6 C atomus, kuriame, nepriklausomai vienas nuo kito, 1-5 H atomai gali būti pakeisti Hal;

Ar reiškia fenilą, kuris yra nepakeistas arba mono- arba dipakeistas Hal ir/arba $(CH_2)_pOY$;

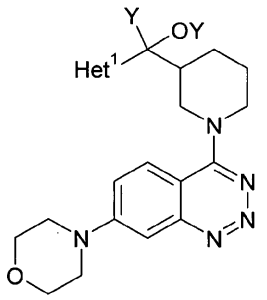
Het^1 reiškia mono- arba biciklinį heteroarilą, turintį 2-8 C atomus ir 1-3 N, O ir/arba S atomus, kuris gali būti nepakeistas arba mono- arba dipakeistas Hal, $(CH_2)_pOY$, A ir/arba =O;

Hal reiškia F, Cl, Br arba I; ir

n, p, nepriklausomai viena nuo kitos, reiškia 0, 1, 2, 3 arba 4,

ir/arba jų fiziologiniu požiūriu priimtinos druskos, tautomerai ir/arba stereoizomerai, įskaitant jų mišinius visais santykiais.

7. Junginiai pagal 1 punktą, turintys sub-formulę (IB):



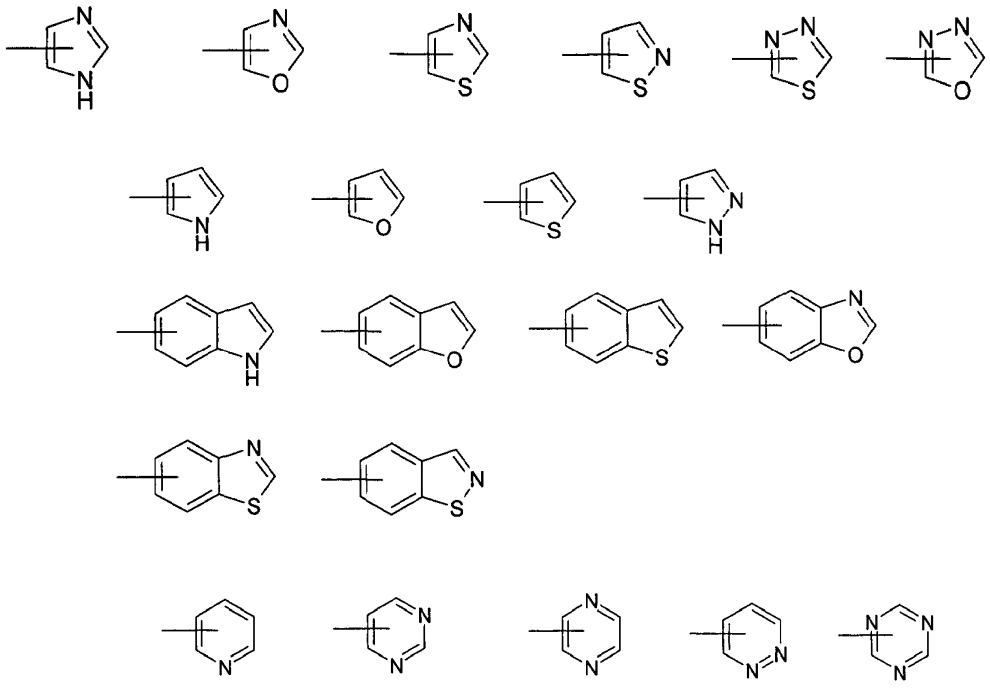
(IB)

kurioje:

Y reiškia H arba A;

A reiškia nešakotą arba šakotą alkilą, turintį 1-6 C atomus, kuriame, nepriklausomai vienas nuo kito, 1-3 H atomai gali būti pakeisti Hal;

Het^1 reiškia heteroarilą, kuris yra nepakeistas arba mono- arba dipakeistas Hal, $(CH_2)_pOY$, A ir/arba =O, parinktą iš grupės:

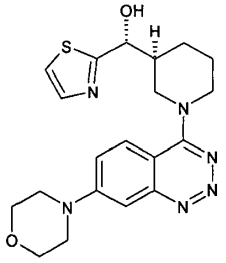
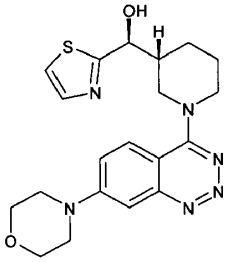
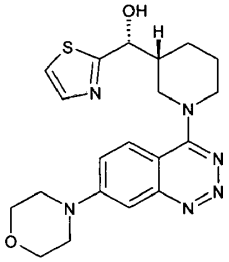
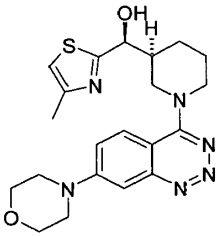
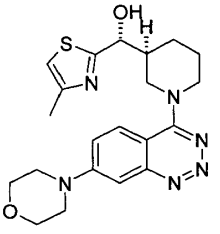
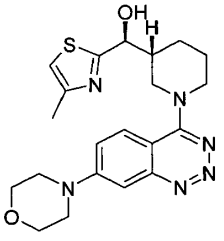


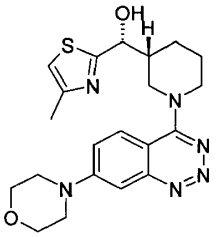
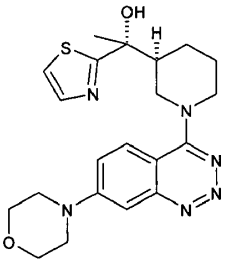
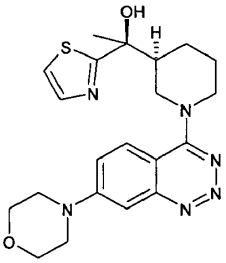
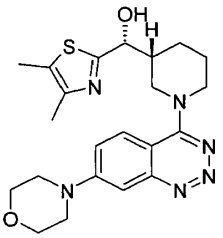
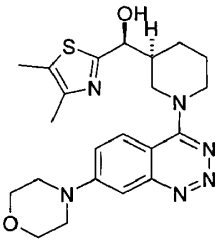
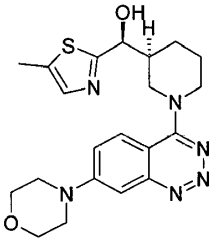
Hal reiškia F, Cl, Br arba I; ir

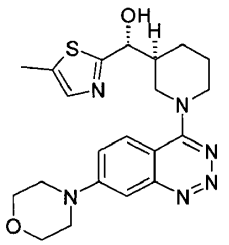
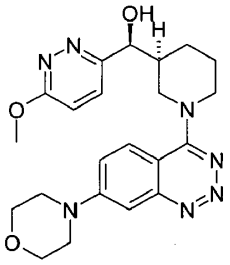
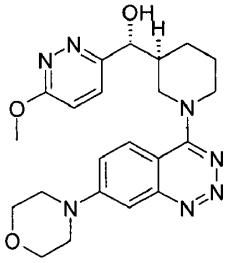
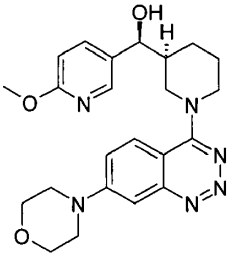
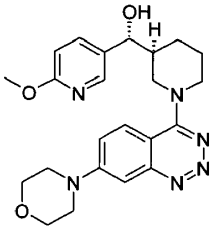
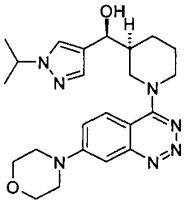
p reiškia 0, 1 arba 2,

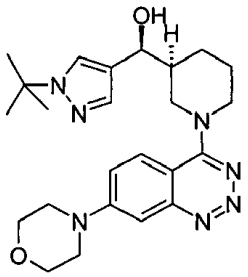
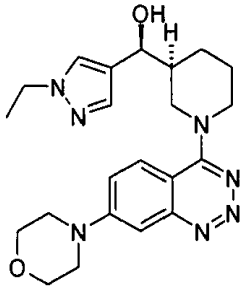
ir/arba jų fiziologiniu požiūriu priimtinos druskos, tautomerai ir/arba stereoizomerai, įskaitant jų mišinius visais santykiais.

8. Junginiai pagal vieną iš 1 – 7 punktų, parinkti iš grupės:

1	
2	
3	
4	
5	
6	

7	
8	
9	
10	
11	
12	

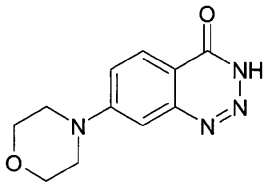
13	
14	
15	
16	
17	
18	

19	
20	

ir/arba jų fiziologiniu požiūriu priimtinos druskos, tautomerai ir/arba stereoizomerai, įskaitant jų mišinius visais santykiais.

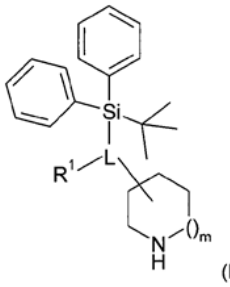
9. (I) formulės junginių pagal 1 punktą ir/arba jų fiziologiniu požiūriu priimtinų druskų, tautomerų ir/arba stereoizomerų gavimo būdas, turintis šias pakopas:

(a) junginio, kurio formulė (II):

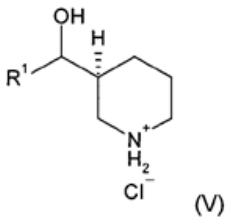


(II)

reakciją su junginiu, kurio formulė (III) arba (V):



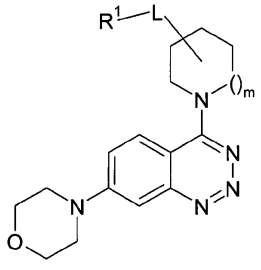
(III) arba



(V)

kurioje R^1, L ir m reikšmės yra tokios, kaip nurodyta 1 punkte,

siekiant gauti junginius, kurių formulė (I):



(I)

kurioje R^1, L ir m reikšmės yra tokios, kaip nurodyta 1 punkte,
ir pasirinktinai
(b) (I) formulės junginių bazės arba rūgšties konversiją jų druska.

10. Junginių pagal vieną iš 1 – 8 punktų ir/arba jų fiziologiniu požiūriu priimtinų druskų, tautomerų ir/arba stereoizomerų, įskaitant jų mišinius visais santykiais, panaudojimas serino/treonino baltymo kinazės, geriau PIKK, konkrečiai geriau DNR-PK slopinimui *in vitro*.

11. Junginiai pagal vieną iš 1 – 8 punktų ir/arba jų fiziologiniu požiūriu priimtinos druskos, tautomerai ir/arba stereoizomerai, įskaitant jų mišinius visais santykiais, skirti panaudoti vėžinių ląstelių dirginimui priešvėžiniu agentu ir/arba jonizuojančiu švitinimu.

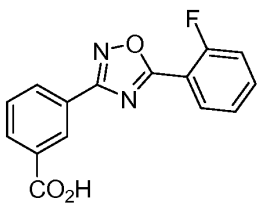
12. Vaistai, apimantys mažiausiai vieną junginį pagal vieną iš 1 – 8 punktų ir/arba jų fiziologiniu požiūriu priimtinas druskas, tautomerus ir/arba stereoizomerus, įskaitant jų mišinius visais santykiais.

13. Farmacinė kompozicija, kaip aktyvų junginį apimanti, mažiausiai vieno junginio pagal vieną iš 1 – 8 punktų ir/arba jų fiziologiniu požiūriu priimtinų druskų, tautomerų ir/arba stereoizomerų, įskaitant jų mišinius visais santykiais, veiksmingą kiekį kartu su farmaciniu požiūriu toleruojamomis pagalbinėmis medžiagomis, derinyje su mažiausiai vienu priešvėžiniu agentu.

14. Junginiai pagal vieną iš 1 – 8 punktų ir/arba jų fiziologiniu požiūriu priimtinos druskos, tautomerai ir/arba stereoizomerai, įskaitant jų mišinius visais santykiais, skirti panaudoti vėžio, navikų, metastazių ir/arba angiogenezės sutrikimų profilaktikai, terapijai ir/arba progresinei kontrolei derinyje su radioterapija ir/arba su mažiausiai vienu priešvėžiniu agentu.

---

(51) Int.Cl. ***C07D 271/06*** (2006.01)
A61K 31/4245 (2006.01)
(11) **2076501**
(96) 07838770.1
(96) 2007-09-24
(97) 2009-07-08
(97) 2015-12-02
(86) PCT/US2007/020633
(86) 2007-09-24
(87) WO 2008/039431
(87) 2008-04-03
(30) 847326 P, 2006-09-25, US
(72) ALMSTEAD, Neil G., US
HWANG, Peter Seongwoo, US
MOON, Young-Choon, US
(73) PTC Therapeutics, Inc., South Plainfield, NJ 07080, US
(74) Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) 3-[5-(2-fluorfenil)-[1,2,4]oksadiazol-3-il]benzenkarboksirūgšties kristalinės formos
Apibrėžties punktai: 17, brėžiniai: 11.
(57) 1. Junginio, turinčio formulę (I):



(I)

kristalinė forma, kuri pasižymi miltelių Rentgeno spinduliuotės difrakcijos spektru, apimančiu bent tris smailės padėtis (°2θ±0,2), matuojant su Cu Ka spinduliuote, parinktas iš grupės, susidedančios iš 4,96, 6,39, 10,10, 11,54, 12,62, 12,81, 13,92, 14,16, 14,55, 14,88, 15,07, 15,58, 16,27, 16,61, 18,74, 18,94, 19,28, 19,94, 20,27, 20,74, 20,97, 21,22, 21,93, 22,58, 22,80, 23,00, 23,79, 24,14, 24,46, 25,44, 25,64, 26,07, 26,34, 26,74, 27,06, 27,79, 28,42, 29,09, 30,48.

2. Kristalinė forma pagal 1 punktą, kuri turi šiuos elementarios gardelės parametrus, matuojant 150 K temperatūroje: a = 24,2240 Å; b = 3,74640 Å; c = 27,4678 Å; a = 90°; β = 92,9938°; γ = 90°; *V* = 2489.38(17) Å^3; Z = 8; apskaičiuotas tankis (d_{calc}, g cm^{-3}) yra 1,517 g cm^{-3}; ir erdvinė grupė yra $P2_1/n$ (nr. 14).

3. Kristalinė forma pagal 1 arba 2 punktą, kuri turi šias dalines atomo koordinates, lygias šioms koordinatėms:

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

H(123)	0,371	1,050	-0,241	0,048
H(124)	0,278	1,217	-0,238	0,050
H(125)	0,232	1,123	-0,166	0,049
H(126)	0,278	0,862	-0,099	0,042
H(151)	0,227	0,491	0,125	0,057
H(152)	0,318	0,473	0,041	0,031
H(154)	0,389	0,025	0,163	0,033
H(155)	0,471	-0,066	0,123	0,035
H(156)	0,475	0,103	0,041	0,035
H(223)	-0,220	0,975	-0,020	0,077
H(224)	-0,151	1.094	-0,074	0,082
H(225)	-0,061	0,969	-0,055	0,080
H(226)	-0,030	0,729	0,021	0,065
H(252)	0,226	0,213	0,202	0,059
H(254)	0,123	0,034	0,272	0,035
H(255)	0,033	-0,068	0,296	0,036
H(256)	-0,043	0,074	0,244	0,039
H(25A)	0,060	0,443	0,144	0,035

4. Kristalinė forma pagal 1 punktą, kuri pasižymi miltelių Rentgeno spinduliuotės difrakcijos spektru, apimančiu bent vieną smailės padėtį (°2$\theta\pm$0,2), matuojant su Cu Ka spinduliuote, parinktą iš grupės, susidedančios iš 10,10, 11,54, 14,55, 14,88 ir 15,07.

5. Kristalinė forma pagal 1 punktą, kuri yra charakterizuojama ^{13}C CP/MAS kieto būvio BMR signalais ties viena arba daugiau iš šių padėčių: 172,6, 167,0, 131,3, 128,4 ir 117,1 ppm, su išoriniu glicino standartu ties 176,5 ppm.

6. Kristalinė forma pagal bet kurį iš 1-5 punktą, kuri turi diferencinės skenavimo kalorimetrijos termogramą, kurioje atsispindi endoterminis įvykis su temperatūros smaile ties 244 °C.

7. Kristalinė forma pagal bet kurį iš 1-5 punktą, kuri turi termogravimetrinės analizės termogramą, kuri turi masės praradimą, mažesnį nei 1 % nuo visos mėginio masės, kaitinant nuo 33 °C iki 205 °C.

8. Kristalinė forma pagal bet kurį iš 1-5 punktą, kuri yra nehigroskopiška.

9. Kristalinė forma pagal bet kurį iš 1-5 punktą, kuri yra didesnio nei 90 % grynumo.

10. Kristalinės formos pagal bet kurį iš 1-9 punktą gavimo būdas, apimantis kristalinės formos pagal bet kurį iš 1-9 punktą kristalinimą iš tirpiklio.

11. Būdas pagal 10 punktą, kur minėtas kristalinės formos kristalinimas iš tirpiklio apima:

(a) kristalinės formos pagal bet kurį iš 1-9 punktą kristalinimą iš metanolio, tretinio butilo alkoholio (t-BuOH), 1-butilo alkoholio (1-BuOH), acetonitrilo, izopropilo alkoholio (IPA), izopropilo eterio, dimetilformamido, heptano, izopropilo acetato (IPOAc), tolueno ir (arba) vandens; arba

(b) kristalinės formos pagal bet kurį iš 1-9 punktą kristalinimą, lėtai garinant, iš acetonitrilo; t-butanolio; izopropilo alkoholio; arba izopropilo eterio; arba

(c) kristalinės formos pagal bet kurį iš 1-9 punktą kristalinimą, greitai garinant, iš 1-butanolio; dimetoksieterio; t-butanolio; dimetilformamido ir vandens mišinio; izopropilo eterio; arba iš t-butanolio:vandens mišinio santykiu 3:2, 1 molinio ekvivalento metanolio ir 1 molinio ekvivalento natrio chlorido.

12. Farmacinė kompozicija, apimanti kristalinę formą pagal bet kurį iš 1-9 punktą ir, pasirinktinai, vieną arba daugiau nešiklių, užpildų arba skiediklių.

13. Farmacinė kompozicija pagal 12 punktą, skirta peroraliniam įvedimui, įvedimui per gleivinę, parenteraliniam, transderminiam arba vietiniam įvedimui.

14. Farmacinė kompozicija pagal 12 arba 13 punktą, kur farmacinė kompozicija yra vienetinės peroralinės vaisto formos pavidale.

15. Kristalinė forma pagal bet kurį iš 1-9 punktą, skirta naudoti pirmalaikio transliacijos nutraukimo slopinimo ir (arba) beprasmio mDNR medijuojamo skilimo ląstelėje moduliavimo būde, kontaktuojant ląstelei su kristaline forma.

16. Kristalinė forma pagal bet kurį iš 1-9 punktą, skirta naudoti ligos arba sutrikimo, susijusio su pirmalaikiu stop-kodonu, gydymo arba prevencijos būde.

17. Kristalinė forma, skirta naudoti pagal 16 punktą, kur liga arba sutrikimas, susijęs su pirmalaikiu stop-kodonu, yra daugybinė endokrininė neoplazija (1, 2 ir 3 tipo), amiloidozė, mukopolisaccharidozė (I ir III tipo), įgimta antinksčių hipoplazija, storosios žarnos adenomatozinė polipozė, Von Hippel Landau liga, Menkes‘ sindromas, hemofilija A, hemofilija B, kolagenas VII, Alagille‘ sindromas, Townes-Brocks‘ sindromas, strypo formos navikas, buliozinė apidermolizė, Hurler’ sindromas, Coffin-Lowry‘ sindromas, aniridija, Charcot-Maria-Tooth‘ liga, miotubuliarinė miopatija, su X-surišta miotubuliarinė miopatija, su X-surišta chondrodisplazija, su X-surišta a-gamaglobulinemija, policistinė inkstų liga, nugaros raumenų atrofija, paveldima adenomatozinė polipozė, piruvatdehidrogenazės trūkumas, fenilketonurija, neurofibromatozė 1, neurofibromatozė 2, Alzheimerio liga, Tay Sachs‘ liga, Rett‘ sindromas, Hermansky-Pudlak sindromas, ektodermalinė displazija/odos trapumo sindromas, Leri-Weill‘ dischondrosteozė, rachitas, hipofosfatemija, adrenoleukodistrofija, spiralinė atrofija, aterosklerozė, neurosensorinis kurtumas, distonija, Dent‘ liga, ūmi protarpinė porfirija, Cowden‘ liga, Herlitz‘ buliozinė epidermolizė, Wilson‘ liga, Treacher-Collins‘ sindromas, piruvatkinazės trūkumas, gigantizmas, liliputiškumas, hipotiroidizmas, hipertiroidizmas, senėjimas, nutukimas, Parkinsono liga, Niemann Pick’ liga C, cistinė fibrozė, raumenų distrofija, širdies liga, inkstų akmenligė, ataksija-telangiektazija, paveldima hipercholesterolemija, *retinitis pigmentosa*, lizosominė kaupimo liga, gumbo sklerozė, Duchenne‘ raumenų distrofija arba Marfan‘ sindromas;

arba kur liga arba sutrikimas, susijęs su pirmalaikiu stop-kodonu, yra širdies ir kraujagyslių liga, plaučių liga, autoimuninė liga, kraujo liga, kolageno liga, diabetas, uždegiminė liga, centrinės nervų sistemos liga arba vėžys;

arba kur liga arba sutrikimas, susijęs su pirmalaikiu stop-kodonu, yra galvos ir kaklo, akių, odos, burnos, gerklės, stemplės, krūtinės, kaulų, plaučių, gaubtinės žarnos, sigmoidinio storosios žarnos segmento, tiesiosios žarnos, skrandžio, prostatos, krūties, kiaušidžių, inkstų, kepenų, kasos, smegenų, žarnyno, širdies arba antinksčių vėžys;

arba kur liga arba sutrikimas, susijęs su pirmalaikiu stop-kodonu, yra solidinis navikas, sarkoma, karcinoma, fibrosarkoma, miksosarkoma, liposarkoma, chondrosarkoma, osteogeninė sarkoma, chordoma, angiosarkoma, endoteliosarkoma, limfangiosarkoma, limfangioendoteliosarkoma, sinovioma, mezotelioma, Ewing’ navikas, leiomiosarkoma, rabdomiosarkoma, žvynuotųjų ląstelių karcinoma, bazalinių ląstelių karcinoma, adenokarcinoma, prakaito liaukų karcinoma, riebalinių liaukų karcinoma, spenelių karcinoma, spenelių adenokarcinomos, cistadenokarcinoma, medulinė karcinoma, bronchogeninė karcinoma, inkstų ląstelių karcinoma, hepatoma, tulžies pūslės karcinoma, choriokarcinoma, seminoma, embrioninė carcinoma, Wilms’navikas, gimdos kaklelio vėžys, sėklidžių navikas, plaučių karcinoma, smulkiųjų ląstelių plaučių karcinoma, šlapimo pūslės karcinoma, epitelio karcinoma, glioma, astrocitoma, medulioblastoma, kraniofaringioma, ependimoma, Kaposi’ sarkoma, pinealoma, hemangioblastoma, akustinė neuroma, oligodendroglioma, menangioma, melanoma, neuroblastoma, retinoblastoma, kraujo kilmės navikas, ūmi limfoblastinė leukemija, ūmi limfoblastinė B-ląstelių leukemija, ūmi limfoblastinė T-ląstelių leukemija, ūmi mieloblastinė leukemija, ūmi promielocitinė leukemija, ūmi monoblastinė leukemija, ūmi eritroleukeminė leukemija, ūmi megakarioblastinė leukemija, ūmi mielomonocitinė leukemija, ūmi ne-limfocitinė leukemija, ūmi nediferencijuota leukemija, lėtinė mielocitinė leukemija, lėtinė limfocitinė leukemija, plaukuotųjų ląstelių leukemija arba daugybinė mieloma;

arba kur liga arba sutrikimas, susijęs su pirmalaikiu stop-kodonu, yra vėžys, susijęs su pirmalaikiu stop-kodonu, esančiu naviko supresoriaus gene, kur naviko supresoriaus genas pasirinktinai yra APC, ATM, BRCA1, BRCA2, MSH1, pTEN, Rb arba p53;

arba kur liga arba sutrikimas, susijęs su pirmalaikiu stop-kodonu, yra vėžys, susijęs su pirmalaikiu stop-kodonu, esančiu p53 gene;

arba kur liga arba sutrikimas, susijęs su pirmalaikiu stop-kodonu, yra autoimuninė liga, kuri yra reumatoidinis artritas arba transplantantas- prieš-šeimininką liga;

arba kur liga arba sutrikimas, susijęs su pirmalaikiu stop-kodonu, yra kraujo liga, kuri yra hemofilija A, Von Willebrand‘ liga (3 tipo), ataksija-telangiektazija, b-talasemija arba inkstų akmenligė;

arba kur liga arba sutrikimas, susijęs su pirmalaikiu stop-kodonu, yra kolageno liga, kuri yra *osteogenesis imperfecta* arba cirozė; arba

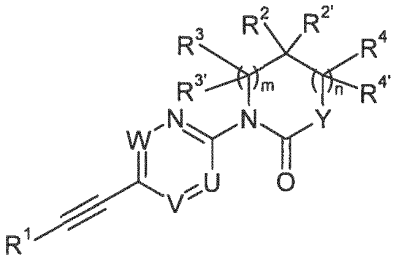
arba kur liga arba sutrikimas, susijęs su pirmalaikiu stop-kodonu, yra uždegiminė liga, kuri yra artritas; arba

arba kur liga arba sutrikimas, susijęs su pirmalaikiu stop-kodonu, yra centrinės nervų sistemos liga, kuri yra išsėtinė sklerozė, pavėluota kūdikių neuronų ceroidinė lipofuscinozė, Alzheimerio liga, Tay Sachs‘ liga, neurodegeneracinė liga arba Parkinsono liga; arba

arba kur liga arba sutrikimas, susijęs su pirmalaikiu stop-kodonu, yra Duchenne‘ raumenų distrofija; arba

arba kur liga arba sutrikimas, susijęs su pirmalaikiu stop-kodonu, yra cistinė fibrozė.

(51) Int.Cl. ***C07D 401/04*** (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 403/04 (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)
C07D 498/04 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)
A61P 25/18 (2006.01)
(11) **2558457**
(96) 11713288.6
(96) 2011-04-11
(97) 2013-02-20
(97) 2016-03-09
(86) PCT/EP2011/055585
(86) 2011-04-11
(87) WO 2011/128279
(87) 2011-10-20
(30) 10159754, 2010-04-13, EP
(72) GREEN, Luke, CH
GUBA, Wolfgang, DE
JAESCHKE, Georg, CH
JOLIDON, Synese, CH
LINDEMANN, Lothar, CH
RICCI, Antonio, CH
RUEHER, Daniel, FR
STADLER, Heinz, CH
VIEIRA, Eric, CH
(73) F.Hoffmann-La Roche AG, 4070 Basel, CH
(74) Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Ariletinilo dariniai
Apibrėžties punktai: 27, brėžiniai: 0.
(57) 1. Etinilo dariniai, kurių formulė I



kur
U yra =N- arba =C(R^5)-;
V yra -CH= arba N=;
W yra =CH- arba =N-;
su sąlyga, kad tik vienas iš U, V Arba W gali būti azotas;
R^5 yra vandenilis, metilas arba halogenas;
Y yra -N(R^6-O-, -C($R^{7'}$)(R^7)-, -CH_2O- arba -$CH_2S(O)_2$-; kur R^6 yra vandenilis arba C_{1-4}-alkilas ir R^7/$R^{7'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, hidroksi, C1-4-alkilas arba C1-4-alkoksi;
R^1 yra fenilas arba heteroarilas, kuris yra pasirinktinai pakeistas vienu arba dviem pakaitais, parinktais iš halogeno, C_{1-4}-alkilo arba C_{1-4}-alkoksi;
R^2/$R^{2'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-alkilas, hidroksi, C_{1-4}-alkoksi, C_3-C_6-cikloalkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą arba žiedą, turintį -CH_2OCH_2-;
m yra 0, 1 arba 2;

tuo atveju, kada m yra 1,

$R^3/R^{3'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-alkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą;

or R^3 ir R^2 gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą arba žiedą, turintį $-(CH_2)_2OCH_2-$;

n yra 0 arba 1;

tuo atveju, kada n yra 1,

$R^4/R^{4'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-alkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą;

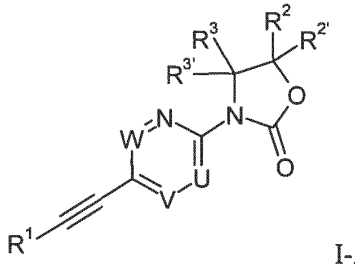
R^4 ir R^2 gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą;

arba jeigu n yra 0 ir Y yra $-N(R^6)-$, tada R^6 ir R^2 gali sudaryti kartu su anglies atomu ir azoto atomu prie kurių jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą;

arba jeigu n ir m yra 0, tada R^2 ir R^7 gali sudaryti kartu su anglies atomais, prie kurių jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą;

arba jo farmaciniu požiūriu priimtina rūgšties prisijungimo druska, raceminis mišinys arba jo atitinkamas enantiomeras ir / arba optinis izomeras, ir / arba stereoizomeras.

2. Etinilo dariniai, kurių formulė I-A1, apimti formule I pagal 1 punktą,



I-A1

kur

U yra =N- arba $=C(R^5)-$;

V yra -CH= arba N=;

W yra =CH- arba =N-;

su sąlyga, kad tik vienas iš U, V arba W gali būti azotas.

R^5 yra vandenilis, metilas arba halogenas;

R^1 yra fenilas arba heteroarilas, kuris yra pasirinktinai pakeistas vienu arba dviem pakaitais, parinktais iš halogeno, C_{1-4}-alkilo arba C_{1-4}-alkoksi;

$R^2/R^{2'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-alkilas, hidroksi, C_{1-4}-alkoksi, C_3-C_6-cikloalkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą arba žiedą, turintį $-CH_2OCH_2-$;

$R^3/R^{3'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-alkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą;

arba R^3 ir R^2 gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą arba žiedą, turintį $-(CH_2)_2OCH_2-$;

arba jo farmaciniu požiūriu priimtina rūgšties prisijungimo druska, raceminis mišinys arba jo atitinkamas enantiomeras ir / arba optinis izomeras, ir / arba stereoizomeras.

3. Etinilo dariniai, kurių formulė I-A1 pagal bet kurį iš 1 arba 2 punktų, kur junginiai yra

3-(3-fluor-5-feniletinil-piridin-2-il)-5,5-dimetil-oksazolidin-2-onas

(5RS)-5-metoksimetil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-oksazolidin-2-onas

(5R arba 5S)-5-metoksimetil-3-(-feniletinil-piridin-2-il)-oksazolidin-2-onas

(5S arba 5R)-5-metoksimetil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-oksazolidin-2-onas

5,5-dimetil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-oksazolidin-2-onas

3-[5-(3-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-5,5-dimetil-oksazolidin-2-onas

5,5-dimetil-3-(5-piridin-3-iletinil-piridin-2-il)-oksazolidin-2-onas

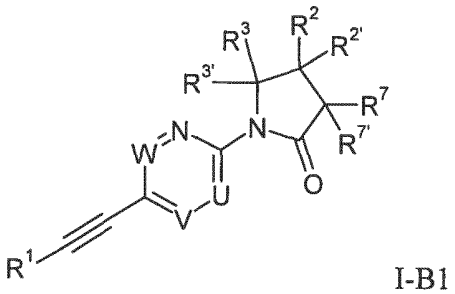
(5RS)-5-tret-butil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-oksazolidin-2-onas

6-(5-feniletinil-piridin-2-il)-4-oksa-6-aza-spiro[2.4]heptan-5-onas

7-(5-feniletinil-piridin-2-il)-5-oksa-7-aza-spiro[3.4]oktan-6-onas

3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-1-oksa-3-aza-spiro[4.4]nonan-2-onas
3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-1-oksa-3-aza-spiro[4.5]dekan-2-onas
(5RS)-5-tret-butil-5-metil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-oksazolidin-2-onas
(3aRS,6aSR)-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-heksahidro-ciklopentaoksazol-2-onas
(3aRS,6aSR)-3-(5-piridin-3-iletinil-piridin-2-il)-heksahidro-ciklopentaoksazol-2-onas
(3aRS,6aSR)-3-[5-(5-fluor-piridin-3-iletinil)-piridin-2-il]-heksahidro-ciklopentaoksazol-2-onas
(RS)-4,5,5-trimetil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-oksazolidin-2-onas
4,4,5,5-tetrametil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-oksazolidin-2-onas
3-[5-(5-fluor-piridin-3-iletinil)-piridin-2-il]-5,5-dimetil-oksazolidin-2-onas
5,5-dimetil-3-(5-pirimidin-5-iletinil-piridin-2-il)-oksazolidin-2-onas
5,5-dimetil-3-[5-(1-metil-1H-pirazol-4-iletinil)-piridin-2-il]-oksazolidin-2-onas
3-[5-(4-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-5,5-dimetil-oksazolidin-2-onas
3-[5-(3,4-difluor-feniletinil)-piridin-2-il]-5,5-dimetil-oksazolidin-2-onas
3-[5-(2,5-difluor-feniletinil)-piridin-2-il]-5,5-dimetil-oksazolidin-2-onas
3-[5-(6-fluor-piridin-3-iletinil)-piridin-2-il]-5,5-dimetil-oksazolidin-2-onas
6-(5-piridin-3-iletinil-piridin-2-il)-4-oksa-6-aza-spiro[2.4]heptan-5-onas
(6SR,7RS)-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-heksahidro-benzooksazol-2-onas
(3aSR,7aRS)-(3aRS,7RS)-1-(5-feniletinil-piridin-2-il)-heksahidro-pirano[4,3-d]oksazol-2-onas arba
5,5-dimetil-3-(6-(feniletinil)piridazin-3-il)oksazolidin-2-onas.

4. Etinilo dariniai, kurių formulė I-B1, apimti formule I pagal 1 punktą,



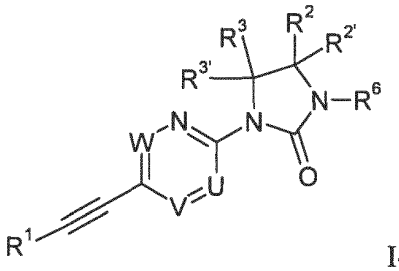
I-B1

kur
U yra =N- arba =C(R^5)-;
V yra -CH= arba N=;
W yra =CH- arba =N-;
su sąlyga, kad tik vienas iš U, V arba W gali būti azotas;
R^5 yra vandenilis, metilas arba halogenas;
R^1 yra fenilas arba heteroarilas, kuris yra pasirinktinai pakeistas vienu arba dviem pakaitais, parinktais iš halogeno, C_{1-4}-alkilo arba C_{1-4}-alkoksi;
R^2/$R^{2'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-alkilas, hidroksi, C_{1-4}-alkoksi, C_3-C_6-cikloalkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą arba žiedą, turintį -CH_2OCH_2-;
R^3/$R^{3'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-alkilas, CH_2- C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą;
arba R^3 ir R^2 gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą arba žiedą, turintį -$(CH_2)_2OCH_2$-;
R^7/$R^{7'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, hidroksi, žemesnysis alkilas arba žemesnysis alkoksi;
arba jo farmaciniu požiūriu priimtina rūgšties prisijungimo druska, raceminis mišinys arba jo atitinkamas enantiomeras ir / arba optinis izomeras, ir / arba stereoizomeras.

5. Etinilo dariniai, kurių formulė I-B1 pagal bet kurį iš 1 ir 4 punktų, kur junginiai yra
4,4-dimetil-1-(5-feniletinil-piridin-2-il)pirolidin-2-onas
(3RS)-3-hidroksi-4,4-dimetil-1-(5-feniletinil-piridin-2-il)pirolidin-2-onas
1-(3-fluor-5-feniletinil-piridin-2-il)-4,4-dimetilpirolidin-2-onas

1-[5-(5-fluor-piridin-3-iletinil)-piridin-2-il]-4,4-dimetilpirolidin-2-onas
4,4-dimetil-1-(5-piridin-3-iletinil-piridin-2-il)pirolidin-2-onas
1-[5-(5-chlor-piridin-3-iletinil)-piridin-2-il]-4,4-dimetilpirolidin-2-onas
1-[5-(3-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-4,4-dimetilpirolidin-2-onas
4,4-dimetil-1-(3-metil-5-feniletinil-piridin-2-il)pirolidin-2-onas
2-(5-feniletinil-piridin-2-il)-2-aza-spiro[4.4]nonan-3-onas
(RS)-3-metoksi-4,4-dimetil-1-(5-feniletinil-piridin-2-il)pirolidin-2-onas
(5R arba 5S)-5-metoksimetil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-oksazolidin-2-onas
(5S arba 5R)-5-metoksimetil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-oksazolidin-2-onas
(RS)-1-[5-(5-chlor-piridin-3-iletinil)-piridin-2-il]-3-metoksi-4,4-dimetilpirolidin-2-onas
(RS)-3-metoksi-4,4-dimetil-1-(5-m-toliletinil-piridin-2-il)pirolidin-2-onas
(RS)-1-[5-(3-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-3-metoksi-4,4-dimetilpirolidin-2-onas
(RS)-1-[5-(4-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-3-metoksi-4,4-dimetilpirolidin-2-onas
6-(5-feniletinil-piridin-2-il)-2-oksa-6-aza-spiro[3.4]oktan-7-onas
4,4-dimetil-5'-feniletinil-3,4,5,6-tetrahidro-[1,2']bipiridinil-2-onas
5'-(3-fluor-feniletinil)-4,4-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-[1,2']bipiridinil-2-onas
5'-(3-chlor-feniletinil)-4,4-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-[1,2']bipiridinil-2-onas
5'-(5-chlor-piridin-3-iletinil)-4,4-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-[1,2']bipiridinil-2-onas
5'-(4-fluor-feniletinil)-4,4-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-[1,2']bipiridinil-2-onas
5'-(2,5-difluor-feniletinil)-4,4-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-[1,2']bipiridinil-2-onas
4,4-dimetil-1-(5-feniletinil-pirimidin-2-il)pirolidin-2-onas
2-(5-feniletinil-pirimidin-2-il)-2-aza-spiro[4.4]nonan-3-onas
1-[5-(3-fluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-4,4-dimetilpirolidin-2-onas
1-[5-(3-chlor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-4,4-dimetilpirolidin-2-onas
1-[5-(4-fluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-4,4-dimetilpirolidin-2-onas
1-[5-(2,5-difluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-4,4-dimetilpirolidin-2-onas
(RS)-3-metoksi-4,4-dimetil-1-(5-feniletinil-pirimidin-2-il)pirolidin-2-onas
(5R arba SS)-5-metoksimetil-3-(5-feniletinil-pirimidin-2-il)-oksazolidin-2-onas
(5S arba 5R)-5-metoksimetil-3-(5-feniletinil-pirimidin-2-il)-oksazolidin-2-onas
(RS)-1-[5-(3-fluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-3-metoksi-4,4-dimetilpirolidin-2-onas
(R arba S)-1-[5-(3-fluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-3-metoksi-4,4-dimetilpirolidin-2-onas
(S arba R)-1-[5-(3-fluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-3-metoksi-4,4-dimetilpirolidin-2-onas
(R arba S)-1-[5-(2,5-difluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-3-metoksi-4,4-dimetilpirolidin-2-onas
4,4-dimetil-1-(6-(feniletinil)piridazin-3-il)pirolidin-2-onas
4,4-dimetil-1-(5-(piridin-3-iletinil)pirazin-2-il)pirolidin-2-onas.

6. Etinilo dariniai, kurių formulė I-C1, apimti formule I pagal 1 punktą



I-C1

kur
U yra =N- arba =C(R^5)-;
V yra -CH= arba N=;
W yra =CH- arba =N-;
su sąlyga, kad tik vienas iš U, V arba W gali būti azotas.
R^5 yra vandenilis, metilas arba halogenas;
R^6 yra vandenilis arba C_{1-4}-alkilas;

R^1 yra fenilas arba heteroarilas, kuris yra pasirinktinai pakeistas vienu arba dviem pakaitais, parinktais iš halogeno, C_{1-4}-alkilo arba C_{1-4}-alkoksi;

$R^2/R^{2'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-alkilas, hidroksi, C_{1-4}-alkoksi, C_3-C_6-cikloalkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą arba a žiedą, turintį -CH_2OCH_2-;

$R^3/R^{3'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, žemesnysis alkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą;

arba R^3 ir R^2 gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą arba žiedą, turintį -$(CH_2)_2OCH_2$-;

arba R^6 ir R^2 gali sudaryti kartu kartu su anglies atomu ir azoto atomu, prie kurių jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą;

arba jo farmaciniu požiūriu priimtina rūgšties prisijungimo druska, raceminis mišinys arba jo atitinkamas enantiomeras ir / arba optinis izomeras, ir / arba stereoizomeras.

7. Etinilo dariniai, kurių formulė I-C1 pagal bet kurį iš 1 ir 6 punktų, kur junginiai yra

4,4-dimetil-1-(5-feniletinil-piridin-2-il)-imidazolidin-2-onas

3,4,4-trimetil-1-(5-feniletinil-piridin-2-il)-imidazolidin-2-onas

3-etil-4,4-dimetil-1-(5-feniletinil-piridin-2-il)-imidazolidin-2-onas

3-izopropil-4,4-dimetil-1-(5-feniletinil-piridin-2-il)-imidazolidin-2-onas

1-metil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-1,3-diaza-spiro[4.4]nonan-2-onas

(RS)-4-ciklopentil-3-metil-1-(5-feniletinil-piridin-2-il)-imidazolidin-2-onas

3,4,4-trimetil-1-(5-piridin-3-iletinil-piridin-2-il)-imidazolidin-2-onas

1-[5-(5-fluor-piridin-3-iletinil)-piridin-2-il]-3,4,4-trimetil-imidazolidin-2-onas

3,4,4-trimetil-1-[5-(1-metil-1H-pirazol-4-iletinil)-piridin-2-il]-imidazolidin-2-onas

1-[5-(5-chlor-piridin-3-iletinil)-piridin-2-il]-3,4,4-trimetil-imidazolidin-2-onas

3,4,4-trimetil-1-(5-piridazin-4-iletinil-piridin-2-il)-imidazolidin-2-onas

1-[5-(3-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-3,4,4-trimetil-imidazolidin-2-onas

1-[5-(3-chlor-feniletinil)-piridin-2-il]-3,4,4-trimetil-imidazolidin-2-onas

3,4,4-trimetil-1-(5-pirimidin-5-iletinil-piridin-2-il)-imidazolidin-2-onas

3,4,4-trimetil-1-(5-m-toliletinil-piridin-2-il)-imidazolidin-2-onas

1-[5-(4-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-3,4,4-trimetil-imidazolidin-2-onas

(RS)-2-(5-feniletinil-piridin-2-il)-heksahidro-imidazo[1,5-a]piridin-3-onas

(RS)-2-(5-piridin-3-iletinil-piridin-2-il)-heksahidro-imidazo[1,5-a]piridin-3-onas

(RS)-2-[5-(3-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-heksahidro-imidazo[1,5-a]piridin-3-onas

(RS)-4-ciklopropil-3-metil-1-(5-feniletinil-piridin-2-il)-imidazolidin-2-onas

(3aSR,7aRS)-(3aRS,7RS)-1-metil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-oktahidro-benzoimidazol-2-onas

(3aSR,7aRS)-(3aRS,7RS)-1-metil-3-(5-piridin-3-iletinil-piridin-2-il)-oktahidro-benzoimidazol-2-onas

(3aSR,7aRS)-(3aRS,7RS)-1-[5-(5-fluor-piridin-3-iletinil)-piridin-2-il]-3-metil-oktahidro-benzoimidazol-2-onas

4-metil-6-(5-feniletinil-piridin-2-il)-4,6-diaza-spiro[2.4]heptan-5-onas

(3aSR,7aRS)-(3aRS,7RS)-1-etil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-oktahidro-benzoimidazol-2-onas

(3aSR,7aRS)-(3aRS,7RS)-1-etil-3-(5-piridin-3-iletinil-piridin-2-il)-oktahidro-benzoimidazol-2-onas

(3aSR,7aRS)-(3aRS,7RS)-1-izopropil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-oktahidro-benzoimidazol-2-onas

(3aRS,6aSR)-1-metil-3-(5-(feniletinil)piridin-2-il)heksahidrociklopenta[d]imidazol-2(1H)-onas

(RS)-4-tret-butil-3-metil-1-(5-feniletinil-piridin-2-il)-imidazolidin-2-onas

1-[5-(3-fluor-feniletinil)-3-metil-piridin-2-il]-3,4,4-trimetil-imidazolidin-2-onas

(3aSR,6aRS)-1-[5-(3-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-3-metil-heksahidro-ciklopenta-imidazol-2-onas

1-[3-fluor-5-(4-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-3,4,4-trimetil-imidazolidin-2-onas

1-[3-fluor-5-(3-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-3,4,4-trimetil-imidazolidin-2-onas

6-[5-(4-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-4-metil-4,6-diaza-spiro[2.4]heptan-5-onas

6-[5-(3-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-4-metil-4,6-diaza-spiro[2.4]heptan-5-onas

3,4,4-trimetil-1-(5-feniletinil-pirimidin-2-il)-imidazolidin-2-onas

1-[5-(3-fluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-3,4,4-trimetil-imidazolidin-2-onas

1-[5-(2,5-difluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-3,4,4-trimetil-imidazolidin-2-onas

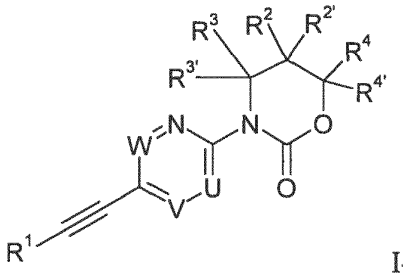
1-[5-(4-fluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-3,4,4-trimetil-imidazolidin-2-onas

1-[5-(3,4-di-fluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-3,4,4-trimetil-imidazolidin-2-onas

3-izopropil-4,4-dimetil-1-(5-feniletinil-pirimidin-2-il)-imidazolidin-2-onas

1-[5-(3-fluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-3-izopropil-4,4-dimetil-imidazolidin-2-onas
1-[5-(4-fluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-3-izopropil-4,4-dimetil-imidazolidin-2-onas
1-[5-(4-fluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-3-etil-4,4-dimetil-imidazolidin-2-onas
1-[5-(3-fluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-3-etil-4,4-dimetil-imidazolidin-2-onas
4-metil-6-(5-feniletinil-pirimidin-2-il)-4,6-diaza-spiro[2.4]heptan-5-onas
3,4,4-trimetil-1-(6-(m-toliletinil)piridazin-3-il)imidazolidin-2-onas
1-(6-((3-chlorfenil)etinil)piridazin-3-il)-3,4,4-trimetilimidazolidin-2-onas
3,4,4-trimetil-1-(5-(feniletinil)pirazin-2-il)imidazolidin-2-onas
3,4,4-trimetil-1-(5-(piridin-3-iletinil)pirazin-2-il)imidazolidin-2-onas
1-(5-((3-fluorfenil)etinil)pirazin-2-il)-3,4,4-trimetilimidazolidin-2-onas
1-(5-((4-fluorfenil)etinil)pirazin-2-il)-3,4,4-trimetilimidazolidin-2-onas
(3aRS,6aSR)-1-metil-3-(6-feniletinil-piridazin-3-il)-heksahidro-ciklopentaimidazol-2-onas arba
(3aSR,6aRS)-1-[6-(3-fluor-feniletinil)-piridazin-3-il]-3-metil-heksahidro-ciklopentaimidazol-2-onas.

8. Etinilo dariniai, kurių formulė I-D1 apimti formule I pagal 1 punktą



I-D1

kur

U yra =N- arba =C(R^5)-;

V yra -CH= arba -N=;

W yra =CH- arba =N-;

su sąlyga, kad tik vienas iš U, V arba W gali būti azotas.

R^5 yra vandenilis, metilas arba halogenas;

R^1 yra fenilas arba heteroarilas, kuris yra pasirinktinai pakeistas vienu arba dviem pakaitais, parinktais iš halogeno, C_{1-4}-alkilo arba C_{1-4}-alkoksi;

R^2/$R^{2'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-alkilas, hidroksi, C_{1-4}-alkoksi, C_3-C_6-cikloalkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi, arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą arba žiedą, turintį -CH_2OCH_2-;

R^3/$R^{3'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, žemesnysis alkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą;

arba R^3 ir R^2 gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą arba žiedą, turintį -$(CH_2)_2OCH_2$-;

R^4/$R^{4'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-žemesnysis alkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą;

R^4 ir R^2 gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą;

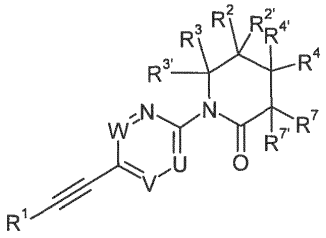
arba jo farmaciniu požiūriu priimtina rūgšties prisijungimo druska, raceminis mišinys arba jo atitinkamas enantiomeras ir / arba optinis izomeras, ir / arba stereoizomeras.

9. Etinilo dariniai, kurių formulė I-D1 pagal bet kurį iš 1 ir 8 punktų, kur junginiai yra

5,5-dimetil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-[1,3]oksazinan-2-onas
6,6-dimetil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-[1,3]oksazinan-2-onas
6,6-dimetil-3-(5-piridin-3-iletinil-piridin-2-il)-[1,3]oksazinan-2-onas
3-[5-(5-fluor-piridin-3-iletinil)-piridin-2-il]-6,6-dimetil-[1,3]oksazinan-2-onas
3-[5-(5-chlor-piridin-3-iletinil)-piridin-2-il]-6,6-dimetil-[1,3]oksazinan-2-onas
3-[5-(3-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-6,6-dimetil-[1,3]oksazinan-2-onas
3-[5-(3-chlor-feniletinil)-piridin-2-il]-6,6-dimetil-[1,3]oksazinan-2-onas
6,6-dimetil-3-(5-m-toliletinil-piridin-2-il)-[1,3]oksazinan-2-onas

3-[5-(4-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-6,6-dimetil-[1,3]oksazinan-2-onas
3-[5-(3,4-difluor-feniletinil)-piridin-2-il]-6,6-dimetil-[1,3]oksazinan-2-onas
3-[5-(2,5-difluor-feniletinil)-piridin-2-il]-6,6-dimetil-[1,3]oksazinan-2-onas
7,7-dimetil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-[1,3]oksazepan-2-onas
(RS)-5-hidroksi-6,6-dimetil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-[1,3]oksazinan-2-onas
(4aRS,7aSR)-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-heksahidro-ciklopenta[e][1,3]oksazin-2-onas
(4aRS,7aRS)-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-heksahidro-ciklopenta[e][1,3]oksazin-2-onas
(RS)-5,6,6-trimetil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-[1,3]oksazinan-2-onas
(RS)-6-metoksimetil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-[1,3]oksazinan-2-onas
(RS)-5-metoksi-6,6-dimetil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-[1,3]oksazinan-2-onas
(RS)-5,6,6-trimetil-3-(5-feniletinil-pirimidin-2-il)-[1,3]oksazinan-2-onas
(RS)-3-[5-(2,5-difluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-5,6,6-trimetil-[1,3]oksazinan-2-onas
(RS)-3-[5-(3-fluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-5,6,6-trimetil-[1,3]oksazinan-2-onas
(RS)-3-[5-(4-fluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-5,6,6-trimetil-[1,3]oksazinan-2-onas
6,6-dimetil-3-(6-(feniletinil)piridazin-3-il)-1,3-oksazinan-2-onas
6,6-dimetil-3-(5-(feniletinil)pirazin-2-il)-1,3-oksazinan-2-onas
(RS)-3-[5-(3-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-5-metoksi-6,6-dimetil-[1,3]oksazinan-2-onas

10. Etinilo dariniai, kurių formulė I-E1, apimti formule I pagal 1 punktą



I-E1

kur

U yra =N- arba =C(R^5)-;

V yra -CH= arba N=;

W yra =CH- arba =N-;

su sąlyga, kad tik vienas iš U, V arba W gali būti azotas.

R^5 yra vandenilis, metilas arba halogenas;

R^7/$R^{7'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, hidroksi, C_{1-4}-alkilas arba C_{1-4}-alkoksi;

R^1 yra fenilas arba heteroarilas, kuris yra pasirinktinai pakeistas vienu arba dviem pakaitais, parinktais iš halogeno, C_{1-4}-alkilo arba C_{1-4}-alkoksi;

R^2/$R^{2'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-alkilas, hidroksi, C_{1-4}-alkoksi, C_3-C_6-cikloalkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą arba a žiedą, turintį -CH_2OCH_2-;

R^3/$R^{3'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, žemesnysis alkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą;

arba R^3 ir R^2 gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą arba žiedą, turintį -$(CH_2)_2OCH_2$-;

R^4/$R^{4'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-alkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą;

R^4 ir R^2 gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą;

arba jo farmaciniu požiūriu priimtina rūgšties prisijungimo druska, raceminis mišinys arba jo atitinkamas enantiomeras ir / arba optinis izomeras, ir / arba stereoizomeras.

11. Etinilo dariniai, kurių formulė I-E1 pagal bet kurį iš 1 ir 10 punktų, kur junginiai yra

5,5-dimetil-5'-feniletinil-3,4,5,6-tetrahidro-[1,2']bipiridinil-2-onas

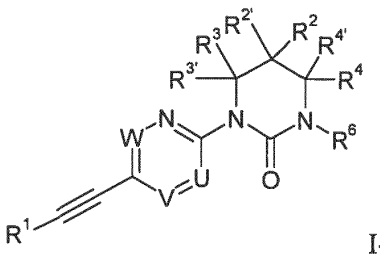
5'-(3-fluor-feniletinil)-5,5-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-[1,2']bipiridinil-2-onas

5,5-dimetil-1-(5-feniletinil-pirimidin-2-il)-piperidin-2-onas

4,4-dimetil-1-(5-feniletinil-pirimidin-2-il)-piperidin-2-onas

1-[5-(3-fluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-4,4-dimetil-piperidin-2-onas
1-[5-(2,5-difluor-feniletinil)-pirimidin-2-il]-4,4-dimetil-piperidin-2-onas
4,4-dimetil-1-(6-(feniletinil)piridazin-3-il)piperidin-2-onas
1-(5-((3-fluorfenil)etinil)pirazin-2-il)-4,4-dimetilpiperidin-2-onas
4,4-dimetil-1-(5-(piridin-3-iletinil)pirazin-2-il)piperidin-2-onas arba
4,4-dimetil-1-(5-(feniletinil)pirazin-2-il)piperidin-2-onas.

12. Etinilo dariniai, kurių formulė I-F1, apimti formule I pagal 1 punktą

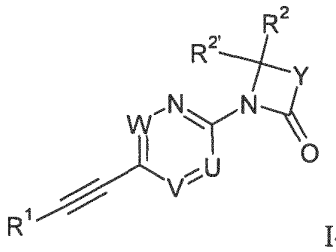


I-F1

kur
U yra =N- arba =C(R^5)-;
V yra -CH= arba N=;
W yra =CH- arba =N-;
su sąlyga, kad tik vienas iš U, V arba W gali būti azotas.
R^5 yra vandenilis, metilas arba halogenas;
R^6 yra vandenilis arba žemesnysis alkilas;
R^1 yra fenilas arba heteroarilas, kuris yra pasirinktinai pakeistas vienu arba dviem pakaitais, parinktais iš halogeno, C_{1-4}-alkilo arba C_{1-4}-alkoksi;
R^2/$R^{2'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-alkilas, hidroksi, C_{1-4}-alkoksi, C_3-C_6-cikloalkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą arba žiedą, turintį -CH_2OCH_2-;
R^3/$R^{3'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-alkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą;
arba R^3 ir R^2 gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą arba žiedą, turintį -$(CH_2)_2OCH_2$-;
R^4/$R^{4'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-alkilas, CH_2-C_{1-4}-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą;
R^4 ir R^2 gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą;
arba jo farmaciniu požiūriu priimtina rūgšties prisijungimo druska, raceminis mišinys arba jo atitinkamas enantiomeras ir / arba optinis izomeras, ir / arba stereoizomeras.

13. Etinilo dariniai, kurių formulė I-F1 pagal bet kurį iš 1 ir 12 punktų, kur junginiai yra
5,5-dimetil-1-(5-feniletinil-piridin-2-il)-tetrahidro-pirimidin-2-onas
1,5,5-trimetil-3-(5-feniletinil-piridin-2-il)-tetrahidro-pirimidin-2-onas
3,4,4-trimetil-1-(5-feniletinil-piridin-2-il)-tetrahidro-pirimidin-2-onas
1-[5-(2,5-difluor-feniletinil)-piridin-2-il]-3,4,4-trimetil-tetrahidro-pirimidin-2-onas
1-[5-(4-fluor-feniletinil)-piridin-2-il]-3,4,4-trimetil-tetrahidro-pirimidin-2-onas
3,4,4-trimetil-5'-feniletinil-3,4,5,6-tetrahidro-[1,2']bipirimidinil-2-onas
5'-(3-fluor-feniletinil)-3,4,4-trimetil-3,4,5,6-tetrahidro-[1,2']bipirimidinil-2-onas
5'-(2,5-difluor-feniletinil)-3,4,4-trimetil-3,4,5,6-tetrahidro-[1,2']bipirimidinil-2-onas
4,4-dimetil-1-(5-(feniletinil)pirazin-2-il)tetrahidropirimidin-2(1H)-onas
3,4,4-trimetil-1-(5-(feniletinil)pirazin-2-il)tetrahidropirimidin-2(1H)-onas
1-(5-((3-fluorfenil)etinil)pirazin-2-il)-4,4-dimetiltetrahidropirimidin-2(1H)-onas arba
1-(5-((3-fluorfenil)etinil)pirazin-2-il)-3,4,4-trimetiltetrahidropirimidin-2(1H)-onas.

14. Etinilo dariniai, kurių formulė I-G1, apimti formule I pagal 1 punktą



I-G1

kur

U yra =N- arba =C(R^5)-;

V yra -CH= arba -N=;

W yra =CH- arba =N-;

su sąlyga, kad tik vienas iš U, V arba W gali būti azotas.

R^5 yra vandenilis, metilas arba halogenas;

Y yra -N(R^6)-, -O-, -C($R^{7'}$)(R^7)-, -CH_2O- arba -CH_2S(O)^2-;

kur R^6 yra vandenilis arba C_{1-4}-alkilas ir R^7/$R^{7'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, hidroksi, C_{1-4}-alkilas arba C_{1-4}-alkoksi;

R^1 yra fenilas arba heteroarilas, kuris yra pasirinktinai pakeistas vienu arba dviem pakaitais, parinktais iš halogeno, C_{1-4}-alkilo arba C_{1-4}-alkoksi;

R^2/$R^{2'}$ yra nepriklausomai vienas nuo kito vandenilis, C_{1-4}-alkilas, hidroksi, C_{1-4}-alkoksi, C_3-C_6-cikloalkilas, CH_2-alkoksi arba gali sudaryti kartu su anglies atomu, prie kurio jie yra prijungti, C_3-C_6-cikloalkilą arba žiedą, turintį -CH_2OCH_2-;

arba R^6 ir R^2 gali sudaryti kartu su anglies atomu ir azoto atomu, prie kurių jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą;

arba R^2 ir R^7 gali sudaryti kartu su anglies atomais, prie kurių jie yra prijungti, C_{3-6}-cikloalkilą;

arba jo farmaciniu požiūriu priimtina rūgšties prisijungimo druska, raceminis mišinys arba jo atitinkamas enantiomeras ir / arba optinis izomeras, ir / arba stereoizomeras.

15. Etinilo dariniai, kurių formulė I-G1 pagal bet kurį iš 1 ir 14 punktų, kur junginiai yra

(1RS,5SR)-6-(5-feniletinil-piridin-2-il)-6-aza-biciklo[3.2.0]heptan-7-onas

3,3-dimetil-1-(5-feniletinil-piridin-2-il)-azetidin-2-onas arba

(1RS,5SR)-6-(5-piridin-3-iletinil-piridin-2-il)-6-aza-biciklo[3.2.0]heptan-7-onas.

16. Etinilo dariniai pagal 1 punktą, kur Y yra -CH_2O-.

17. Etinilo dariniai pagal bet kurį iš 1 ir 16 punktų, kur junginiai yra

(RS)-6-metil-4-(5-feniletinil-piridin-2-il)-morfolin-3-onas arba

6,6-dimetil-4-(5-feniletinil-piridin-2-il)-morfolin-3-onas.

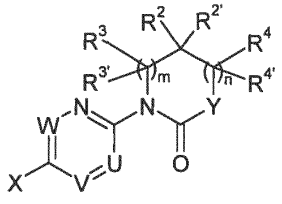
18. Etinilo dariniai pagal 1 punktą, kur Y yra -$CH_2S(O)_2$-.

19. Etinilo dariniai pagal bet kurį iš 1 ir 18 punktų, kur junginys yra 1,1-diokso-4-(5-feniletinilpiridin-2-il)-tiomorfolin-3-onas

20 Etinilo dariniai pagal 1 punktą, kur m yra 2.

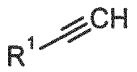
21. Etinilo dariniai pagal bet kurį iš 1 ir 20 punktų, kur junginys yra 7,7-dimetil-3-(5-feniletinilpiridin-2-il)-[1,3] oksazepan-2-onas.

22. Junginio, kurio formulė I kaip apibūdinta 1 punkte, gamybos būdas, apimantis reagavimo varijantą junginio, kurio

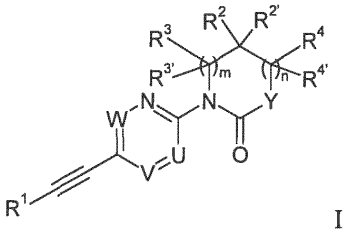


kur X yra tinkama atskylanti grupė, kuri gali būti pakeista acetileno fragmentu, parinktu iš bromo arba jodo atomo, trialkilstanilo grupės, boro rūgšties arba boro rūgšties esterio grupės,

su tinkamu aril-acetilenu, kurio formulė



prie junginio, kurio formulė



I

kur pakaitai yra apibūdinti 1 punkte, arba

jeigu pageidaujama, gautų junginių konvertavimas į farmaciniu požiūriu priimtinas rūgšties prisijungimo druskas.

23. Junginys pagal bet kurį iš 1-21 punktų, skirtas naudoti kaip terapiniu požiūriu aktyvi medžiaga.

24. Farmacinė kompozicija, apimanti bent vieną iš junginių pagal bet kurį iš 1-21 punktų, taip pat jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską.

25. Junginys pagal bet kurį iš 1-21 punktų, kai taikomas kaip enantiomerų, diastereomerų mišiniai arba enantiomeriškai gryna forma; taip pat jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirta naudoti kaip vaistas.

26. Junginio pagal bet kurį iš 1-21punktų, taip pat jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos panaudojimas gamybai vaisto, skirto šizofrenijos, kognityvinių ligų, trapios X sindromo arba autizmo gydymui arba prevencijai.

27. Junginys pagal bet kurį iš 1-21 punktų, skirtas naudoti šizofrenijos, kognityvinių ligų, trapios X sindromo arba autizmo gydyme arba prevencijoje.

---

(51) Int.Cl. ***C07D 401/12*** (2006.01)
A61K 31/4725 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)
(11) **2729460**
(96) 12730523.3
(96) 2012-06-27
(97) 2014-05-14
(97) 2016-01-13
(86) PCT/EP2012/062431
(86) 2012-06-27
(87) WO 2013/007518
(87) 2013-01-17
(30) 11305890, 2011-07-08, EP
11306033, 2011-12-29, EP
(72) NAGEL, Norbert, DE
BAUMGARTNER, Bruno, DE
BERCHTOLD, Harald, DE
PLETTENBURG, Oliver, DE
KADEREIT, Dieter, DE
MOHNICKE, Mandy, DE
GESSLER, Simon, DE
TILLNER, Joachim, DE

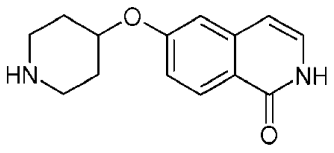
(73) SANOFI, 75008 Paris, FR

(74) Liudmila GERASIMOVIČ, 9, IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius, LT

(54) Kristaliniai 6-(piperidin-4-iloksi)-2H-izochinolin-1-ono hidrochlorido solvatai

Apibrėžties punktai: 21, brėžiniai: 0.

(57) 1. 6-(piperidin-4-iloksi)-2H-izochinolin-1-ono hidrochlorido kristalinis hidratas, kurio formulė



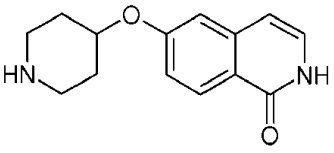
x HCl (I)

kur hidratas turi 1,85 -2,2 vandens molekulių vienai molekulei (I).

2. Hidratas pagal 1 punktą, kur hidratas turi 2,0 vandens molekules vienai molekulei (I).

3. Hidratas pagal 1 punktą, kur hidratas turi 10,5 -12,5 masės % vandens.

4. 6-(piperidin-4-iloksi)-2H-izohinolin-1-ono hidrochlorido kristalinis hidratas, kurio formulė



x HCl (I)

pasižymintis atspindžiu miltelių rentgeno spindulių difraktogramoje, gautoje naudojant $CuK\alpha_1$ spinduliuotę, prie 7,7 ± 0,2 laipsnių 2 teta.

5. Hidratas pagal 4 punktą, pasižymintis atspindžiais miltelių rentgeno spindulių difraktogramoje, gautoje naudojant $CuK\alpha_1$ spinduliuotę, prie 7,7, 15,2 ir 16,8 laipsnių 2 teta ± 0,2 laipsnių 2 teta.

6. Hidratas pagal 4 punktą, pasižymintis atspindžiais miltelių rentgeno spindulių difraktogramoje, gautoje naudojant $CuK\alpha_1$ spinduliuotę, prie 7,7, 15,2, 16,8, 22,4, 25,0 ir 26,6 laipsnių 2 teta ± 0,2 laipsnių 2 teta.

7. 6-(piperidin-4-iloksi)-2H-izohinolin-1-ono hidrochlorido hidratas pagal bet kurį iš 1-6 punktų, skirtas naudoti kaip vaistas.

8. 6-(piperidin-4-iloksi)-2H-izochinolin-1-ono hidrochlorido hidratas pagal bet kurį iš 1-6 punktų, skirtas naudoti kaip vaistas hipertenzijos, plaučių hipertenzijos, akies hipertenzijos, retinopatijos, glaukomos, periferinės kraujo apytakos sutrikimo, periferinės arterijų okliuzinės ligos (PAOL), koronarinės širdies ligos, stenokardijos, širdies hipertrofijos, širdies nepakankamumo, išemijos ligų, taikinio organo pažeidimo, plaučių fibrozės, kepenų fibrozės, kepenų nepakankamumo, nefropatijos, inkstų nepakankamumo, inkstų fibrozės, inkstų glomerulosklerozės, organų hipertrofijos, astmos, lėtinės obstrukcinės plaučių ligos (LOPL), suaugusių kvėpavimo takų distreso sindromo, trombinių sutrikimų, insulto, smegenų kraujagyslių spazmo, cerebrinės išemijos, skausmo, neuronų degeneracijos, stuburo smegenų pažeidimo, Alzheimerio ligos, priešlaikinio gimdymo, erekcijos disfunkcijos, endokrininės funkcijos sutrikimų, arteriosklerozės, prostatos hipertrofijos, diabeto ir diabeto komplikacijų, metabolinio sindromo, kraujagyslių restenozės, aterosklerozės, uždegimo, autoimuninių ligų, osteopatijos, bakterinės virškinamojo trakto infekcijos, sepsio ar vėžio vystymosi ir progresavimo gydymui ir / arba prevencijai.

9. 6-(piperidin-4-iloksi)-2H-izochinolin-1-ono hidrochlorido hidratas pagal 7 arba 8 punktą, skirtas naudoti kaip vaistas nefropatijos gydymui ir / arba prevencijai.

10. Hidratas, skirtas naudoti pagal 8 punktą, kur nefropatija yra diabetinė nefropatija.

11. Kieta farmacinė kompozicija, apimanti 6-(piperidin-4-iloksi)-2H-izochinolin-1-ono hidrochlorido hidratą pagal bet kurį iš 1-6 punktų ir vieną arba kelis farmaciniu požiūriu priimtinus ekscipientus.

12. Kompozicija pagal 11 punktą, skirta hipertenzijos, plaučių hipertenzijos, akies hipertenzijos, retinopatijos, glaukomos, periferinės kraujo apytakos sutrikimo, periferinės arterijų okliuzinės ligos (PAOL), koronarinės širdies ligos, stenokardijos, širdies hipertrofijos, širdies nepakankamumo, išemijos ligų, taikinio organo pažeidimo, plaučių fibrozės, kepenų fibrozės, kepenų nepakankamumo, nefropatijos, inkstų nepakankamumo, inkstų fibrozės, inkstų glomerulosklerozės, organų hipertrofijos, astmos, lėtinės obstrukcinės plaučių ligos (LOPL), suaugusių kvėpavimo takų distreso sindromo, trombinių sutrikimų, insulto, smegenų kraujagyslių spazmo, cerebrinės išemijos, skausmo, neuronų degeneracijos, stuburo smegenų pažeidimo, Alzheimerio ligos, priešlaikinio gimdymo, erekcijos disfunkcijos, endokrininės funkcijos sutrikimų, arteriosklerozės, prostatos hipertrofijos, diabeto ir diabeto komplikacijų, metabolinio sindromo, kraujagyslių restenozės, aterosklerozės, uždegimo, autoimuninių ligų, osteopatijos, bakterinės virškinamojo trakto infekcijos, sepsio ar vėžio vystymosi ir progresavimo gydymui ir / arba prevencijai.

13. Kompozicija pagal 11 arba 12 punktą, skirta nefropatijos gydymui ir / arba prevencijai.

14. kompozicija pagal 13 punktą, kur nefropatija yra diabetinė nefropatija.

15. Vaistas, apimantis vieną arba kelis junginius pagal vieną arba kelis iš 1-6 punktų ir bent vieną papildomą veikliąjį ingredientą.

16. Vaistas pagal 15 punktą, apimantis kaip papildomą veikliąjį ingredientą vieną arba kelis priešdiabetinius agentus, veikliuosius hipoglikeminius ingredientus arba prieshipertenzinius agentus.

17. Vaistas pagal 15 punktą, apimantis kaip papildomą veikliąjį ingredientą vieną arba kelis beta receptoriaus blokatorius, kalcio kanalo blokatorius arba renino-angiotenzino slopiklius.

18. Vaistas pagal 17 punktą, apimantis kaip papildomą veikliąjį ingredientą verapamilį, gallopamilį, fendiliną, diltiazemą, nitrendipiną, felodipiną, amlodipiną, nifedipiną, lerkanidipiną, nimodipiną, nikardipiną, lacidipiną, isradipiną, nisoldipiną, nilvadipiną arba manidipiną.

19. Vaistas pagal 18 punktą, apimantis kaip papildomą veikliąjį ingredientą amlodipiną.

20. Vaistas pagal 15 punktą, apimantis kaip papildomą veikliąjį ingredientą vieną arba kelis ACE (angiotenziną konvertuojančio fermento) slopiklius.

21. Vaistas pagal 20 punktą, apimantis kaip papildomą veikliąjį ingredientą benazeprilį, kaptoprilį, cilazaprilį, enalaprilį, fosinoprilį, imidaprilį, lisinoprilį, moeksiprilį, perindoprilį, hinaprilį, ramiprilu, spiraprilį, trandolaprilį arba zofenoprilį.

---

(51) Int.Cl. ***C07D 401/14*** (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01)
A61K 31/4155 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)
A61K 31/4468 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)

(11) **2545045**

(96) 11711709.3

(96) 2011-03-09

(97) 2013-01-16

(97) 2016-01-06

(86) PCT/US2011/027665

(86) 2011-03-09

(87) WO 2011/112662

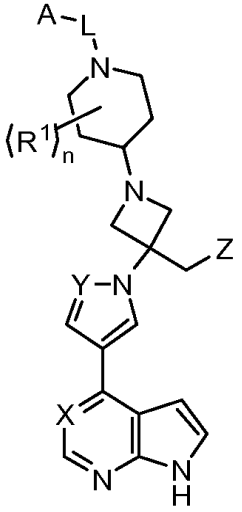
(87) 2011-09-15

(30) 415602 P, 2010-11-19, US
312588 P, 2010-03-10, US

(72) HUANG, Taisheng, US
XUE, Chu-Biao, US
WANG, Anlai, US
KONG, Ling, US
YE, Hai Fen, US
YAO, Wenqing, US
RODGERS, James D., US
SHEPARD, Stacey, US
WANG, Haisheng, US
SHAO, Lixin, US
LI, Hui-Yin, US
LI, Qun, US
(73) Incyte Holdings Corporation, Wilmington, DE 19803, US
(74) Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

(54) Piperidin-4-ilazetidino dariniai, kaip JAK1 inhibitoriai
Apibrėžties punktai: 24, brėžiniai: 0.

(57) 1. Formulės (I) junginys:



I

arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska; kur:

X yra N arba CR^2;

Y yra N arba CR^2;

Z yra H, ciano, halogenas, C_{1-3} alkilas arba C_{1-3} halogenalkilas;

L yra $C(R^4)_2$, C(=O), $C(=O)N(R^{4a})$, $C(=O)C(R^{4b})_2$, $S(=O)_2$, C(=O)O, $C(=O)OC(R^{4b})_2$ arba $C(=O)N(R^{4a})C(R^{4b})_2$;

A yra C_{1-6} alkilas, C_{3-14} cikloalkilas, C_{2-13} heterocikloalkilas, C_{6-14} arilas arba C_{1-14} heteroarilas; kur minėtas C_{1-6} alkilas, C_{3-14} cikloalkilas, C_{2-13} heterocikloalkilas, C_{6-14} arilas ir C_{1-14} heteroarilas yra kiekvienas pasirinktinai pakeisti 1, 2, 3, 4, 5, arba 6 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis;

kiekvienas R^1 yra nepriklausomai C_{1-4} alkilas, hidroksilas, C_{1-4} alkoksi, fluoras, hidroksi-C_{1-4} alkilas arba C_{1-4}alkoksi-C_{1-4} alkilas; arba

dvi R^1 grupės kartu sudaro 2- arba 3-anglies tiltelį arba tiltelį, kurio formulė $-CH_2-O-CH_2-$;

R^2 yra H, halogenas, hidroksilas, ciano, C_{1-4}alkilas, C_{1-4}halogenalkilas arba C_{1-4}alkoksi;

R^3 yra H, ciano, nitro, halogenas, hidroksilas, C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{3-7} cikloalkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{1-6}alkoksi, C_{1-6}halogenalkoksi, amino, C_{1-6}alkilamino, di-C_{1-6} alkilamino, C_{1-6}alkilsulfonilo, karbamilo, C_{1-6}alkilkarbamilo, di-C_{1-6}alkilkarbamilo, karboksi, C_{1-6}alkilkarbonilo arba C_{1-6}alkoksikarbonilo grupė;

kiekvienas R^4 yra nepriklausomai H arba C_{1-4} alkilas; arba

dvi R^4 grupės, kartu su anglies atomu, prie kurio jos yra prijungtos, sudaro 3-, 4-, 5- arba 6-narį cikloalkilo žiedą;

R^{4a} yra H arba C_{1-4} alkilas;

kiekvienas R^{4b} yra nepriklausomai H arba C_{1-4} alkilas; arba

dvi R^{4b} grupės, kartu su anglies atomu, prie kurio jos yra prijungtos, sudaro 3-, 4-, 5- arba 6-narį cikloalkilo žiedą;

kiekvienas R^5 yra nepriklausomai halogenas, ciano, nitro, C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, halogensulfanilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10} cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{2-10}heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10}arilas, C_{6-10}aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas, C_{1-10}heteroaril-C_{1-3} alkilas, OR^a, SR^a, $C(O)R^b$, $C(O)NR^cR^d$, $C(O)OR^a$, $OC(O)R^b$, $OC(O)NR^cR^d$, NR^cR^d, $NR^cC(O)R^b$, $NR^cC(O)OR^a$, $NR^cC(O)NR^cR^d$, $C(=NR^e)R^b$, $C(=NR^e)NR^cR^d$, $NR^cC(=NR^e)NR^cR^d$, $NR^cS(O)R^b$, $NR^cS(O)_2R^b$, $NR^cS(O)_2NR^cR^d$, $S(O)R^b$, $S(O)NR^cR^d$, $S(O)_2R^b$ arba $S(O)_2NR^cR^d$; kur C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10}cikloalkilas, C_{3-10}cikloalkil-C_{1-3}alkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{2-10}heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10}arilas, C_{6-10}aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas ir C_{1-10}heteroaril-C_{1-3} alkilas yra kiekvienas pasirinktinai pakeisti 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^6 grupėmis;

kiekvienas R^6 yra nepriklausomai halogenas, ciano, nitro, C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, halogensulfanilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10} cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10}heterocikloalkilas, C_{2-10}heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10}arilas, C_{6-10}aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas, C_{1-10}heteroaril-C_{1-3} alkilas, OR^{a1}, SR^{a1}, $C(O)R^{b1}$, $C(O)NR^{c1}R^{d1}$, $C(O)OR^{a1}$, $OC(O)R^{b1}$, $OC(O)NR^{c1}R^{d1}$, $C(=NR^{e1})NR^{c1}R^{d1}$, $NR^{c1}C(=NR^{e1})NR^{c1}R^{d1}$, $NR^{c1}R^{d1}$, $NR^{c1}C(O)R^{b1}$, $NR^{c1}C(O)OR^{a1}$, $NR^{c1}C(O)NR^{c1}R^{d1}$, $NR^{c1}S(O)R^{b1}$, $NR^{c1}S(O)_2R^{b1}$, $NR^{c1}S(O)_2NR^{c1}R^{d1}$, $S(O)R^{b1}$,$S(O)NR^{c1}R^{d1}$, $S(O)_2R^{b1}$, arba $S(O)_2NR^{c1}R^{d1}$; kur minėtas C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10}cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{2-10}heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10}arilas, C_{6-10}aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10}heteroarilas ir C_{1-10}heteroaril-C_{1-3} alkilas yra kiekvienas pasirinktinai pakeisti 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis Rh grupėmis;

kiekvienas R^a, R^b, R^c ir R^d yra nepriklausomai H, C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10}cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{2-10} heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10} arilas, C_{6-10} aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas arba C_{1-10} heteroaril-C_{1-3} alkilas; kur minėtas C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10} cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10}heterocikloalkilas, C_{2-10}heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10} arilas, C_{6-10} aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas ir C_{1-10}heteroaril-C_{1-3} alkilas yra pasirinktinai pakeisti 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^g grupėmis;

arba bet kuris R^c ir R^d kartu su N atomu, prie kurio jie yra prijungti, sudaro 3-, 4-, 5-, 6- arba 7-narę heterocikloalkilo grupę arba heteroarilo grupę, kiekvieną pasirinktinai pakeistą 1, 2, 3 arba 4 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš halogeno, ciano, nitro, hidroksilo, C_{1-6} alkilo, C_{2-6} alkenilo, C_{2-6} alkinilo, C_{3-7} cikloalkilo, C_{1-6} halogenalkilo, C_{1-6} alkoksi, C_{1-6}halogenalkoksi, amino, C_{1-6} alkilamino, di-C_{1-6} alkilamino, tio, C_{1-6} alkiltio, C_{1-6}alkilsulfinilo, C_{1-6}alkilsulfonilo, karbamilo, C_{1-6}alkilkarbamilo, di-C_{1-6}alkilkarbamilo, karboksi, C_{1-6}alkilkarbonilo ir C_{1-6}alkoksikarbonilo;

kiekvienas R^e yra nepriklausomai H, C_{1-6}alkilas, CN, hidroksilas, C_{1-6}alkoksi, C_{1-6} alkilsulfonilas, karboksi, C_{1-6} alkilkarbonilas, aminosulfonilas, C_{1-6} alkilaminosulfonilas, di-C_{1-6} alkilaminosulfonilas, karbamilo, C_{1-6}alkilkarbamilo, arba di-C_{1-6}alkilkarbamilo grupė;

kiekvienas R^{a1}, R^{b1}, R^{c1} ir R^{d1} yra nepriklausomai H, C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10}cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10}heterocikloalkilas, C_{2-10} heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10} arilas, C_{6-10} aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas arba C_{1-10} heteroaril-C_{1-3} alkilas; kur minėtas C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10}cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10}heterocikloalkilas, C_{2-10}heterocikloalkil-C_{1-3}alkilas, C_{6-10} arilas, C_{6-10} aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas ir C_{1-10} heteroaril-C_{1-3} alkilas yra pasirinktinai pakeisti 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis $R^{g'}$ grupėmis;

arba bet kurie R^{c1} ir R^{d1} kartu su N atomu, prie kurio jie yra prijungti, sudaro 3-, 4-, 5-, 6- arba 7-narę heterocikloalkilo grupę arba heteroarilo grupę, kiekvieną pasirinktinai pakeistą 1, 2, 3 arba 4 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš halogeno, ciano, nitro, hidroksilo, C_{1-6} alkilo, C_{2-6} alkenilo, C_{2-6} alkinilo, C_{3-7} cikloalkilo, C_{1-6} halogenalkilo, C_{1-6} alkoksi, C_{1-6}halogenalkoksi, amino, C_{1-6}alkilamino, di-C_{1-6} alkilamino, tio, C_{1-6} alkiltio, C_{1-6}alkilsulfinilo, C_{1-6}alkilsulfonilo, karbamilo, C_{1-6}alkilkarbamilo, di-C_{1-6}alkilkarbamilo, karboksi, C_{1-6} alkilkarbonilo, C_{1-6} alkoksikarbonilo ir C_{1-6}alkilkarbonilamino;

kiekvienas R^{e1} yra nepriklausomai H, C_{1-6}alkilas, CN, hidroksilas, C_{1-6}alkoksi, C_{1-6} alkilsulfonilas, karboksi, C_{1-6} alkilkarbonilas, aminosulfonilas, C_{1-6} alkilaminosulfonilas, di-C_{1-6} alkilaminosulfonilas, karbamilo, C_{1-6}alkilkarbamilo arba di-C_{1-6}alkilkarbamilo grupė;

kiekvienas R^g, $R^{g'}$ ir R^h yra nepriklausomai halogenas, ciano, nitro, hidroksilas, C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{3-7} cikloalkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{1-6}alkoksi, C_{1-6}halogenalkoksi, amino, C_{1-6}alkilamino, di-C_{1-6}alkilamino, tio, C_{1-6} alkiltio grupė, C_{1-6}alkilsulfinilas, C_{1-6} alkilsulfonilas, karbamilo, C_{1-6}alkilkarbamilo, di-C_{1-6}alkilkarbamilo, karboksi, C_{1-6} alkilkarbonilo, C_{1-6}alkoksikarbonilo arba C_{1-6}alkilkarbonilamino grupė; ir

n yra 0, 1, 2, 3, arba 4.

2. Junginys pagal 1 punktą arba arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur:

X yra N arba CR^2;

Y yra N arba CR^3;

Z yra H, ciano, halogenas, C_{1-3} alkilas arba C_{1-3} halogenalkilas;

L yra $C(R^4)_2$, C(=O), C(=O)N(R^{4a}), C(=O)C(R^{4b})$_2$, arba $S(=O)_2$;

A yra C_{1-6} alkilas, C_{3-14} cikloalkilas, C_{2-13} heterocikloalkilas, C_{6-14} arilas arba C_{1-14} heteroarilas; kur minėtas C_{1-6} alkilas, C_{3-14} cikloalkilas, C_{2-13} heterocikloalkilas, C_{6-14}arilas, ir C_{1-14}heteroarilas yra kiekvienas pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3,

4, 5, arba 6 nepriklausomai parinktomis R5 grupėmis;

kiekvienas R^1 yra nepriklausomai C_{1-4} alkilas; arba

dvi R^1 grupės kartu sudaro 2- arba 3-anglies tiltelį;

R^2 yra H, halogenas, hidroksilas, ciano, C_{1-4} alkilas, C_{1-4} halogenalkilas arba C_{1-4} alkoksi;

R^3 yra H, ciano, nitro, halogenas, hidroksilas, C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{3-7} cikloalkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{1-6} alkoksi, C_{1-6}halogenalkoksi, amino, C_{1-6}alkilamino, di-C_{1-6} alkilamino grupė, C_{1-6} alkilsulfonilas, karbamilo, C_{1-6}alkilkarbamilo, di-C_{1-6}alkilkarbamilo, karboksi, C_{1-6}alkilkarbonilo arba C_{1-6}alkoksikarbonilo grupė;

kiekvienas R^4 yra nepriklausomai H arba C_{1-4} alkilas; arba

dvi R^4 grupės, kartu su anglies atomu, prie kurio jos yra prijungtos, sudaro 3-, 4-, 5- arba 6-narį cikloalkilo žiedą;

R^{4a} yra H arba C_{1-4} alkilas;

kiekvienas R^{4b} yra nepriklausomai H arba C_{1-4} alkilas; arba

dvi R^{4b} grupės, kartu su anglies atomu, prie kurio jos yra prijungtos, sudaro 3-, 4-, 5-, arba 6-narį cikloalkilo žiedą;

kiekvienas R^5 yra nepriklausomai halo, ciano, nitro, C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, halogensulfanilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10}cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{2-10}heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10}arilas, C_{6-10}aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas, C_{1-10}heteroaril-C_{1-3} alkilas, OR^a, SR^a, $C(O)R^b$, $C(O)NR^cR^d$, $C(O)OR^a$, $OC(O)R^b$, $OC(O)NR^cR^d$, NR^cR^d, $NR^cC(O)R^b$, $NR^cC(O)OR^a$, $NR^cC(O)NR^cR^d$, $C(=NR^e)R^b$, $C(=NR^e)NR^cR^d$, $NR^cC(=NR^e)NR^cR^d$, $NR^cS(O)R^b$, $NR^cS(O)2R^b$, $NR^cS(O)_2NR^cR^d$, $S(O)R^b$, $S(O)NR^cR^d$, $S(O)_2R^b$ arba $S(O)_2NR^cR^d$; kur C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10} cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{2-10}heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10}arilas, C_{6-10}aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas ir C_{1-10}heteroaril-C_{1-3} alkilas yra kiekvienas pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^6 grupėmis;

kiekvienas R^6 yra nepriklausomai halogenas, ciano, nitro, C_{1-6}alkilas, C_{2-6} alkenilas, C2-6 alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, halogensulfanilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10} cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{2-10}heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10}arilas, C_{6-10}aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas, C_{1-10}heteroaril-C_{1-3} alkilas, OR^{a1}, SR^{a1}, $C(O)R^{b1}$, $C(O)NR^{c1}R^{d1}$, $C(O)OR^{a1}$, $OC(O)R^{b1}$, $OC(O)NR^{c1}R^{d1}$, $C(=NR^{e1})NR^{c1}R^{d1}$, $NR^{c1}C(=NR^{e1})NR^{c1}R^{d1}$, $NR^{c1}R^{d1}$, $NR^{c1}C(O)R^{b1}$,$NR^{c1}C(O)OR^{a1}$, $NR^{c1}C(O)NR^{c1}R^{d1}$, $NR^{c1}S(O)R^{b1}$, $NR^{c1}S(O)_2R^{b1}$, $NR^{c1}S(O)_2NR^{c1}R^{d1}$, $S(O)R^{b1}$, $S(O)NR^{c1}R^{d1}$, $S(O)_2R^{b1}$, arba $S(O)_2NR^{c1}R^{d1}$; kur minėtas C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10}cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{2-10}heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10}arilas, C_{6-10}aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas ir C_{1-10}heteroaril-C_{1-3} alkilas yra kiekvienas pasirinktinai pakeisti 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^h grupėmis;

kiekvienas R^a, R^b, R^c ir R^d yra nepriklausomai H, C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10}cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{2-10} heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10}arilas, C_{6-10}aril-C_{1-3}alkilas, C_{1-10} heteroarilas arba C_{1-10} heteroaril-C_{1-3} alkilas; kur minėtas C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10}cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{2-10}heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10} arilas, C_{6-10} aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas ir C_{1-10} heteroaril-C_{1-3} alkilas yra pasirinktinai pakeisti 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^g grupėmis;

arba bet kurie R^c ir R^d kartu su N atomu, prie kurio jie yra prijungti, sudaro 3-, 4-, 5-, 6- arba 7-narę heterocikloalkilo grupę arba heteroarilo grupę, kiekvieną pasirinktinai pakeistą 1, 2, 3 arba 4 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš halogeno, ciano, nitro, hidroksilo, C_{1-6} alkilo, C_{2-6} alkenilo, C_{2-6} alkinilo, C_{3-7} cikloalkilo, C_{1-6} halogenalkilo, C_{1-6} alkoksi, C_{1-6} halogenalkoksi, amino, C_{1-6} alkilamino, di-C_{1-6} alkilamino, tio, C_{1-6} alkiltio, C_{1-6} alkilsulfinilo, C_{1-6} alkilsulfonilo, karbamilo, C_{1-6} alkilkarbamilo, di-C_{1-6} alkilkarbamilo, karboksi, C_{1-6} alkilkarbonilo ir C_{1-6} alkoksikarbonilo grupės;

kiekvienas Re yra nepriklausomai H, C_{1-6} alkilas, CN, hidroksilas, C_{1-6} alkoksi, C_{1-6} alkilsulfonilas, karboksi, C_{1-6} alkilkarbonilas, aminosulfonilas, C_{1-6} alkilaminosulfonilas, di-C_{1-6} alkilaminosulfonilas, karbamilo, C_{1-6} alkilkarbamilo arba di-C_{1-6} alkilkarbamilo grupė;

kiekvienas R^{a1}, R^{b1}, R^{c1} ir R^{d1} yra nepriklausomai H, C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10} cikloalkil-C_{1-3}alkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{2-10} heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10} arilas, C_{6-10} aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas arba C_{1-10} heteroaril-C_{1-3} alkilas; kur minėtas C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10} cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{2-10} heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10} arilas, C_{6-10} aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas ir C_{1-10} heteroaril-C_{1-3} alkilas yra pasirinktinai pakeisti 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis $R^{g'}$ grupėmis;

arba bet kurie R^{c1} ir R^{d1} kartu su N atomu, prie kurio jie yra prijungti, sudaro 3-, 4-, 5-, 6- arba 7-narę heterocikloalkilo grupę arba heteroarilo grupę, kiekvieną pasirinktinai pakeistą 1, 2, 3 arba 4 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš halogeno, ciano, nitro, hidroksilo, C_{1-6} alkilo, C_{2-6} alkenilo, C_{2-6} alkinilo, C_{3-7} cikloalkilo, C_{1-6} halogenalkilo, C_{1-6} alkoksi, C_{1-6} halogenalkoksi, amino, C_{1-6} alkilamino, di-C_{1-6} alkilamino, tio, C_{1-6} alkiltio, C_{1-6} alkilsulfinilo, C_{1-6} alkilsulfonilo, karbamilo, C_{1-6} alkilkarbamilo, di-C_{1-6} alkilkarbamilo, karboksi, C_{1-6}alkilkarbonilo, C_{1-6} alkoksikarbonilo ir C_{1-6} alkilkarbonilamino grupės;

kiekvienas R^{e1} yra nepriklausomai H, C_{1-6} alkilas, CN, hidroksilas, C_{1-6} alkoksi, C_{1-6} alkilsulfonilas, karboksi, C_{1-6} alkilkarbonilas, aminosulfonilas, C_{1-6} alkilaminosulfonilas, di-C_{1-6} alkilaminosulfonilas, karbamilo, C_{1-6} alkilkarbamilo arba di-C_{1-6} alkilkarbamilo grupė;

kiekvienas R^g, $R^{g'}$ ir R^h yra nepriklausomai halogenas, ciano, nitro, hidroksilas, C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6}

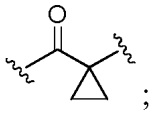
alkinilas, C_{3-7} cikloalkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{1-6} alkoksi, C_{1-6} halogenalkoksi, amino, C_{1-6} alkilamino, di-C_{1-6} alkilamino, tio, C_{1-6} alkiltio, C_{1-6} alkilsulfinilo, C_{1-6} alkilsulfonilo, karbamilo, C_{1-6} alkilkarbamilo, di-C_{1-6} alkilkarbamilo, karboksi, C_{1-6} alkilkarbonilo, C_{1-6} alkoksikarbonilo arba C_{1-6} alkilkarbonilamino grupė; ir
n yra 0, 1, 2, 3, arba 4.

3. Junginys pagal 1 arba 2 punktą arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur
a) X yra N; arba
b) X yra CR^2; arba
c) X yra C(H), C(F), arba C(CN); arba
d) X yra CH.

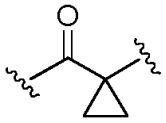
4. Junginys pagal bet kurį iš 1-3 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur
a) Y yra N; arba
b) Y yra CR^3; arba
c) Y yra CH.

5. Junginys pagal bet kurį iš 1-4 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur Z yra ciano grupė.

6. Junginys pagal bet kurį iš 1-5 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur
a) L yra C(=O)NH, C(=O), $S(=O)_2$, CH_2, $C(=O)CH_2$, arba


;

arba
b) L yra C(=O)NH, C(=O), $S(=O)_2$, CH_2, $C(=O)CH_2$,


,

arba C(=O)O.

7. Junginys pagal bet kurį iš 1-6 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur
a) n yra 0, 1, arba 2; arba
b) n yra 0.

8. Junginys pagal bet kurį iš 1-7 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur
a) R^1 yra C1-4 alkilas; arba
b) R^1 yra metilas; arba
c) dvi R^1 grupės sudaro 2-anglies tiltelį.

9. Junginys pagal bet kurį iš 1-8 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur
a) A yra C_{6-14} arilas, kuris yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4, 5, arba 6 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis; arba
b) A yra fenilas, kuris yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4, 5, arba 6 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis; arba
c) A yra monociklinis C_{3-9} cikloalkilas arba biciklinis C_{3-9} cikloalkilas, kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4, 5 arba 6 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis; arba
d) A yra monociklinis C_{2-10} heterocikloalkilas arba biciklinis C_{2-10} heterocikloalkilas, kiekvienas iš kurių pakeistas 1, 2, 3, 4, 5, arba 6 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis; arba
e) A yra monociklinis C_{1-10} heteroarilas arba biciklinis C_{1-10} heteroarilas, kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4, 5, arba 6 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis; arba
f) A yra C_{1-6} alkilas; arba
g) A yra C_{1-6} alkilas, fenilas, naftilo žiedas, monociklinis arba biciklinis C_{3-10} cikloalkilas, monociklinis arba biciklinis

C_{2-10} heterocikloalkilas, arba monociklinis arba biciklinis C_{1-10} heteroarilas; kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis; arba

h) A yra fenilas, naftilo žiedas, monociklinis C_{3-10} cikloalkilas, biciklinis C_{3-10} cikloalkilas, monociklinis C_{2-10} heterocikloalkilas, biciklinis C_{2-10} heterocikloalkilas, monociklinis C_{1-10} heteroarilas arba biciklinis C_{1-10} heteroarilas; kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4, arba 5 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis; arba

i) A yra metilas, etilas, izopropilas, fenilas, naftaleno žiedas, piridino žiedas, pirimidino žiedas, tiofeno žiedas, pirazino žiedas, oksazolo žiedas, izoksazolo žiedas, imidazolo žiedas, tiazolo žiedas, furano žiedas, pirazolo žiedas, chinolino žiedas, benzotiofeno žiedas, benzotiazolo žiedas, benzoimidazolo žiedas, benzofurano žiedas, ciklopropilo, ciklopentilo, cikloheksilo, cikloheptilo, indeno žiedas, tetrahidronaftaleno žiedas, dihidro-1,4-benzodioksoksino žiedas, arba piperidino žiedas; kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis, kaip leidžiama pagal valentingumus; arba

j) A yra fenilo arba piridino žiedas; kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, arba 4 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis; arba

k) A yra piridin-4-ilas; kuris yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3 arba 4 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis.

10. Junginys pagal bet kurį iš 1-9 punktų, arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur

a) kiekvienas R^5 yra nepriklausomai halogenas, ciano, C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{6-10} arilas, C_{1-10} heteroarilas, OR^a, SR^a, $C(O)OR^a$, NR^cR^d, $NR^cC(O)R^b$; kur minėtas C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{6-10} arilas ir C_{1-10} heteroarilas are kiekvienas pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^6 grupėmis; arba

b) kiekvienas R^5 yra nepriklausomai chloras, fluoras, bromas, ciano, metilas, etilas, trifluormetilas, hidroksilas, metoksi, trifluormetoksi, difluormetoksi, fenoksi, dimetilamino, t-butilkarbonilamino, metoksikarbonilo, metiltio grupė, fenilas, piridino žiedas, tiazolo žiedas, chinolino žiedas, izochinolino žiedas, imidazo[1,2-a]pirimidino žiedas, benzoksazolo žiedas, arba oksadiazolo žiedas; kur minėtas fenilas, piridino žiedas, tiazolo žiedas, chinolino žiedas, izochinolino žiedas, imidazo[1,2-a]pirimidino žiedas, benzoksazolo žiedas ir oksadiazolo žiedas yra kiekvienas pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^6 grupėmis; arba

c) kiekvienas R^5 yra nepriklausomai halogenas, ciano, C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{6-10} arilas, C_{1-10} heteroarilas, OR^a, SR^a, $C(O)OR^a$, NR^cR^d, arba $NR^cC(O)R^b$; kur minėtas C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{6-10} arilas ir C_{1-10} heteroarilas yra kiekvienas pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^6 grupėmis;

kiekvienas R^a, R^b, R^c, ir R^d yra nepriklausomai H, C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas arba C_{6-10} arilas; kur minėtas C_{1-6} alkilas ir C_{6-10} arilas yra pasirinktinai pakeisti 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^g grupėmis;

kiekvienas R^6 yra nepriklausomai halogenas, ciano, C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, OR^{a1}, $NR^{c1}R^{d1}$ arba $OC(O)R^{b1}$; ir

kiekvienas R^{a1}, R^{b1}, R^{c1}, and R^{d1} yra nepriklausomai H arba C_{1-6} alkilas; kur minėtas C_{1-6} alkilas yra pasirinktinai pakeistas pakaitu, nepriklausomai parinktu iš C_{1-4} alkoksi and hidroksi grupių;

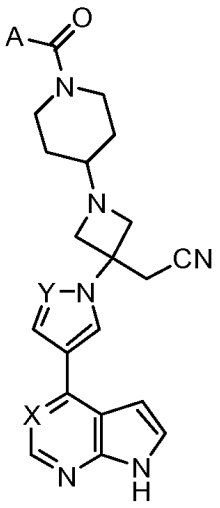
arba bet kuris iš R^{c1} ir R^{d1} kartu su N atomu, prie kurio jie yra prijungti, sudaro 4-, 5-, 6- arba 7-narę heterocikloalkilo grupę, pasirinktinai pakeistą 1, 2, 3 arba 4 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš halogeno; arba

d) kiekvienas R^5 yra nepriklausomai halogenas arba C_{1-6} halogenalkilas; arba

e) kiekvienas R^5 yra nepriklausomai fluoras arba trifluormetilas.

11. Junginys pagal bet kurį iš 1-4 ir 9-10 punktų, turintis

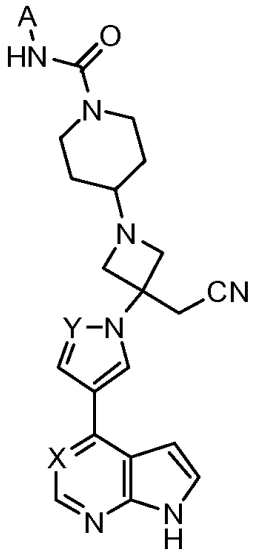
a) formulę (II):



II

arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska; arba

b) formulę (III):



III

arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

12. Junginys pagal 1 arba 2 punktą arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur:

a) X yra N arba CR^2;

Y yra N arba CR^3;

kiekvienas R^1 yra nepriklausomai C_{1-4} alkilas; arba

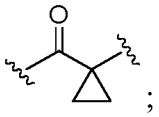
dvi R^1 grupės sudaro 2-anglies tiltelį;

R^2 yra H, halogenas, arba ciano;

R^3 yra H;

Z yra ciano;

L yra C(=O)NH, C(=O), $S(=O)_2$, CH_2, $C(=O)CH_2$, arba



;

A yra C_{1-6} alkilas, fenilas, naftilo žiedas, monociklinis C_{3-10} cikloalkilas, biciklinis C_{3-10} cikloalkilas, monociklinis C_{2-10} heterocikloalkilas, biciklinis C_{2-10} heterocikloalkilas, monociklinis C_{1-10} heteroarilas arba biciklinis C_{1-10} heteroarilas; kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis;

kiekvienas R^5 yra nepriklausomai halogenas, ciano, C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10} cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{2-10} heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10} arilas, C_{6-10} aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas, C_{1-10} heteroaril-C_{1-3} alkilas, OR^a, SR^a, $C(O)R^b$, $C(O)NR^cR^d$, $C(O)OR^a$, $OC(O)R^b$, $OC(O)NR^cR^d$, NR^cR^d, $NR^cC(O)R^b$, $NR^cC(O)OR^a$, $NR^cC(O)NR^cR^d$, $NR^cS(O)R^b$, $NR^cS(O)_2R^b$, $NR^cS(O)_2NR^cR^d$, $S(O)R^b$, $S(O)NR^cR^d$, $S(O)_2R^b$, arba $S(O)_2NR^cR^d$; kur C_{1-6} alkilas, C_{2-6} alkenilas, C_{2-6} alkinilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{3-10} cikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{2-10} heterocikloalkil-C_{1-3} alkilas, C_{6-10} arilas, C_{6-10} aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas ir C_{1-10} heteroaril-C_{1-3} alkilas yra kiekvienas pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^6 grupėmis; ir

n yra 0, 1, arba 2; arba

b) X yra N arba CR^2;

Y yra N arba CR^3;

kiekvienas R^1 yra nepriklausomai C_{1-4} alkilas; arba

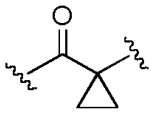
dvi R^1 grupės sudaro 2-anglies tiltelį.

R^2 yra H, halogenas arba ciano;

R^3 yra H;

Z yra ciano;

L yra C(=O)NH, C(=O), $S(=O)_2$, CH_2, $C(=O)CH_2$, arba



;

A yra C_{1-6} alkilas, fenilas, naftilo žiedas, monociklinis C_{3-10} cikloalkilas, biciklinis C_{3-10} cikloalkilas, monociklinis C_{2-10} heterocikloalkilas, biciklinis C_{2-10} heterocikloalkilas, monociklinis C_{1-10} heteroarilas arba biciklinis C_{1-10} heteroarilas; kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4, arba 5 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis;

kiekvienas R^5 yra nepriklausomai halogenas, ciano, C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{6-10} arilas, C_{6-10} aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas, OR^a, SR^a, $C(O)R^b$, $C(O)NR^cR^d$, $C(O)OR^a$, $OC(O)R^b$, $OC(O)NR^cR^d$, NR^cR^d, $NR^cC(O)R^b$, $NR^cC(O)OR^a$, $NR^cC(O)NR^cR^d$, $NR^cS(O)_2R^b$, $NR^cS(O)_2NR^cR^d$, $S(O)_2R^b$, arba $S(O)_2NR^cR^d$;

kur C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10}cikloalkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{6-10} arilas, C_{6-10} aril-C_{1-3} alkilas ir C_{1-10} heteroarilas are kiekvienas pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4, arba 5 nepriklausomai parinktomis R^6 grupėmis; ir

n yra 0, 1, arba 2; arba

c) X yra N arba CR^2;

Y yra N arba CR^3;

kiekvienas R^1 yra nepriklausomai C_{1-4} alkilas; arba

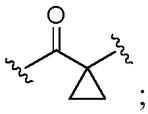
dvi R^1 grupės sudaro 2-anglies tiltelį;

R^2 yra H, halogenas, arba ciano;

R^3 yra H;

Z yra ciano;

L yra C(=O)NH, C(=O), $S(=O)_2$, CH_2, $C(=O)CH_2$, arba



;

A yra fenilas, naftilo žiedas, monociklinis C_{3-10} cikloalkilas, biciklinis C_{3-10} cikloalkilas, monociklinis C_{2-10} heterocikloalkilas, biciklinis C_{2-10} heterocikloalkilas, monociklinis C_{1-10} heteroarilas arba biciklinis C_{1-10} heteroarilas; kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4, arba 5 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis;

kiekvienas R^5 yra nepriklausomai halogenas, ciano, C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{6-10} arilas, C_{6-10} aril-C_{1-3} alkilas, C_{1-10} heteroarilas, OR^a, SR^a, $C(O)R^b$, $C(O)NR^cR^d$, $C(O)OR^a$, $OC(O)R^b$, $OC(O)NR^cR^d$, NR^cR^d, $NR^cC(O)R^b$, $NR^cC(O)OR^a$, $NR^cC(O)NR^cR^d$, $NR^cS(O)_2R^b$, $NR^cS(O)_2NR^cR^d$, $S(O)_2R^b$ arba $S(O)_2NR^cR^d$;

kur C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{3-10} cikloalkilas, C_{2-10} heterocikloalkilas, C_{6-10} arilas, C_{6-10} aril-C_{1-3} alkilas ir C_{1-10} heteroarilas yra kiekvienas pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4, arba 5 nepriklausomai parinktomis R^6 grupėmis; ir

n yra 0, 1, arba 2; arba

d) X yra N arba CR^2;

Y yra N arba CR^3;

kiekvienas R^1 yra nepriklausomai C_{1-4} alkilas; arba

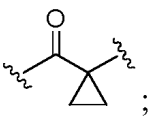
dvi R^1 grupės sudaro 2-anglies tiltelį;

R^2 yra H, halogenas arba ciano;

R^3 yra H;

Z yra ciano;

L yra C(=O)NH, C(=O), $S(=O)_2$, CH_2, $C(=O)CH_2$, arba



;

A yra C_{1-6} alkilas, fenilas, naftilo žiedas, monociklinis C_{3-10} cikloalkilas, biciklinis C_{3-10} cikloalkilas, monociklinis C_{2-10} heterocikloalkilas, biciklinis C_{2-10} heterocikloalkilas, monociklinis C_{1-10} heteroarilas arba biciklinis C_{1-10} heteroarilas;

kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis;

kiekvienas R^5 yra nepriklausomai halogenas, ciano, C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{6-10} arilas, C_{1-10} heteroarilas, OR^a, SR^a, $C(O)OR^a$, NR^cR^d, $NR^cC(O)R^b$; kur minėtas C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{6-10} arilas ir C_{1-10} heteroarilas yra kiekvienas pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^6 grupėmis;

ir

n yra 0, 1, arba 2; arba

e) X yra N arba CR^2;

Y yra N arba CR^3;

kiekvienas R^1 yra nepriklausomai C_{1-4} alkilas; arba

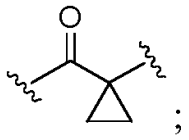
dvi R^1 grupės sudaro 2-anglies tiltelį;

R^2 yra H, halogenas arba ciano;

R^3 yra H;

Z yra ciano;

L yra C(=O)NH, C(=O), $S(=O)_2$, CH_2, $C(=O)CH_2$, arba



;

A yra fenilas, naftilo žiedas, monociklinis C_{3-10} cikloalkilas, biciklinis C_{3-10} cikloalkilas, monociklic C_{2-10} heterocikloalkilas, biciklinis C_{2-10} heterocikloalkilas, monociklinis C_{1-10} heteroarilas arba biciklinis C_{1-10} heteroarilas; kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4, arba 5 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis;

kiekvienas R^5 yra nepriklausomai halogenas, ciano, C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{6-10} arilas, C_{1-10} heteroarilas, OR^a, SR^a, $C(O)OR^a$, NR^cR^d, $NR^cC(O)R^b$; kur minėtas C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{6-10} arilas ir C_{1-10} heteroarilas yra kiekvienas pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4, arba 5 nepriklausomai parinktomis R^6 grupėmis;

ir

n yra 0, 1, arba 2; arba

f) X yra N arba CR^2;

Y yra N arba CR^3;

kiekvienas R^1 yra nepriklausomai metilas; arba

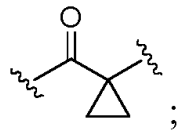
dvi R^1 grupės sudaro 2-anglies tiltelį;

R^2 yra H, halogenas arba ciano;

R^3 yra H;

Z yra ciano;

L yra C(=O)NH, C(=O), $S(=O)_2$, CH_2, $C(=O)CH_2$, arba



;

A yra metilas, etilas, izopropilas, fenilas, naftaleno žiedas, piridino žiedas, pirimidino žiedas, tiofeno žiedas, pirazino žiedas, oksazolo žiedas, izoksazolo žiedas, imidazolo žiedas, tiazolo žiedas, furano žiedas, pirazolo žiedas, chinolino žiedas, benzotiofeno žiedas, benzotiazolo žiedas, benzoimidazolo žiedas, benzofurano žiedas, ciklopropilas, ciklopentilas, cikloheksilas, cikloheptilas, indeno žiedas, tetrahidronaftaleno žiedas, dihidro-1,4-benzodioksoksino žiedas, arba piperidino žiedas; kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4, 5, arba 6 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis, kaip numatyta pagal valentingumą;

kiekvienas R^5 yra nepriklausomai chloras, fluoras, bromas, ciano, metilas, etilas, trifluormetilas, hidroksilas, metoksi, trifluormetoksi, difluormetoksi, fenoksi, dimetilamino, t-butilkarbonilamino, metoksikarbonilo, metiltio, fenilo grupė, piridino žiedas, tiazolo žiedas, chinolino žiedas, izochinolino žiedas, imidazo[1,2-a]pirimidino žiedas, benzoksazolo žiedas, arba oksadiazolo žiedas; kur minėtas fenilas, piridino žiedas, tiazolo žiedas, chinolino žiedas, izochinolino žiedas, imidazo[1,2-a]pirimidino žiedas, benzoksazolo žiedas ir oksadiazolo žiedas yra kiekvienas pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4, arba 5 nepriklausomai parinktomis R^6 grupėmis; ir

n yra 0, 1 arba 2; arba

g) X yra N arba CR^2;

Y yra N arba CR^3;

kiekvienas R^1 yra nepriklausomai metilas; arba

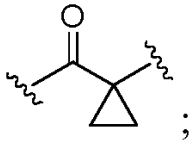
dvi R^1 grupės sudaro 2-anglies tiltelį;

R^2 yra H, halogenas, arba ciano;

R^3 yra H;

Z yra ciano;

L yra C(=O)NH, C(=O), $S(=O)_2$, CH_2, $C(=O)CH_2$, arba



;

A yra fenilas, naftaleno žiedas, piridino žiedas, pirimidino žiedas, tiofeno žiedas, pirazino žiedas, oksazolo žiedas, izoksazolo žiedas, imidazolo žiedas, tiazolo žiedas, furano žiedas, pirazolo žiedas, chinolino žiedas, benzotiofeno žiedas, benzotiazolo žiedas, benzoimidazolo žiedas, benzofurano žiedas, ciklopropilas, ciklopentilas, cikloheksilas, cikloheptilas, indeno žiedas, tetrahidronaftaleno žiedas, dihidro-1,4-benzodioksoksino žiedas, arba piperidino žiedas; kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4, 5 arba 6 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis;

kiekvienas R^5 yra nepriklausomai chloras, fluoras, bromas, ciano, metilas, etilas, trifluormetilas, hidroksilas, metoksi, trifluormetoksi, difluormetoksi, fenoksi, dimetilamino, t-butilkarbonilamino, metoksikarbonilo, metiltio grupė, fenilas, piridino žiedas, tiazolo žiedas, chinolino žiedas, izochinolino žiedas, imidazo[1,2-a]pirimidino žiedas, benzoksazolo žiedas, arba oksadiazolo žiedas; kur minėtas fenilas, piridino žiedas, tiazolo žiedas, chinolino žiedas, izochinolino žiedas, imidazo[1,2-a]pirimidino žiedas, benzoksazolo žiedas ir oksadiazolo žiedas yra kiekvienas pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^6 grupėmis; ir

n yra 0, 1, arba 2; arba

h) X yra N arba CR^2;

Y yra N arba CR^3;

kiekvienas R^1 yra nepriklausomai C_{1-4} alkilas; arba

dvi R^1 grupės sudaro 2-anglies tiltelį;

R^2 yra H, halogenas arba ciano;

R^3 yra H;

Z yra ciano;

L yra $S(=O)_2$;

A yra C1-6 alkilas; ir

n yra 0, 1 arba 2; arba

i) X yra N arba CH;

Y yra N;

Z yra ciano;

L yra C(=O) arba C(=O)NH;

A yra fenilas arba piridino žiedas, kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, arba 4 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis;

kiekvienas R^5 yra nepriklausomai halogenas arba C_{1-6} halogenalkilas; ir n yra 0; arba

j) X yra N arba CH;

Y yra N;

Z yra ciano;

L yra C(=O) arba C(=O)NH;

A yra fenilas arba piridin-4-ilas, kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1 arba 2 nepriklausomai parinktomis R^5 grupėmis;

kiekvienas R^5 yra nepriklausomai fluoras arba trifluormetilas; ir n yra 0; arba

k) X yra N arba CR^2;

Y yra N arba CR^3;

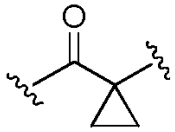
kiekvienas R^1 yra nepriklausomai C_{1-4} alkilas, hidroksilas, C_{1-4} alkoksi arba fluoras; dvi R^1 grupės kartu sudaro 2- arba 3-anglies tiltelį arba tiltelį, kurio formulė $-CH_2-O-CH_2-$;

R^2 yra H, halogenas arba ciano;

R^3 yra H;

Z yra ciano;

L yra C(=O)NH, C(=O), $S(=O)_2$, CH_2, $C(=O)CH_2$,



C(=O)O, arba $C(=O)OCH_2$;

A yra C_{1-6} alkilas, fenilas, naftilo žiedas, monociklinis C_{3-10} cikloalkilas, biciklinis C_{3-10} cikloalkilas, monociklinis C_{2-10} heterocikloalkilas, biciklinis C_{2-10} heterocikloalkilas, monociklinis C_{1-10} heteroarilas arba biciklinis C_{1-10} heteroarilas; kiekvienas iš kurių yra pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4, arba 5 nepriklausomai parinktomis R5 grupėmis;

kiekvienas R^5 yra nepriklausomai halogenas, ciano, C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{6-10} arilas, C_{1-10} heteroarilas, OR^a, SR^a, $C(O)OR^a$, NR^cR^d, $NR^cC(O)R^b$; kur minėtas C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, C_{6-10} arilas ir C_{1-10} heteroarilas yra kiekvienas pasirinktinai pakeistas 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^6 grupėmis;

n yra 0, 1, arba 2;

kiekvienas R^a, R^b, R^c, and R^d yra nepriklausomai H, C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas arba C_{6-10} arilas; kur minėtas C_{1-6} alkilas ir C_{6-10} arilas yra pasirinktinai pakeisti 1, 2, 3, 4 arba 5 nepriklausomai parinktomis R^g grupėmis;

kiekvienas R^6 yra nepriklausomai halogenas, ciano, C_{1-6} alkilas, C_{1-6} halogenalkilas, OR^{a1}, $NR^{c1}R^{a1}$ arba $OC(O)R^{b1}$; ir

kiekvienas R^{a1}, R^{b1}, R^{c1} ir R^{d1} yra nepriklausomai H arba C_{1-6} alkilas; kur minėtas C_{1-6} alkilas yra pasirinktinai pakeistas pakaitu, nepriklausomai parinktu iš C_{1-4} alkoksi ir hidroksilo;

arba bet kuris R^{c1} ir R^{d1} kartu su N atomu, prie kurio jie yra prijungti, sudaro 4-, 5-, 6- arba 7-narę heterocikloalkilo grupę, pasirinktinai pakeistą 1, 2, 3 arba 4 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš halogeno.

13. Junginys pagal 1 punktą, kur

a) junginys yra parinktas iš:

{1-{1-[3-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1Hpirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-chinolin-6-ilbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3,5-difluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-[1-(3,4,5-trifluorbenzoil)piperidin-4-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-metoksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-hidroksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[2-fluor-3-(trifluormetil)benzoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(cikloheksilkarbonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-benzoylpiperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

2-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil] benzonitrilo;

3-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil] benzonitrilo;

4-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil] benzonitrilo;

{1-{1-[(6-chlorpiridin-2-il)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(pirazin-2-lkarbonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-l}acetonitrilo;

{3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-[1-(3-tienilkarbonil)piperidin-4-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(1,3-oksazol-2-ilkarbonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-(1-{[2-metil-5-(trifluormetil)-1,3-oksazol-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

3-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-5-fluorbenzonitrilo;

{1-[1-(3-chlorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(3-brombenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

(3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-{1-[3-(trifluormetoksi)benzoil]piperidin-4-il}azetidin-3-il) acetonitrilo;

(3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-{1-[3-(trifluormetil)benzoil]piperidin-4-il}azetidin-3-il) acetonitrilo;

{1-{1-[3-fluor-5-(trifluormetil)benzoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3,5-dichlorobenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(4-fluor-3-metoksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(2-fluor-5-metoksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-chlor-5-fluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(3-brom-5-fluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[(2,5-dichlor-3-tienil)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-metoksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-[1-(2,4,5-trifluor-3-metoksibenzoil)piperidin-4-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3,5-dimetoksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(3-chloro-4-fluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3,4-difluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-5-metoksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(2-chlor-6-metoksiizonikotinoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(5-fluor-2-metoksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(2-fluor-6-metoksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(4-fluor-2-metoksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(2,3-difluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(2,4-difluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il])-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(2,5-difluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(2,6-difluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[2-fluor-6-(trifluormetil)benzoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-[1-(2,3,4-trifluorbenzoil)piperidin-4-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-[1-(2,3,6-trifluorbenzoil)piperidin-4-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-[1-(2,4,5-trifluorbenzoil)piperidin-4-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-[1-(2,4,6-trifluorbenzoil)piperidin-4-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(3,5-dibromo-4-metoksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

3-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-6-(dimetilamino)-2-fluorbenzonitrilo;

{1-{1-[3-fluor-4-(trifluormetil)benzoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-(1-{[4-chloro-6-(trifluormetil)piridin-2-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il] azetidin-3-il}acetonitrilo;

{3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-[1-(2,3,4,5-tetrafluorbenzoil)piperidin-4-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

5-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-2-metoksibenzonitrilo;

{3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-[1-(2,3,5,6-tetrafluorbenzoil)piperidin-4-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

(3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-{1-[2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il}azetidin-3-il) acetonitrilo;

{1-[1-(4-fluor-3-hidroksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

5-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-2-(dimetilamino)benzonitrilo;

{1-{1-[4-(dimetilamino)-2,3,5,6-tetrafluorbenzoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il] azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(3,5-difluorizonikotinoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[3-fluor-4-(metiltio)benzoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(4-chlor-3-fluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-metilbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(2,5-dimetil-3-furoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

4-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-2-fluorbenzonitrilo;

{1-[1-(2-fluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(4-fluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilas;

{1-[1-(2-tienilkarbonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[3-metoksi-5-(trifluormetil)-2-tienilkarbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il] azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-1-[3-hidroksi-5-(trifluormetil)-2-tienilkarbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il] azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[(4-metoksi-3-tienil)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[(5-metil-3-tienil)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[(5-chloro-4-metoksi-3-tienil)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1Hpirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[(2-brom-3-tienil)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[(3-chlor-2-tienil)karbonil]piperidin-4-il}-3-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[(5-chlor-2-tienil)karbonil]piperidin-4-il}-3-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{-[(3-metil-2-tienil)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[(4-metil-2-tienil)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[(5-metil-2-tienil)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[(3-metoksi-2-tienil)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[2-fluor-4-(trifluormetil)benzoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

4-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-3,5-difluorbenzonitrilo;

{1-[1-(3-chlor-4-hidroksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

[3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1-{[2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)azetidin-3-il]acetonitrilo;

[3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1-{[6-(trifluormetil)pirazin-2-il]karbonil}piperidin-4-il)azetidin-3-il]acetonitrilo;

{1-[1-(1-naphthoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-[1-(chinolin-3-ilkarbonil)piperidin-4-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-[1-(chinolin-6-ilkarbonil)piperidin-4-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(1-benzotien-2-ilkarbonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[(3-chlor-6-fluor-1-benzotien-2-il)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il] azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[(3-chloro-4-fluor-1-benzotien-2-il)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il] azetidin-3-il}acetonitrilo;

[3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1-{[4-(trifluormetil)-1-benzotien-2-il]karbonil}piperidin-4-il) azetidin-3-il]acetonitrilo;

[3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1-{[6-(trifluormetil)-1-benzotien-2-il]karbonil}piperidin-4-il) azetidin-3-il]acetonitrilo;

[3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1-{[7-(trifluormetil)-1-benzotien-2-il]karbonil}piperidin-4-il) azetidin-3-il]acetonitrilo;

{1-[1-(1-benzotien-3-ilkarbonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-[1-(1,2,3,4-tetrahidronaphthalen-2-ilkarbonil)piperidin-4-il] azetidin-3-il}acetonitrilo;

[3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1-{[4-(trifluormetil)cikloheksil]karbonil}piperidin-4-il)azetidin-3-il]acetonitrilo;

{1-[1-(2,3-dihidro-1H-inden-2-ilkarbonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[(4,4-difluorcikloheksil)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(ciklopentilkarbonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(cikloheptilkarbonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[(3-metoksicikloheksil)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[(4-fenilcikloheksil)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-(1-{[4-(4-chlorfenil)cikloheksil]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1Hpirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

6-{4-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil] piperidin-1-il}nikotinonitrilo;

{1-(1-{[[1-(5-chlor-3-fluorpiridin-2-il)piperidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

2-{4-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil] piperidin-1-il}-6-metilnikotinonitrilo;

{1-[1-(fenilacetil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[(1-fenilciklopropil)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-(1-{[1-(4-chlorofenil)ciklopropil]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1Hpirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[(2,6-dichlorofenil)acetil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(mesitylacetil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(bifenil-4-ilkarbonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-izochinolin-6-ilbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(2,6-difluor-4-piridin-3-ilbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-piridin-4-ilbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

4'-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-2'-fluorbifenil-4-karbonitrilo;

4'-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-2',3-difluorbifenil-4-karbonitrilo

{1-[1-(2-fluor-4-piridin-3-ilbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[4-fluor-3-(1,3-tiazol-2-il)benzoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[3-fluor-4-(1,3-tiazol-2-il)benzoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-piridin-3-ilbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

4'-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-2'-fluorbifenil-2-karbonitrilo;

4'-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-2'-fluorbifenil-3-karbonitrilo;

4'-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]bifenil-4-karbonitrilo;

(3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-{1-[(2,3',4'-trifluorbifenil-4-il)karbonil]piperidin-4-il}azetidin-3-il) acetonitrilo;

4'-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-2',5-difluorbifenil-3-karbonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-chinolin-5-ilbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-izochinolin-5-ilbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-izochinolin-8-ilbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-chinolin-8-ilbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-izochinolin-7-ilbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-chinolin-7-ilbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-imidazo[1,2-a]piridin-6-ilbenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il] azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[4-(1,3-benzoksazo1-2-il)benzoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[4-(1,3-benzoksazol-2-il)-3-fluorbenzoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1Hpirazol-1-il] azetidin-3-il}acetonitrilo;

3-[(3-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il) karbonil]-5-fluorbenzonitrilo;

{1-[8-(3,4-difluorbenzoil)-8-azabiciklo[3.2.1]okt-3-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

4-[(3-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il) karbonil]-2-fluorbenzonitrilo;

{1-[8-(4-chlor-3-fluorbenzoil)-8-azabiciklo[3.2.1]okt-3-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1Hpirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{8-[3-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]-8-azabiciklo[3.2.1]okt-3-il{-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

[3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(8-{[6-(trifluormetil)piridin-3-il]karbonil}-8-azabiciklo[3.2.1]okt-3-il)azetidin-3-il]acetonitrilo;

(3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-{8-[2-(trifluormetil)izonikotinoil]-8-azabiciklo[3.2.1]okt-3-il} azetidin-3-il)acetonitrilo;

{1-[8-(ciklopentilkarbonil)-8-azabiciklo[3.2.1]okt-3-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-[8-(tetrahidro-2H-piran-4-ilkarbonil)-8-azabiciklo[3.2.1]okt-3-il] azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[8-(cikloheksilkarbonil)-8-azabiciklo[3.2.1]okt-3-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{8-[(4,4-difluorcikloheksil)karbonil]-8-azabiciklo[3.2.1]okt-3-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il] azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluorbenzoil)-2-metilpiperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluorbenzoil)-2-metilpiperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-1-[(4,4-difluorcikloheksil)karbonil]-2-metilpiperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1Hpirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluorbenzoil)-4-metilpiperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(cikloheksilkarbonil)-4-metilpiperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[4-fluor-2-(trifluormetil)fenil] piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[3-(trifluormetil)piridin-4-il] piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2,6-difluorfenil)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[2-(trifluormetil)fenil]piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[2-(trifluormetoksi)fenil]piperidin-1-karboksamido;

N-(4-bromo-3-tienil)-4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2,6-dichlorofenil)piperidin-1-karboksamido;

N-(2-chloro-6-metilfenil)-4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

N-(2-chloro-4-fluorfenil)-4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

N-(2-chlorofenil)-4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[2-(difluormetoksi)fenil]piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[4-(trifluormetil)piridin-3-il] piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[3-(trifluormetil)fenil]piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[4-(trifluormetil)fenil]piperidin-1-karboksamido;

N-(5-chloro-2-metilfenil)-4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2-fluorfenil)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[2-fluor-3-(trifluormetil)fenil] piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2,4-difluorfenil)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2,3,4-trifluorfenil)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2,3,5-trifluorfenil)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2,5-difluorfenil)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(3,5-difluorfenil)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(3,4-difluorfenil)piperidin-1-karboksamido;

N-(3-chloro-2-fluorfenil)-4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

N-(4-chloro-2-fluorfenil)-4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-3-tienilpiperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2-metoksifenil)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(3-metoksifenil)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[4-(trifluormetoksi)fenil]piperidin-l-karboksamido;

N-(3-chlorofenil)-4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

N-(4-chlorfenil)-4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2-metilfenil)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2,5-dimetoksifenil)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(4-fluor-2-metilfenil)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[6-(trifluormetil)piridin-2-il] piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2,6-dimetilpiridin-3-il)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-1,3-tiazol-2-ilpiperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(4-metil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(4,5-dimetil-1,3-tiazol-2-il) piperidin-1-karboksamido;

N-1,3-benzotiazol-2-il-4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(1-metil-1Hbenzimidazol-2-il) piperidin-1-karboksamido;

N-[4-(4-chlorfenil)-1,3-tiazol-2-il]-4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il} piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(-etil-1Hpirazol-5-il)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il) piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2-metilpiridin-3-il)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(6-fluor-2-metilpiridin-3-il) piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2-fluor-6-metilpiridin-3-il) piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[3-(trifluormetil)piridin-2-il] piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(3-fluorpiridin-2-il)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(3,5-difluorpiridin-2-il)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2-metoksipiridin-3-il)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[2-metil-6-(trifluormetil)piridin-3-il] piperidin-1-karboksamido;

metil 2-{[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil] aminobenzoato;

metil 2-{[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil] amino}-5-fluorbenzoato;

metil 4-{[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil] amino}-3-fluorbenzoato;

3-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)metil]-6-(dimetilamino)-2-fluorbenzonitrilo;

{1-[1-(3,5-dichlorobenzil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-1-[2-chlor-5-(trifluormetil)benzil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[2-fluor-3-(trifluormetil)benzil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[2-fluor-6-(trifluormetil)benzil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[(2-chlorchinolin-3-il)metil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3,5-difluorbenzil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[2-fluor-4-(trifluormetil)benzil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(2,4-difluorbenzil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(2-fluor-6-metoksibenzil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(2,3-dichlorobenzil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

5-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)metil]-2-fluorbenzonitrilo;

{1-{1-[4-(1,2,3-oksadiazol-4-il)benzil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

2-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)metil]benzonitrilo;

3-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)metil]benzonitrilo;

6-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)metil]-2-metoksinikotinonitrilo;

{1-{1-[(2,6-dibrompiridin-4-il)metil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{-[(2-brompiridin-4-il)metil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(2-chloro-6-fluorbenzil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(3-chloro-2,6-difluorbenzil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

4-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)metil]-2-fluorbenzonitrilo;

{1-{1-[(5-metil-3-fenilisoksazol-4-il)metil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1Hpirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-(1-{[3-fluor-2-(trifluormetil)piridin-4-il]metil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il] azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(1-bcnzofuran-2-ilmetil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-fenoksibenzil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(2,3-dihidro-1,4-benzodioksin-6-ilmetil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1Hpirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

N-{4-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)metil]piridin-2-il}-2,2-dimetilpropanamido;

{1-{11-[3-chlor-2-fluor-6-(trifluormetil)benzil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[(3,5-dichlorpiridin-4-il)metil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{-[(2-chlor-6-metoksichinolin-3-il)metil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1Hpirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(2-chlor-3,4-dimetoksibenzil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

3-[(3-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)metil]-6-(dimetilamino)-2-fluorbenzonitrilo;

{1-[8-(2-chlor-3,6-difluorbenzil)-8-azabiciklo[3.2.1]okt-3-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1Hpirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

3-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-2-metilpiperidin-1-il)metil]-6-(dimetilamino)-2-fluorbenzonitrilo;

3-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-2-metilpiperidin-1-il)metil]-6-(dimetilamino)-2-fluorbenzonitrilo;

{1-[1-(2-chlor-6-fluorbenzil)-2-metilpiperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(2-chlor-6-fluorbenzil)-2-metilpiperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[(1-metil-1H-pirazol-5-il)sulfonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

2-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)sulfonil]benzonitrilo;

3-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)sulfonil]benzonitrilo;

4-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)sulfonil]benzonitrilo;

5-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)sulfonil]-2-(dimetilamino)benzonitrilo;

{1-{1-[(1-metil-1H-pirazol-3-il)sulfonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(cikloheksilsulfonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(ciklopentilsulfonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(metilsulfonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(etilsulfonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(ciklopropilsulfonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(izopropilsulfonil)piperidin-4-il]-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{-[(1-metil-1H-imidazol-4-il)sulfonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[(1,2-dimetil-1H-imidazol-4-il)sulfonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1Hpirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[(3,5-dimetilisoksazol-4-il)sulfonil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[3-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il}-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

3-[(4-{3-(cianometil)-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]benzonitrilo;

3-[(4-{3-(cianometil)-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-5-fluorbenzonitrilo;

4-[(4-{3-(cianometil)-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-3-fluorbenzonitrilo;

4-[(4-{3-(cianometil)-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-3,5-difluorbenzonitrilo;

{1-{1-[5-fluor-2-(trifluormetil)benzoil]piperidin-4-il}-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[3-fluor-4-(trifluormetil)benzoil]piperidin-4-il}-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

(3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]-1-{1-[3-(trifluormetil)benzoil]piperidin-4-il}azetidin-3-il)acetonitrilo;

{1-{1-[2-fluor-5-(trifluormetoksi)benzoil]piperidin-4-il}-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]-1-[1-(2,3,6-trifluorbenzoil)piperidin-4-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]-1-[1-(2-tienilkarbonil)piperidin-4-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[2-fluor-4-(trifluormetil)benzoil]piperidin-4-il}-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[2-fluor-5-(trifluormetil)benzoil]piperidin-4-il}-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[3-fluor-5-(trifluormetil)benzoil]piperidin-4-il}-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[4-fluor-3-(trifluormetil)benzoil]piperidin-4-il}-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(2,3-difluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(3,4-difluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(2,5-difluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-[1-(2,6-difluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]-1-[1-(2,3,4-trifluorbenzoil)piperidin-4-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[2-fluor-3-(trifluormetoksi)benzoil]piperidin-4-il}-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[4-hidroksi-3-(trifluormetil)benzoil]piperidin-4-il}-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

4-{3-(cianometil)-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-1-il}-N-[4-fluor-2-(trifluormetil)fenil] piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2-metoksipiridin-3-il)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-1-il}-N-[2-metil-6-(trifluormetil)piridin-3-il] piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2,4-difluorfenil)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2-cianofenil)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2-metoksifenil)piperidin-1-karboksamido;

N-(2-chloro-4-fluorfenil)-4-{3-(cianometil)-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-1-il}-N-[3-(trifluormetil)piridin-2-il]piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-1-il}-N-[4-(trifluormetil)piridin-3-il]piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-1-il}-N-(3-fluorpiridin-2-il)piperidin-1-karboksamido;

N-(4-chloro-2-cianofenil)-4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

{1-{1-[3-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

4-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-3-fluorbenzonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-hidroksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(2-fluor-4-hidroksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-{1-[5-chlor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

[3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1{[2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)azetidin-3-il] acetonitrilo;

[3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1{[6-(trifluormetil)pirazin-2-il]karbonil}piperidin-4-il)azetidin-3-il] acetonitrilo;

[3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1{[5-(trifluormetil)pirazin-2-il]karbonil}piperidin-4-il)azetidin-3-il] acetonitrilo;

{1-{{1-[(4,4-difluorcikloheksil)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[4-fluor-2-(trifluormetil)fenil] piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2,4-difluorfenil)piperidin-1-karboksamido;

N-(2-chloro-4-fluorfenil)-4-{3-(cianometil)-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2-metoksipiridin-3-il)piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[3-(trifluormetil)piridin-4-il]piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[4-(trifluormetil)piridin-3-il]piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-(2-fluorfenil)piperidin-1-karboksamido;

N-(2-chlorfenil)-4-{3-(cianometil)-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[4-ciano-2-(trifluormetil)fenil] piperidin-1-karboksamido;

N-(4-ciano-2-fluorfenil)-4-{3-(cianometil)-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

N-(2-chlor-4-cianofenil)-4-{3-(cianometil)-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksamido;

(3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-{1-[3-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il} azetidin-3-il)acetonitrilo;

5-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil] izoftalonitrilo;

3-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-5-fluorbenzonitrilo;

4-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-3-fluorbenzonitrilo;

5-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-2-fluorbenzonitrilo;

{1-{1-[(5-fluorpiridin-2-il)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluorizonikotinoil)piperidin-4-il]-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3,5-difluorizonikotinoil)piperidin-4-il]-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(3-fluor-4-hidroksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

{1-[1-(2-fluor-4-hidroksibenzoil)piperidin-4-il]-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

2-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil] tereftalonitrilo;

4-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-2-fluorbenzonitrilo;

{1-{1-[5-chloro-2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il] azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{11-[(4,4-difluorcikloheksil)karbonil]piperidin-4-il}-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1Hpirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[4-fluor-2-(trifluormetil)fenil] piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[3-(trifluormetil)piridin-2-il] piperidine-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[4-(trifluormetil)piridin-3-il] piperidin-1-karboksamido;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-[3-(trifluormetil)piridin-4-il] piperidin-1-karboksamido;

4-[1-(3-(cianometil)-1-{1-[3-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il}azetidin-3-il)-1H-pirazol-4-il]-1H-pirolo[2,3-b]piridin-5-karbonitrilo;

4-{1-[1-[1-(3-ciano-5-fluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-(cianometil)azetidin-3-il]-1H-pirazol-4-il}-1H-pirolo[2,3-b]piridin-5-karbonitrilo;

4-{1-[1-[1-(4-ciano-3-fluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-(cianometil)azetidin-3-il]-1H-pirazol-4-il}-1H-pirolo[2,3-b]piridin-5-karbonitrilo;

4-(1-{3-(cianometil)-1-[1-(2,5-dibromobenzoil)piperidin-4-il]azetidin-3-il}-1H-pirazol-4-il)-1H-pirolo[2,3-b]piridin-5-karbonitrilo;

4-(1-{3-(cianometil)-1-[1-(3,5-dibromobenzoil)piperidin-4-il]azetidin-3-il}-1H-pirazol-4-il)-1H-pirolo[2,3-b]piridin-5-karbonitrilo;

2-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(5-ciano-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil] terephthalonitrilo;

5-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(5-ciano-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil] izofthalonitrilo;

4-{1-[1-[1-(4-ciano-2-fluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-(cianometil)azetidin-3-il]-1H-pirazol-4-il}-1H-pirolo[2,3-b]piridin-5-karbonitrilo;

4-{1-[1-[1-(4-ciano-2,6-difluorbenzoil)piperidin-4-il]-3-(cianometil)azetidin-3-il]-1H-pirazol-4-il}-1Hpirolo[2,3-b]piridin-5-karbonitrilo;

4-{1-[1-{1-[5-chloro-2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il}-3-(cianometil)azetidin-3-il]-1H-pirazol-4-il}-1H-pirolo[2,3-b]piridin-5-karbonitrilo;

{1-{1-[5-chlor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1Hpirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[5-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]pipendin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1Hpirazol-1-il]azetidin-3-il} acetonitrilo;

[3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1-{[4-(trifluormetil)-1,3-tiazol-2-il]karbonil}piperidin-4-il) azetidin-3-il]acetonitrilo;

[3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]-1-(1-{[2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)azetidin-3-il]acetonitrilo;

[3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]-1-(1-{[4-(trifluormetil)-1,3-tiazol-2-il]karbonil}piperidin-4-il)azetidin-3-il]acetonitrilo;

[3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]-1-(1-{[5-(trifluormetil)pirazin-2-il]karbonil}piperidin-4-il)azetidin-3-il] acetonitrilo;

{1-[1-(metilsulfonil)piperidin-4-il]-3-[3-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

[3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1-{[5-(trifluormetil)pirazin-2-il]karbonil}piperidin-4-il)azetidin-3-il] acetonitrilo;

[3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1-{[4-(trifluormetil)-1,3-tiazol-2-il]karbonil}piperidin-4-il)azetidin-3-il]acetonitrilo;

{1-[1-(metilsulfonil)piperidin-4-il]-3-[4-(1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

[3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1-{[6-(trifluormetil)pirazin-2-il]karbonil}piperidin-4-il) azetidin-3-il]acetonitrilo;

[3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1-{[2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il) azetidin-3-il]acetonitrilo;

[3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1H-pirazol-1-il]-1-(1-{[5-(trifluormetil)pirazin-2-il]karbonil}piperidin-4-il) azetidin-3-il]acetonitrilo;

{3-[4-(5-fluor-1H-pirolo[2,3-b]piridin-4-il)-1Hpirazol-1-il]-1-[1-(metilsulfonil)piperidin-4-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

4-[1-(3-(cianometil)-1-{1-[5-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il}azetidin-3-il)-1H-pirazol-4-il]-1H-pirolo[2,3-b]piridine-5-karbonitrilo; ir

4-(1-{3-(cianometil)-1-[1-(metilsulfonil)piperidin-4-il]azetidin-3-il}-1H-pirazol-4-il)-1H-pirolo[2,3-b]piridin-5-karbonitrilo;

arba bet kurio aukščiau minėto junginio farmaciniu požiūriu priimtina druska; arba

b) junginys, parinktas iš:

cis-{1-{(3-metoksi-1-[3-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(cis-3-metoksi-1-{[2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{cis-3-fluor-1-[3-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il] azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(cis-3-fluor-1-{[2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[3-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]-4-deuteropiperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il] azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{1-[3-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]3,3,4,5,5-pentadeuteropiperidin-4-yl{-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-{7-[3-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]-3-oxa-7-azabiciklo[3.3.1]non-9-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{[4-[(dimetilamino)metil]-6-(trifluormetil)piridin-2-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-N-izopropilpiperidin-1-karboksamido;

{1-1-[6-[(dimetilamino)metil]-3-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

3-[(4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-il)karbonil]-5-[(dimetilamino)metil]benzonitrilo;

{1-(1-{[6-[(dimetilamino)metil]-2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{[6-[(metilamino)metil]-2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{[6-(azetidin-1-ilmetil)-2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{[6-[(dietilamino)metil]-2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil{piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{[6-{[etil(metil)amino]metil}-2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7Hpirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{3-(difluormetil)-5-[(dimetilamino)metil]benzoil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{[6-(pirolidin-1-ilmetil)-2-(trifluormetil)pirimidin-4-il] karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{[6-{[(3S)-3-fluorpirolidin-1-il]metil}-2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{[6-{[(3R)-3-fluorpirolidin-l-il]metil}-2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{[6-[(3,3-difluorpirolidin-1-il)metil]-2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{[6-[(tret-butilamino)metil]-2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{[6-(hidroksimetil)-2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{[6-[(izopropilamino)metil]-2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{[6-[(etilamino)metil]-2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{[6-{[(2-metoksietil)(metil)amino]metil}-2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-l-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

{1-(1-{[6-{[(3-hidroksipropil)(metil)amino]metil}-2-(trifluormetil)pirimidin-4-il]karbonil}piperidin-4-il)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-l-il]azetidin-3-il}acetonitrilo;

propil 4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidine-1-karboksilato;

ciklobutilmetil 4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il{piperidine-1-karboksilato;

etil 4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksilato;

benzil 4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksilato;

izobutil 4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksilato;

ciklopropilmetil 4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksilato;

(1-metilciklopropil)metil 4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksilato;

2,4-difluorbenzil 4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksilato;

3,4-difluorbenzil 4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksilato;

3,5-difluorbenzil 4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksilato;

ciklopentilmetil 4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksilato; ir

cikloheksilmetil 4-{3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}piperidin-1-karboksilato;

arba bet kurio aukščiau minėto junginio farmaciniu požiūriu priimtina druska.

14. Junginys pagal 1 punktą, kuris yra {1-{1-[3-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7Hpirolo[2,3-d] pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilas arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

15. Druska pagal 1 punktą, kuri yra {1-{1-[3-fluor-2-(trifluormetil)izonikotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirolo[2,3-d] pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo adipo rūgšties druska.

16. Druska pagal 15 punktą, kuri yra charakterizuojama maždaug 178 °C lydymosi tašku.

17. Druska pagal 15 arba 16 punktą, turinti

a) diferencinę skenavimo kalorimetrijos termogramą, kuri yra charakterizuojama endotermine smaile su pradžios temperatūra maždaug 176 °C; arba

b) diferencinę skenavimo kalorimetrijos termogramą, kaip parodyta figūroje 1.

18. Druska pagal bet kurį iš 15-17 punktų, turinti terminę gravimetrinės analizės termogramą, iš esmės kaip parodyta figūroje 2.

19. Druska pagal bet kurį iš 15-18 punktų, turinti

a) miltelių Rentgeno spindulių difrakcijos modulį, apimantį charakteringas smailes, išreikštas laipsniais 2θ ties maždaug 10,4;arba

b) miltelių Rentgeno spindulių difrakcijos modulį, apimantį charakteringas smailes, išreikštas laipsniais 2θ ties maždaug 6,9; arba

c) miltelių Rentgeno spindulių difrakcijos modulį, apimantį charakteringas smailes, išreikštas laipsniais 2θ ties maždaug 21,0; arba

d) miltelių Rentgeno spindulių difrakcijos modulį, apimantį charakteringas smailes, išreikštas laipsniais 2θ ties maždaug 23,3; arba

e) miltelių Rentgeno spindulių difrakcijos modulį, apimantį charakteringas smailes, išreikštas laipsniais 2θ ties maždaug 6,9, 10,4, 21,0 ir 23,3; arba

f) miltelių Rentgeno spindulių difrakcijos modulį, iš esmės kaip parodyta figūroje 3.

20. Kompozicija, apimanti junginį arba druską pagal bet kurį iš 1-19 punktų ir farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį.

21. Junginys arba druska pagal bet kurį iš 1-19 punktų, skirti panaudoti JAK1 aktyvumo moduliavimo būde.

22. Junginys arba druska, skirti panaudoti pagal 21 punktą, kur minėtas junginys arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska yra selektyvūs JAK1 prieš JAK2.

23. Junginys arba druska pagal bet kurį iš 1-19 punktų, skirti panaudoti autoimuninės ligos, vėžio, mieloproliferacinio sutrikimo, uždegiminės ligos, kaulų rezorbcijos ligos gydyme arba organo transplantanto atmetimo paciente, kuriam tai reikalinga.

24. Junginys arba druska, skirti panaudoti pagal 23 punktą, kur

a) minėta autoimuninė liga yra odos susirgimas, dauginė sklerozė, reumatoidinis artritas, psoriazinis artritas, jaunatvinis artritas, I tipo diabetas, vilkligė, uždegiminė žarnų liga, Krono liga, sunkioji miastenija, imunoglobulino nefropatija, miokarditas arba autoimuninė skydliaukės liga; arba

b) minėta autoimuninė liga yra reumatoidinis artritas; arba

c) minėta autoimuninė liga yra odos susirgimas; arba

d) minėta autoimuninė liga yra odos susirgimas, kuris yra atopinis dermatitas, psoriazė, odos jautrinimas, odos suerzinimas, odos bėrimas, kontaktinis dermatitas arba alerginis kontaktinis jautrinimas; arba

e) minėtas vėžys yra kietas navikas; arba

f) minėtas vėžys yra prostatos vėžys, inkstų vėžys, kepenų vėžys, krūties vėžys, plaučių vėžys, skydliaukės vėžys, Kapoši sarkoma, Kastlemano liga arba kasos vėžys; arba

g) minėtas vėžys yra limfoma, leukemija arba dauginė mieloma; arba

h) minėtas mieloproliferacinis susirgimas yra tikroji policitemija (PV), esminė trombocitemija (ET), mieloidinė metaplazija su mielofibroze (MMM), pirminė mielofibrozė (PMF), lėtinė mielogeninė leukemija (CML), lėtinė mielomonocitinė leukemija (CMML), hipereozinofilinis sindromas (HES), idiopatinė mielofibrozė (IMF) arba sisteminė putliųjų ląstelių liga (SMCD); arba

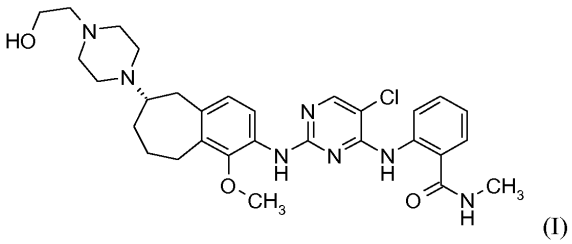
i) minėta mieloproliferacinė liga yra mielofibrozė; arba

j) minėta mieloproliferacinė liga yra pirminė mielofibrozė (PMF); arba

k) minėta kaulų rezorbcijos liga yra osteoporozė, osteoartritas, kaulų rezorbcija, susijusi su hormonų disbalansu, kaulų rezorbcija, susijusi su hormonų terapija, kaulų rezorbcija, susijusi su autoimunine liga arba kaulų rezorbcija, susijusi su vėžiu.

---

(51) Int.Cl. ***C07D 403/04*** (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)
(11) **2822939**
(96) 13710258.8
(96) 2013-03-06
(97) 2015-01-14
(97) 2016-02-17
(86) PCT/US2013/029304
(86) 2013-03-06
(87) WO 2013/134353
(87) 2013-09-12
(30) 201261607305 P, 2012-03-06, US
(72) JACOBS, Martin J., US
OTT, Gregory R., US
COURVOISIER, Laurent, US
ALLWEIN, Shawn P., US
(73) Cephalon, Inc., Frazer, PA 19355, US
(74) Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Kondensuotas biciklinis 2,4-diaminopirimidino darinys, kaip dvejopas ALK ir FAK inhibitorius
Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 0.
(57) 1. Junginys, turintis formulę (I)



(I)

arba jo druska.

2. Junginys, turintis formulę (I) pagal 1 punktą.

3. Junginio, turinčio formulę (I) pagal 1 punktą druska, kur druska yra rūgšties prisijungimo druska.

4. Junginio, turinčio formulę (I) pagal 1 punktą druska, kur druska yra tribenzensulfonato druska.

5. Junginio, turinčio formulę (I) tribenzensulfonato druska pagal 4 punktą, turinti:

(a) miltelių Rentgeno spinduliuotės difrakcijos (XRPD) spektrą, apimantį vieną arba daugiau smailių, parinktų iš 7,62 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 13,11 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 13,76 ± 0,2 laipsnių 2Θ, ir 14,05 ± 0,2 laipsnių 2Θ; arba

(b) XRPD spektrą, apimantį vieną arba daugiau smailių, parinktų iš 6,85 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 7,62 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 8,01 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 13,11 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 13,76 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 14,05 ± 0,2 laipsnių 2Θ, ir 14,60 ± 0,2 laipsnių 2Θ; arba

(c) XRPD spektrą, apimantį vieną arba daugiau smailių, parinktų iš 7,62 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 13,11 ± 0,2 laipsnių 2Θ , 13,76 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 14,05 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 17,10 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 17,86 ± 0,2 laipsnių 2Θ ir 18,10 ± 0,2 laipsnių 2Θ.

6. Junginio, turinčio formulę (I) pagal 1 punktą druska, kur druska yra trihidrochlorido dihidrato druska.

7. Junginio, turinčio formulę (I), trihidrochlorido dihidrato druska pagal 6 punktą, turinti:

(a) XRPD spektrą, apimantį vieną arba daugiau smailių, parinktų iš 5,42 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 8,86 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 14,06 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 17,52 ± 0,2 laipsnių 2Θ ir 18,51 ± 0,2 laipsnių 2Θ; arba

(b) XRPD spektrą, apimantį vieną arba daugiau smailių, parinktų iš 5,42 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 5,91 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 8,86 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 10,80 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 11,79 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 14,06 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 14,72 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 17,02 ± 0,2 laipsnių 2Θ, 17,52 ± 0,2 laipsnių 2Θ ir 18,51 ± 0,2 laipsnių 2Θ.

8. Farmacinė kompozicija, apimanti junginį arba druską pagal bet kurį iš 1-7 punktą ir farmaciniu požiūriu priimtiną užpildą.

9. Farmacinė kompozicija pagal 8 punktą, kur minėta kompozicija yra tabletės arba kapsulės pavidale.

10. Junginys arba druska pagal bet kurį iš 1-7 punktą, skirtas naudoti anaplastinės limfomos kinazės (ALK) arba fokalinės adhezijos kinazės (FAK) medijuojamos būklės arba sutrikimo, parinktų iš anaplastinės didžiųjų ląstelių limfomos (ALCL), nesmulkiųjų ląstelių plaučių vėžio (NSCLC), neuroblastomos, glioblastomos, prostatos vėžio, žvynuotųjų ląstelių karcinomos (SCC) ir krūties vėžio, gydymui.

11. Junginys, skirtas naudoti pagal 10 punktą, kur ALK- arba FAK-medijuojama būklė arba sutrikimas yra parinkti iš:

(a) ALK-teigiamos ALCL, EML4-ALK-teigiamo NSCLC, neuroblastomos, glioblastomos, nuo androgenų nepriklausomo prostatos vėžio, krūties vėžio, bei galvos ir kaklo žvynuotųjų ląstelių karcinomos (HNSCC); arba

(b) ALK-teigianos ALCL, EML4-ALK-teigiamo NSCLC, neuroblastomos, nuo androgenų nepriklausomo prostatos vėžio, krūties vėžio ir HNSCC; arba

(c) ALK-teigiamos ALCL, EML4-ALK-teigiamo NSCLC, neuroblastomos ir glioblastomos; arba

(d) ALK-teigiamos ALCL, EML4-ALK-teigiamo NSCLC ir neuroblastomos; arba

(e) ALK-teigiamos ALCL ir EML4-ALK-teigiamo NSCLC.

12. Junginys, skirtas naudoti pagal 10 punktą, kur ALK- arba FAK-medijuojama būklė arba sutrikimas yra parinktas iš nuo androgenų nepriklausomo vėžio, krūties vėžio ir HNSCC.

13. Junginys, skirtas naudoti pagal 10 punktą, kur ALK- arba FAK-medijuojama būklė arba sutrikimas yra ALK-medijuojama būklė arba sutrikimas.

14. Junginys, skirtas naudoti pagal 10 punktą, kur ALK- arba FAK-medijuojama būklė arba sutrikimas yra FAK-medijuojama būklė arba sutrikimas.

---

(51) Int.Cl. ***C07D 403/12*** (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 239/95 (2006.01)
A61K 31/517 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)

(11) **2812323**

(96) 13701703.4

(96) 2013-01-14

(97) 2014-12-17

(97) 2016-04-06

(86) PCT/EP2013/000078

(86) 2013-01-14
(87) WO 2013/117288
(87) 2013-08-15
(30) 12000841, 2012-02-09, EP
(72) BUCHSTALLER, Hans-Peter, DE
ESDAR, Chirstina, DE
LEUTHNER, Birgitta, DE
(73) Merck Patent GmbH, 64293 Darmstadt, DE
(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
(54) Tetrahidro-chinazolinono dariniai, kaip TANK ir PARP inhibitoriai
Apibrėžties punktai: 7, brėžiniai: 0.
(57) 1. Junginiai, parinkti iš grupės:

No.	Pavadinimas ir/arba struktūra
„A5“	2-[4-(3-fluorfenil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A6“	2-[4-(4-fluorfenil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A8“	2-[4-(4-chlorfenil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A9“	2-[4-(2-chlorfenil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A10“	2-(4-trifluormetilpiperidin-1-il)-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A11“	2-[4-(3-chlorfenil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A13“	2-(4-tret-butilpiperazin-1-il)-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A14“	2-[4-(4-metoksifenil)-3-oksopiperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A15“	2-[4-(piperidin-1-karbonil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A16“	2-[4-(6-hidroksipiridin-2-il)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A18“	N-piridin-2-il-2-[4-(4-okso-3,4,5,6,7,8-heksahidrochinazolin-2-il)piperazin-1-il]acetamido
„A19“	2-(4-acetilpiperazin-1-il)-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A20“	2-[4-(morfolin-4-karbonil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A21“	2-[4-(3-aminopropanoil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A22“	2-[4-(4-okso-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-2-il)piperazin-1-il]piridin-3-karboksamido
„A23“	2-[4-(4-okso-3,4,5,6,7,8-heksahidrochinazolin-2-il)piperazin-1-il]-N-piridin-3-ilacetamido
„A24“	2-[4-(2,2-dimetilpropanoil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A25“	2-[4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A26“	2-[4-[2-(2-piridil)etil]piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A27“	2-[4-(piperidin-2-karbonil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A28“	4-(4-okso-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-2-il)piperazin-2-karboksamido
„A29“	2-[3-(hidroksimetil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono

No.	Pavadinimas ir/arba struktūra
„A30“	(2R)-1-(4-okso-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-2-il)piperazin-2-karboksamido
„A31“	2-[(2R)-2-(hidroksimetil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A32“	2-[4-(3-piridil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A33“	2-[4-(4-okso-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-2-il)piperazin-1-il]benzonitrilo
„A34“	2-[4-(4-okso-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-2-il)piperazin-1-il]benzamido
„A35“	2-(4-hidroksi-4-fenil-1-piperidil)-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A36“	2-[4-(4-fluor-2-metoksi-fenil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A37“	2-[4-(2,4-dimetoksifenil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A38“	2-[4-(2-chlor-4-metoksi-fenil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A39“	2-[4-(2-chlor-4-fluor-fenil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A40“	2-[4-(4-okso-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-2-il)piperazin-1-il]acetamido
„A41“	2-(3-fenilpiperazin-1-il)-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A42“	2-[4-(2-izopropoksifenil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A43“	2-[4-[2-(trifluormetoksi)fenil]piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A44“	2-[4-(6-metoksipiridazin-3-il)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A45“	4-[4-(4-okso-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-2-il)piperazin-1-il]benzonitrilo
„A46“	2-[4-[4-(4-okso-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-2-il)piperazin-1-il]fenil]acetonitrilo
„A47“	2-[4-[4-(trifluormetoksi)fenil]piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A48“	2-[4-(4-etoksifenil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A49“	2-[4-(4-izopropoksifenil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A50“	2-[4-(4-trifluormetilfenil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A51“	2-[4-(6-metoksi-3-piridil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A52“	2-[4-(5-metoksi-2-piridil)piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A53“	2-[4-hidroksi-4-(4-metoksi-fenil)-piperidin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A54“	2-[4-(2-metoksi-fenil)-piperidin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A55“	2-[4-(4-metoksi-fenil)-piperidin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A56“	2-[4-(2-trifluormetil-fenil)-piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono
„A57“	2-[4-[2-(1-hidroksi-1-metil-etil)fenil]piperazin-1-il]-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-ono

ir jų farmaciniu požiūriu priimtinų solvatų, druskų, tautomerų ir stereoizomerų, įskaitant jų mišinius visais santykiais.

2. Vaistai, apimantys mažiausiai vieną junginį pagal 1 punktą ir/arba jų farmaciniu požiūriu priimtinus solvatus, druskas, tautomerus ir stereoizomerus, įskaitant jų mišinius visais santykiais, ir pasirinktinai farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį, pagalbinę medžiagą arba užpildą.

3. Junginiai pagal 1 punktą ir jų farmaciniu požiūriu priimtini solvatai, druskos, tautomerai ir stereoizomerai, įskaitant jų mišinius visais santykiais, skirti panaudoti vėžio, išsėtinės sklerozės, kardiovaskulinių ligų, centrinės nervų sistemos pažeidimo ir skirtingų uždegimo formų gydymui ir/arba prevencijai.

4. Junginiai, skirti panaudoti pagal 3 punktą ligų, parinktų iš galvos, kaklo, akies burnos, gerklės, stemplės, bronchų, gerklų, ryklės, krūtinės ląstos, kaulų, plaučių, gaubtinės žarnos, tiesiosios žarnos, skrandžio, prostatos, šlapimo pūslės, gimdos, gimdos kaklelio, krūties, kiaušidžių, sėklidžių arba kitų reprodukcinių organų, odos, skydliaukės, kraujo, limfmazgių, inkstų, kepenų, kasos, smegenų, centrinės nervų sistemos vėžio, solidinių navikų ir kraujo-kaulų navikų grupės gydymui ir/arba prevencijai.

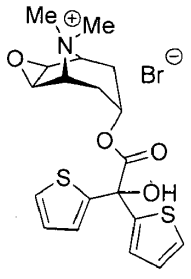
5. Vaistai, apimantys mažiausiai vieną junginį pagal 1 punktą ir mažiausiai vieną kitą vaistinį aktyvų ingredientą.

6. Komplektas (rinkinys), susidedantis iš atskirų pakuočių iš:
(a) junginio pagal 1 punktą ir/arba jo farmaciniu požiūriu priimtinų solvatų, druskų, tautomerų ir stereoizomerų, įskaitant jų mišinius visais santykiais veiksmingo kiekio ir
(b) kito vaistinio aktyvaus ingrediento veiksmingo kiekio.

7. Junginys pagal 1 punktą, 2-(4-tret-butil-piperazin-1-il)-5,6,7,8-tetrahidro-3H-chinazolin-4-onas “A13”), ir/arba jo farmaciniu požiūriu priimtini solvatai, druskos, tautomerai ir stereoizomerai, įskaitant jų mišinius visais santykiais.

---

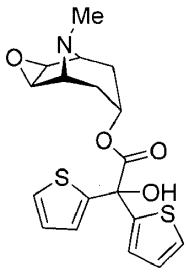
(51) Int.Cl. ***C07D 451/10*** (2006.01)
C07D 451/00 (2006.01)
(11) **2831068**
(96) 13716179.0
(96) 2013-03-28
(97) 2015-02-04
(97) 2016-03-02
(86) PCT/CZ2013/000046
(86) 2013-03-28
(87) WO 2013/143510
(87) 2013-10-03
(30) 20120226, 2012-03-30, CZ
(72) CERNA, Igor, SK
HAJICEK, Josef, CZ
(73) Zentiva, K.S., 102 37 Praha 10, CZ
(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
(54) Di-(2-tienil)glikolio rūgšties skopino esterio, tarpinio junginio tiotropiumo bromido sintezėje, gavimo būdas
Apibrėžties punktai: 10, brėžiniai: 0.
(57) 1. Tiotropiumo bromido, kurio formulė II:



II

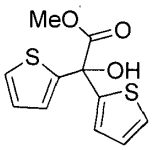
gavimo būdas, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis apima šias pakopas:

a) skopino estrio, kurio formulė I:

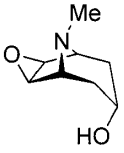


I

gavimą metilo di(2tienil)glikoliato, kurio formulė IV transesterinimu su skopinu, kurio formulė III:



IV



III

naudojant erdviškai suvaržytos bazės, parinktos iš šakotų C_3 - C_5 alkoksidų šarminių druskų grupės, substoichiometrinio kiekio inertiniame tirpiklyje,

b) I formulės skopino esterio atskyrimą ir

c) I formulės skopino esterio kvaternizaciją su metilo bromidu.

2. Būdas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad erdviškai suvaržyta bazė yra parinkta iš *tret*-butoksido, *tret*-pentoksido ir izopropoksido natrio arba kalio druskų grupės.

3. Būdas pagal 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad erdviškai suvaržyta bazė yra *tret*-butoksido arba *tret*-pentoksido natrio arba kalio druska.

4. Būdas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad erdviškai suvaržyta bazė yra naudojama intervale nuo 0,3 iki 0,7 ekvivalentų, susijusių su skopinu.

5. Būdas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad toluenas, tetrahidrofuranas arba jų mišiniai yra naudojami kaip inertinis tirpiklis.

6. Būdas pagal 1-5 punktus, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad transesterifikacija yra vykdoma temperatūros intervale nuo 80 iki 130°C.

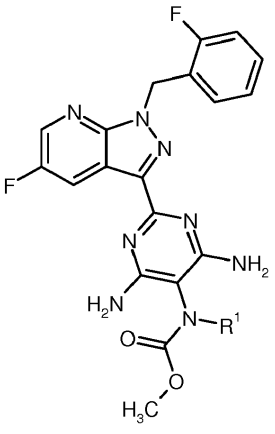
7. Būdas pagal 6 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad transesterifikacija yra vykdoma slėgio intervale nuo 50 kPa iki 30 kPa, susidaręs metanolis tuo pačiu metu yra pašalinamas distiliacija.

8. Būdas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad atskyrimo (b) pakopa apima reakcijos mišinio iš (a) pakopos maišymą pasirinktinai po praskiedimo ekstrakcijos tirpikliu su neorganinės rūgšties vandeniniu tirpalu, vandeninės fazės ekstrakciją su ekstrakcijos tirpikliu, vandeninės fazės alkalizaciją su neorganine baze iki pH intervale 7-9, produkto ekstrakciją su ekstrakcijos tirpikliu ir, po koncentravimo, I formulės žaliavinio skopino esterio kristalizaciją iš kristalizuojančio tirpiklio.

9. Būdas pagal 8 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad dichlormetanas yra naudojamas kaip ekstrakcijos agentas.

10. Būdas pagal 8 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kristalizacijos tirpiklis yra acetonitrilas arba toluenas arba jų mišiniai.

(51) Int.Cl. ***C07D 471/04*** (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)
A61P 15/00 (2006.01)
(11) **2576547**
(96) 11720806.6
(96) 2011-05-24
(97) 2013-04-10
(97) 2016-01-27
(86) PCT/EP2011/058431
(86) 2011-05-24
(87) WO 2011/147809
(87) 2011-12-01
(30) 102010021637, 2010-05-26, DE
(72) FOLLMANN, Markus, DE
STASCH, Johannes-Peter, DE
REDLICH, Gorden, DE
ACKERSTAFF, Jens, DE
GRIEBENOW, Nils, DE
KROH, Walter, DE
KNORR, Andreas, DE
BECKER, Eva-Maria, DE
WUNDER, Frank, DE
LI, Volkhart Min-Jian, DE
HARTMANN, Elke, DE
MITTENDORF, Joachim, DE
SCHLEMMER, Karl-Heinz, DE
JAUTELAT, Rolf, DE
BIERER, Donald, DE
(73) Adverio Pharma GmbH, 12529 Schönefeld, DE
(74) Liudmila GERASIMOVIČ, 9, IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius, LT
(54) Pakeistieji 5-fluor-1H-pirazolopiridinai ir jų panaudojimas
Apibrėžties punktai: 11, brėžiniai: 0.
(57) 1. Junginys, kurio formulė (I)



(I),

kur

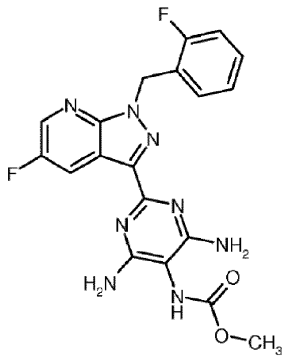
R^1 žymi vandenilį arba (C_1-C_4)-alkilą, kur (C_1-C_4)-alkilas gali turėti vieną arba du pakaitus, vienas nuo kito nepriklausomai pasirinktus iš grupės, susidedančios iš fluoro ir trifluormetilo,

ir jo *N*-oksidai, druskos, solvatai, *N*-oksidų druskos ir *N*-oksidų ir druskų solvatai.

2. Junginys, kurio formulė (I) pagal 1 punktą, kur:
R^1 žymi vandenilį arba metilą, kur metilas gali būti pakeistas trifluormetilo pakaitu, ir jo druskos, solvatai ir druskų solvatai.

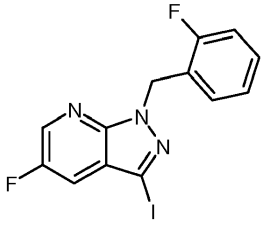
3. Junginys, kurio formulė (I) pagal 1 arba 2 punktą, pasirinktas iš grupės, susidedančios iš:
metilo {4,6-diamino-2-[5-fluor-1-(2-fluorbenzil)-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-3-il]pirimidin-5-il}karbamato;
metilo {4,6-diamino-2-[5-fluor-1-(2-fluorbenzil)-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-3-il]pirimidin-5-il}metilkarbamato;
metilo {4,6-diamino-2-[5-fluor-1-(2-fluorbenzil)-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-3-il]pirimidin-5-il}(2,2,2-trifluoretil)karbamato;
metilo {4,6-diamino-2-[5-fluor-1-(2-fluorbenzil)-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-3-il]pirimidin-5-il}karbamato hidrochlorido;
metilo {4,6-diamino-2-[5-fluor-1-(2-fluorbenzil)-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-3-il]pirimidin-5-il}karbamato sulfato;
metilo {4,6-diamino-2-[5-fluor-1-(2-fluorbenzil)-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-3-il]pirimidin-5-il}karbamato fosfato;
metilo {4,6-diamino-2-[5-fluor-1-(2-fluorbenzil)-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-3-il]pirimidin-5-il}karbamato mezilato;
metilo {4,6-diamino-2-[5-fluor-1-(2-fluorbenzil)-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-3-il]pirimidin-5-il}karbamato etan-1,2-disulfonato;
metilo {4,6-diamino-2-[5-fluor-1-(2-fluorbenzil)-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-3-il]pirimidin-5-il}karbamato maleato;
metilo {4,6-diamino-2-[5-fluor-1-(2-fluorbenzil)-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-3-il]pirimidin-5-il}karbamato nitrato.

4. Metilo {4,6-diamino-2-[5-fluor-1-(2-fluorbenzil)-1H-pirazolo[3,4-b]piridin-3-il]pirimidin-5-il}karbamatas pagal 1 punktą:



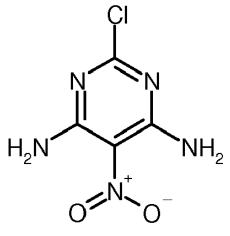
ir jo druskos, solvatai ir druskų solvatai.

5. Junginio formulės (I) pagal bet kurį iš 1-4 punktų gamybos būdas, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad junginį formulės (II):



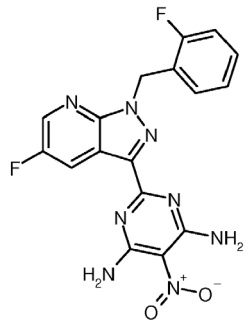
(II)

[A] inertiniame tirpiklyje esant heksabutilo alavui ir tinkamam paladžio katalizatoriui, susidarant tarpiniam alavo junginiui, veikia junginiu formulės (III):



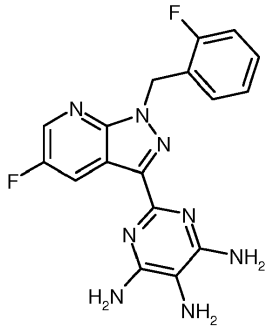
(III),

siekiant gauti junginį formulės (IV):



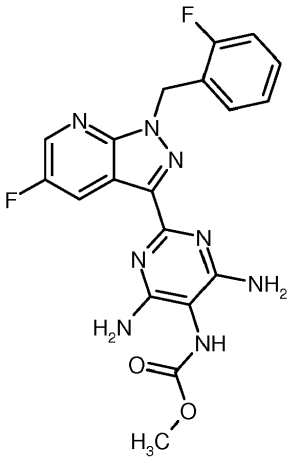
(IV),

po to šį junginį redukuoja inertiniame tirpiklyje su tinkamu redukcijos agentu, siekiant gauti junginį formulės (V):



(V)

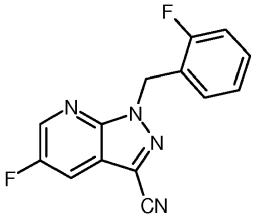
po to, esant tinkamai bazei, esant tinkamam tirpikliui arba nesant jo, šį junginį veikia metilo chlorformatu, siekiant gauti junginį formulės (I-A):



(I-A),

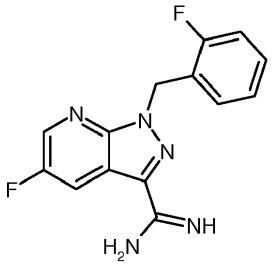
arba

[B] junginį formulės (II) inertiniame tirpiklyje veikia vario cianidu, siekiant gauti junginį formulės (VI):



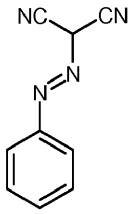
(VI),

po to šį junginį rūgštinėmis sąlygomis paverčia junginiu formulės (VII):



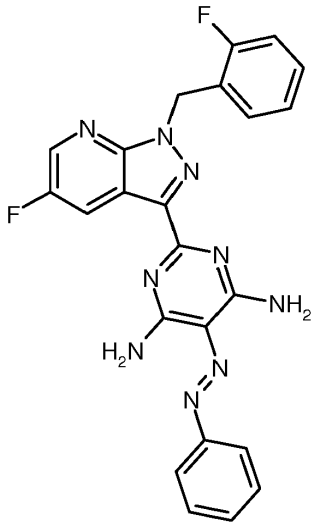
x H_3CCO_2H (VII),

po to šį junginį inertiniame tirpiklyje esant tinkamai bazei, veikia junginiu formulės (VIII):



(VIII)

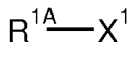
siekiant gauti junginį formulės (IX):



(IX),

po to šį junginį redukuoja inertiniame tirpiklyje esant tinkamam redukcijos agentui, siekiant gauti junginį formulės (V), ir šį junginį po to toliau veikia papildomai pagal procesą [A], siekiant gauti junginį (I-A), arba

[C] junginį formulės (I-A) veikia inertiniame tirpiklyje esant tinkamai bazei junginiu formulės (X):



(X) ,

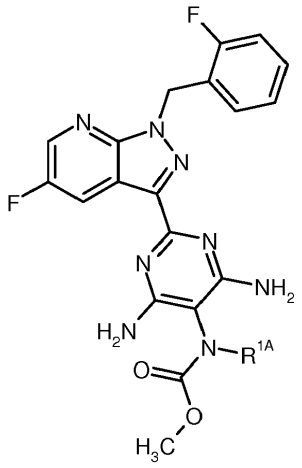
kur:

R^{1A} žymi (C_1-C_4)-alkilą,

kur (C_1-C_4)-alkilas gali turėti vieną arba du pakaitus, vienas nuo kito nepriklausomai pasirinktus iš grupės, susidedančios iš fluoro ir trifluormetilo,

ir

X^1 žymi pasišalinančią grupę, tokią kaip, pavyzdžiui, halogenas, ypatingai bromą arba jodą, trichlormetansulfonatą, mezilatą arba tozilatą, siekiant gauti junginį formulės (I-B)



(I-B)

kur R^{1A} reikšmė yra kaip minėta aukščiau,

ir gautus junginius formulių (I-A) ir (I-B), kur tinkama, tinkamais (i) tirpikliais ir/arba (ii) tinkamomis rūgštimis arba bazėmis paverčia jų solvatais, druskomis ir/arba druskų solvatais.

6. Junginys formulės (I) pagal bet kurį iš 1-4 punktų, skirtas naudoti ligų gydymo ir/arba profilaktikos būde.

7. Junginys formulės (I) pagal bet kurį iš 1-4 punktų, skirtas naudoti širdies nepakankamumo, *angina pectoris*, hipertenzijos, plaučių hipertenzijos, išemijos, kraujagyslių ligų, inkstų nepakankamumo, tromboembolinių sutrikimų, fibrozinių sutrikimų ir arteriosklerozės gydymui ir/arba profilaktikai.

8. Junginio formulės (I) pagal bet kurį iš 1-4 punktų, panaudojimas gaminant vaistą, skirtą širdies nepakankamumo, *angina pectoris*, hipertenzijos, plaučių hipertenzijos, išemijos, kraujagyslių ligų, inkstų nepakankamumo, tromboembolinių sutrikimų, fibrozinių sutrikimų ir arteriosklerozės gydymui ir/arba profilaktikai.

9. Vaistas, apimantis junginį formulės (I) pagal bet kurį iš 1-4 punktų derinyje su inertiniu, netoksišku, farmaciniu požiūriu priimtinu ekscipientu.

10. Vaistas, apimantis junginį formulės (I) pagal bet kurį iš 1-4 punktų derinyje su papildomu veikliuoju junginiu, pasirinktu iš grupės, susidedančios iš organinių nitratų, NO-donorų, cGMP-PDE slopiklių, prieštrombiniu aktyvumu pasižyminčių agentų, kraujo spaudimą mažinančių agentų ir lipidų metabolizmą keičiančių agentų.

11. Vaistas pagal 9 arba 10 punktą, skirtas širdies nepakankamumo, *angina pectoris*, hipertenzijos, plaučių hipertenzijos, išemijos, kraujagyslių ligų, inkstų nepakankamumo, tromboembolinių sutrikimų, fibrozinių sutrikimų ir arteriosklerozės gydymui ir/arba profilaktikai.

---

(51) Int.Cl. ***C07D 487/04*** (2006.01)
C07D 495/04 (2006.01)
C07D 513/04 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61K 31/55 (2006.01)
A61K 31/551 (2006.01)
A61P 11/00 (2006.01)

(11) **2585467**

(96) 11729018.9

(96) 2011-06-23

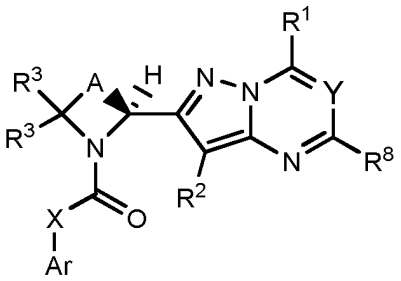
(97) 2013-05-01

(97) 2016-03-02

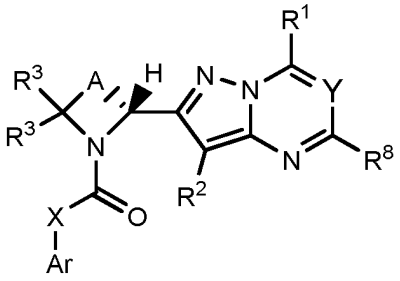
(86) PCT/US2011/041688

(86) 2011-06-23

(87) WO 2011/163518
(87) 2011-12-29
(30) 358122 P, 2010-06-24, US
(72) BABAOGLU, Kerim, US
BOOJAMRA, Constantine, G., US
EISENBERG, Eugene, J., US
HUI, Hon Chung, US
MACKMAN, Richard, L., US
PARRISH, Jay, P., US
SANGI, Michael, US
SAUNDERS, Oliver, L., US
SIEGEL, Dustin, US
SPERANDIO, David, US
YANG, Hai, US
(73) Gilead Sciences, Inc., Foster City, CA 94404, US
(74) Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Pirazolo[1,5-a]pirimidinai ir -triazinai, kaip antivirusiniai agentai
Apibrėžties punktai: 43, brėžiniai: 0.
(57) 1. Junginys, turintis formulę I arba formulę II:



Formulė I



Formulė II

arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba esteris;

kur:

A yra $-(C(R^4)_2)_n-$, kuriame bet kuris $C(R^4)_2$ minėtame $-(C(R^4)_2)_n-$ gali būti pasirinkrinai pakeistas -O-, -S-, $-S(O)_p-$, NH arba NR^a;

n yra 3, 4, 5 arba 6;

kiekvienas p yra 1 arba 2;

Ar yra C_2-C_{20} heterociklilo grupė arba C_6-C_{20} arilo grupė, kur C_2-C_{20} heterociklilo grupė arba C_6-C_{20} arilo grupė yra pasirinktinai pakeistos 1-5 grupėmis R^6,

X yra $-C(R^{13})(R^{14})-$, $-N(CH_2R^{14})-$ arba X nėra;

Y yra N arba CR^7;

kiekvienas R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 arba R^8 nepriklausomai, yra H, okso, OR^{11}, $NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(O)R^{11}$, $NR^{11}C(O)OR^{11}$, $NR^{11}C(O)NR^{11}R^{12}$, N_3, CN, NO_2, SR^{11}, $S(O)_pR^a$, $NR^{11}S(O)_pR^a$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)SR^{11}$, $-S(O)_p(OR^{11})$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}S(O)_p(OR^{11})$, $-NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(=NR^{11})NR^{11}R^{12}$, halogenas, ($C_1$-$C_8$)alkilas, ($C_2$-$C_8$)alkenilas, ($C_2$-$C_8$)alkinilas, aril($C_1$-$C_8$)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8)karbociklilalkilas;

du R^4 prie gretimų anglies atomų kartu gali sudaryti dvigubą ryšį tarp dviejų anglies atomų, prie kurių jie yra prijungti, arba gali sudaryti (C_3-C_7)cikloalkilo žiedą, kuriame minėto (C_3-C_7)cikloalkilo žiedo vienas anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas -O-, - S-, $-S(O)_p-$, -NH- arba $-NR^a-$ grupe;

keturi R^4 prie gretimų anglies atomų kartu gali sudaryti pasirinktinai pakeistą C_6 arilo žiedą;

du R^4 prie to paties anglies atomo kartu gali sudaryti (C_3-C_7)cikloalkilo žiedą, kuriame minėto (C_3-C_7)cikloalkilo žiedo vienas anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas -O-, -S-, $-S(O)_p-$, -NH- arba $-NR^a-$ grupe;

du R^6 prie gretimų anglies atomų kartu gali sudaryti (C_3-C_7)cikloalkilo žiedą, kuriame minėto (C_3-C_7)cikloalkilo žiedo vienas anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas -O-, -S-, -S(O)p-, -NH- arba $-NR^a-$ grupe;

bet kuris R^6, gretimas minėto Ar įpareigojančiai karbonilo grupei, kartu su R^3 gali sudaryti ryšį arba -$(C(RS)_2)_m$- grupę, kurioje m yra 1 arba 2;

bet kuris R^6, gretimas minėto Ar įpareigojančiai karbonilo grupei, kartu su R^2 gali sudaryti ryšį;

kiekvienas R^a, nepriklausomai, yra (C_1-C_8)alkilas, (C_1-C_8)halogenalkilas, (C_2-C_8)alkenilas, (C_2-C_8)alkinilas, aril(C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8)karbociklilalkilas, kur bet kuris (C_1-C_8)alkilas, (C_1-C_8)halogenalkilas, (C_2-C_8)alkenilas arba (C_2-C_8)alkinilas, esantis grupėje R^a, yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau OH, NH_2, CO_2H, C_2-C_{20} heterociklilu, ir kur bet kuris aril(C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8)karbociklilalkilas, esantis grupėje R^a , yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau OH, NH_2, CO_2H, C_2-C_{20} heterociklilu arba (C_1-C_8)alkilu;

kiekvienas R^{11} arba R^{12} , nepriklausomai, yra H, (C_1-C_8)alkilas, (C_2-C_8)alkenilas, (C_2-C_8)alkinilas, aril(C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas, (C_4-C_8)karbociklilalkilas, -C(=O)Ra, -$S(O)_pR^a$ arba aril(C_1-C_8)alkilas; arba R^{11} and R^{12} kartu su azotu, prie kurio jie abu yra prijungti, sudaro 3-7 narių heterociklinį žiedą, kur minėto heterociklinio žiedo bet kuris anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas - O-, -S-, -$S(O)_p$-, -NH-, -NR^a- arba -C(O)- grupe;

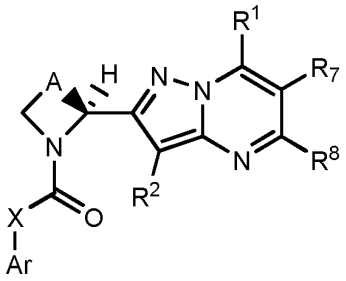
R^{13} yra H arba (C_1-C_8)alkilas;

R^{14} yra H, (C_1-C_8)alkilas, $NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(O)R^{11}$, $NR^{11}C(O)OR^{11}$, $NR^{11}C(O)NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}S(O)_pR^a$, -$NR^{11}S(O)_p(OR^{11})$ arba $NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$; ir kur kiekvienas (C_1-C_8)alkilas, (C_2-C_8)alkenilas, (C_2-C_8)alkinilas, aril(C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8)karbociklilalkilas, esantis kiekviename iš R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^{11} arba R^{12} , nepriklausomai, yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau okso, halogenu, hidroksi, NH_2, CN, N_3, $N(R^a)_2$, NHR^a, SH, SR^a, $S(O)_pR^a$, OR^a, (C_1-C_8)alkil, (C_1-C_8)halogenalkilu, -C(O)Ra, -C(O)H, -C(=O)ORa, -C(=O)OH, -$C(=O)N(R^a)_2$, -C(=O)NHR^a , -$C(=O)NH_2$, $NHS(O)_pR^a$, $NR^aS(O)_pR^a$, $NHC(O)R^a$, $NR^aC(O)R^a$, $NHC(O)OR^a$, $NR^aC(O)OR^a$, $NR^aC(O)NHR^a$, $NR^aC(O)N(R^a)_2$, $NR^aC(O)NH_2$, $NHC(O)NHR^a$, $NHC(O)N(R^a)_2$, NHC(O)NH_2, =NH, =NOH, $=NOR^a$, $NR^aS(O)_pNHR^a$, $NR^aS(O)_pN(R^a)_2$, $NR^aS(O)_pNH_2$, $NHS(O)_pNHR^a$, $NHS(O)_pN(R^a)_2$, NHS(O)$_pNH_2$, -$OC(=O)R^a$, -$OP(O)(OH)_2$ arba R^a.

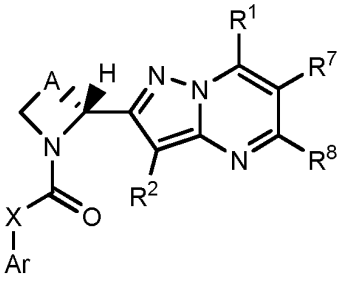
2. Junginys pagal 1punktą, kuris yra junginys, turintis formulę I.

3. Junginys pagal 1 arba 2 punktą, kur kiekvienas R^3 yra H.

4. Junginys pagal 1 punktą, kuris yra junginys, turintis formulę VII arba junginys, turintis formulę VIII:



Formulė VII



Formulė VIII

arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

5. Junginys pagal 4 punktą, kuris yra junginys, turintis formulę VII.

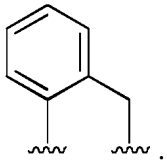
6. Junginys pagal bet kurį iš 1-5 punktą, kur R^2 yra H.

7. Junginys pagal bet kurį iš 1-6 punktą, kur R^7 yra H, halogenas arba (C_1-C_8)alkilas.

8. Junginys pagal bet kurį iš 1-7 punktą, kur n yra 3 arba 4.

9. Junginys pagal bet kurį iš 1-8 punktą, kur kiekvienas R^4 nepriklausomai, yra H arba pasirinktinai pakeistas (C_1-C_8)alkilas, arba keturi R^4 prie gretimų anglies atomų kartu gali sudaryti pasirinktinai pakeistą C_6 arilo žiedą.

10. Junginys pagal bet kurį iš 1-7 punktą, kur A yra -$(CH_2)_3$-, -$(CH_2)_4$-, -CH_2-O-CH_2-, -CH_2-$CH(CH_3)$-CH_2-, -CH_2-$CH(CF_3)$-CH_2-, -CH_2-CH_2-$CH(CH_3)$- arba turi struktūrą:



11. Junginys pagal bet kurį iš 1-7 punktą, kur A yra -$(CH_2)_3$-.

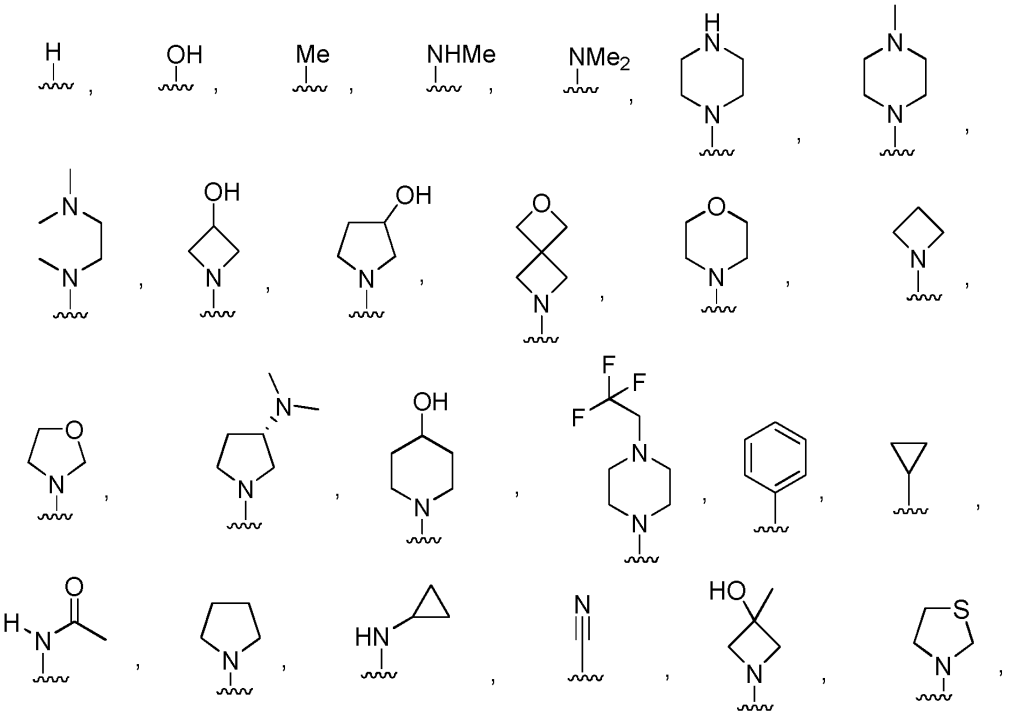
12. Junginys pagal bet kurį iš 1-11 punktą, kur X yra -$CR^{13}(NR^{11}C(O)OR^{11})$-, -$CR^{13}(NR^{11}R^{12})$-, -$CR^{13}(NR^{11}S(O)_pR^a)$- arba X nėra.

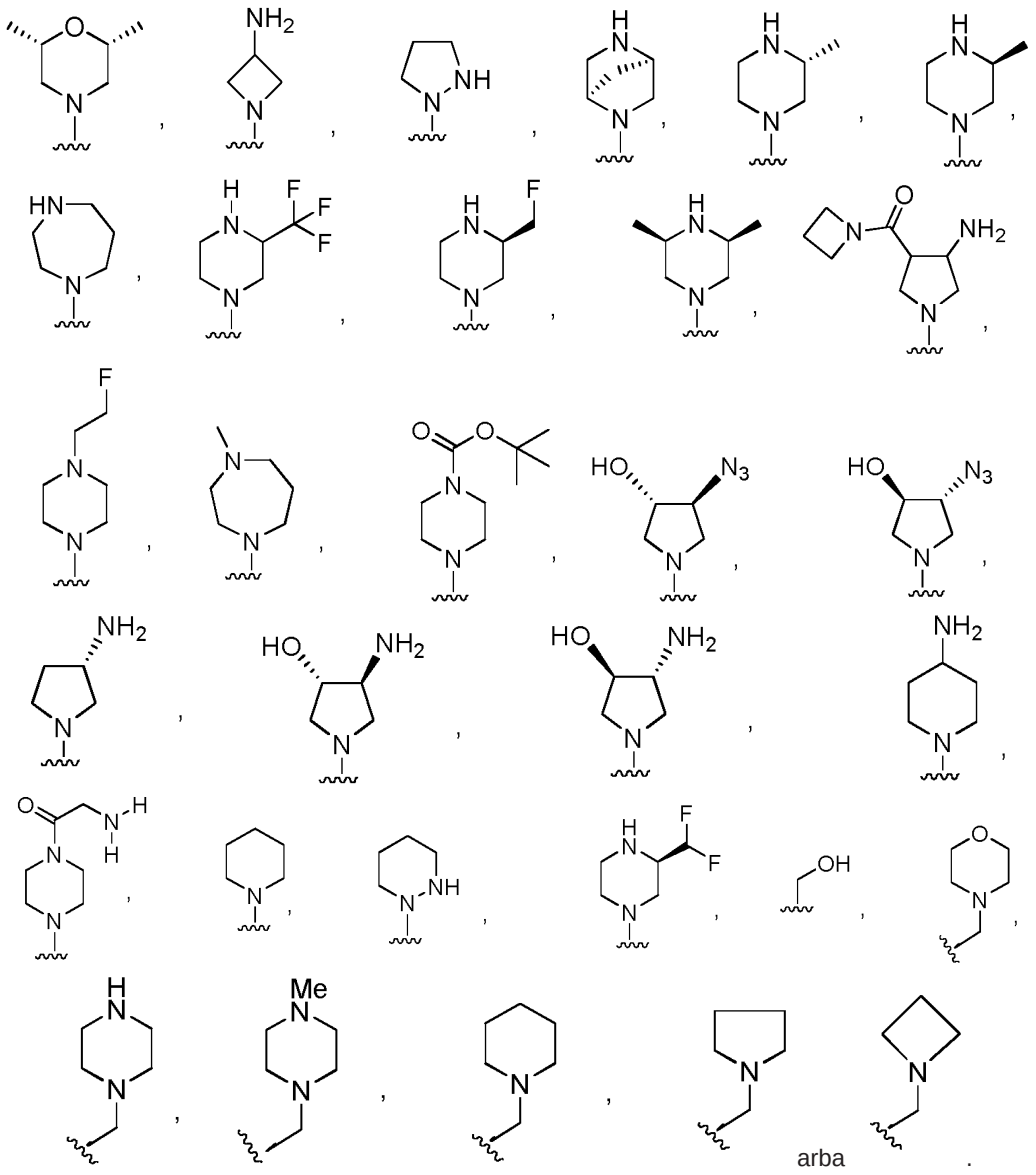
13. Junginys pagal bet kurį iš 1-11 punktą, 1-11 kur X nėra.

14. Junginys pagal bet kurį iš 1-13 punktą, kur R^1 yra H, OR^{11}, $NR^{11}R^{12}$, CN, (C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas arba (C_3-C_7)cikloalkilas, kur bet kuris (C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas arba (C_3-C_7) cikloalkilas, esantys grupėje R^8 , yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau okso, halogenu, hidroksi, NH_2, CN, N_3, $N(Ra)_2$, NHR^a, SH, SR^a, $S(O)_pR^a$, OR^a, (C_1-C_8)alkilu, (C_1-C_8)halogenalkilu, -C(O)R^a, -C(O)H, -C(=O)OR^a, -C(=O)OH, -C(=O)$N(R^a)_2$, -C(=O)NHR^a, -C(=O)NH_2, $NHS(O)_pR^a$, $NR^aS(O)_pR^a$, NHC(O)R^a, $NR^aC(O)R^a$, NHC(O)OR^a, $NR^aC(O)OR^a$, $NR^aC(O)NHR^a$, $NR^aC(O)N(R^a)_2$, $NR^aC(O)NH_2$, NHC(O)NHR^a, NHC(O)$N(R^a)_2$, NHC(O)NH_2, =NH, =NOH, =NOR^a, $NR^aS(O)_pNHR^a$, $NR^aS(O)_pN(R^a)_2$, $NR^aS(O)_pNH_2$, $NHS(O)_pNHR^a$, $NHS(O)_pN(R^a)_2$, $NHS(O)_pNH_2$, -OC(=O)R^a, -OP(O)$(OH)_2$ arba R^a.

15. Junginys pagal bet kurį iš 1-13 punktą, kur R^1 yra H arba C_2-C_{20} heterociklilas, kur bet kuris C_2-C_{20} heterociklilas, esantis grupėje R^1 , yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau okso, halogenu, hidroksi, NH_2, CN, N_3, $N(R^a)_2$, NHR^a, SH, SR^a, $S(O)_pR^a$, OR^a, (C_1-C_8)alkilu, (C_1-C_8)halogenalkilu, -C(O)R^a, -C(O)H, -C(=O)OR^a, -C(=O)OH, -C(=O)$N(R^a)_2$, -C(=O)NHR^a , -C(=O)NH_2, $NHS(O)_pR^a$, $NR^aS(O)_pR^a$, NHC(O)R^a, $NR^aC(O)R^a$, NHC(O)OR^a, $NR^aC(O)OR^a$, $NR^aC(O)NHR^a$, $NR^aC(O)N(R^a)_2$, $NR^aC(O)NH_2$, NHC(O)NHR^a, NHC(O)$N(R^a)_2$, NHC(O)NH_2, =NH, =NOH, =NOR^a, $NR^aS(O)_pNHR^a$, $NR^aS(O)_pN(R^a)_2$, $NR^aS(O)_pNH_2$, $NHS(O)_pNHR^a$, $NHS(O)_pN(R^a)_2$, $NHS(O)_pNH_2$, -OC(=O)R^a, -OP(O)$(OH)_2$ arba R^a.

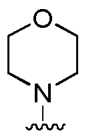
16. Junginys pagal bet kurį iš 1-13 punktą, kur R^1 yra parinktas iš:





arba .

17. Junginys pagal bet kurį iš 1-13 punktą, kur R^1 yra H arba:



.

18. Junginys pagal bet kurį iš 1-17 punktą, kur Ar yra C_6-C_{20} arilo grupė, kur C_6-C_{20} arilo grupė yra pasirinktinai pakeista 1-5 grupėmis R^6.

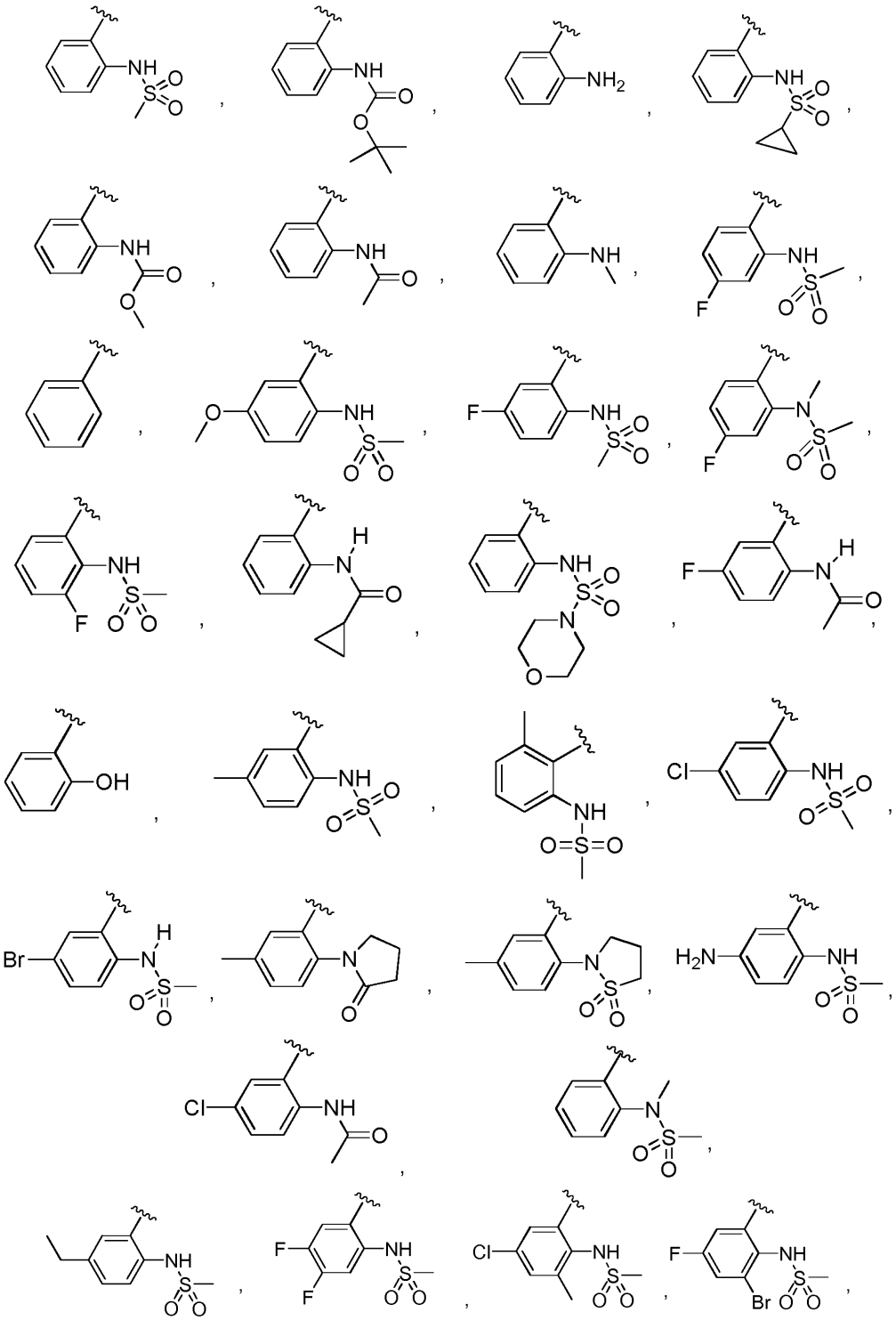
19. Junginys pagal bet kurį iš 1-17 punktą, kur Ar yra fenilas, pasirinktinai pakeistas 1-5 grupėmis R^6.

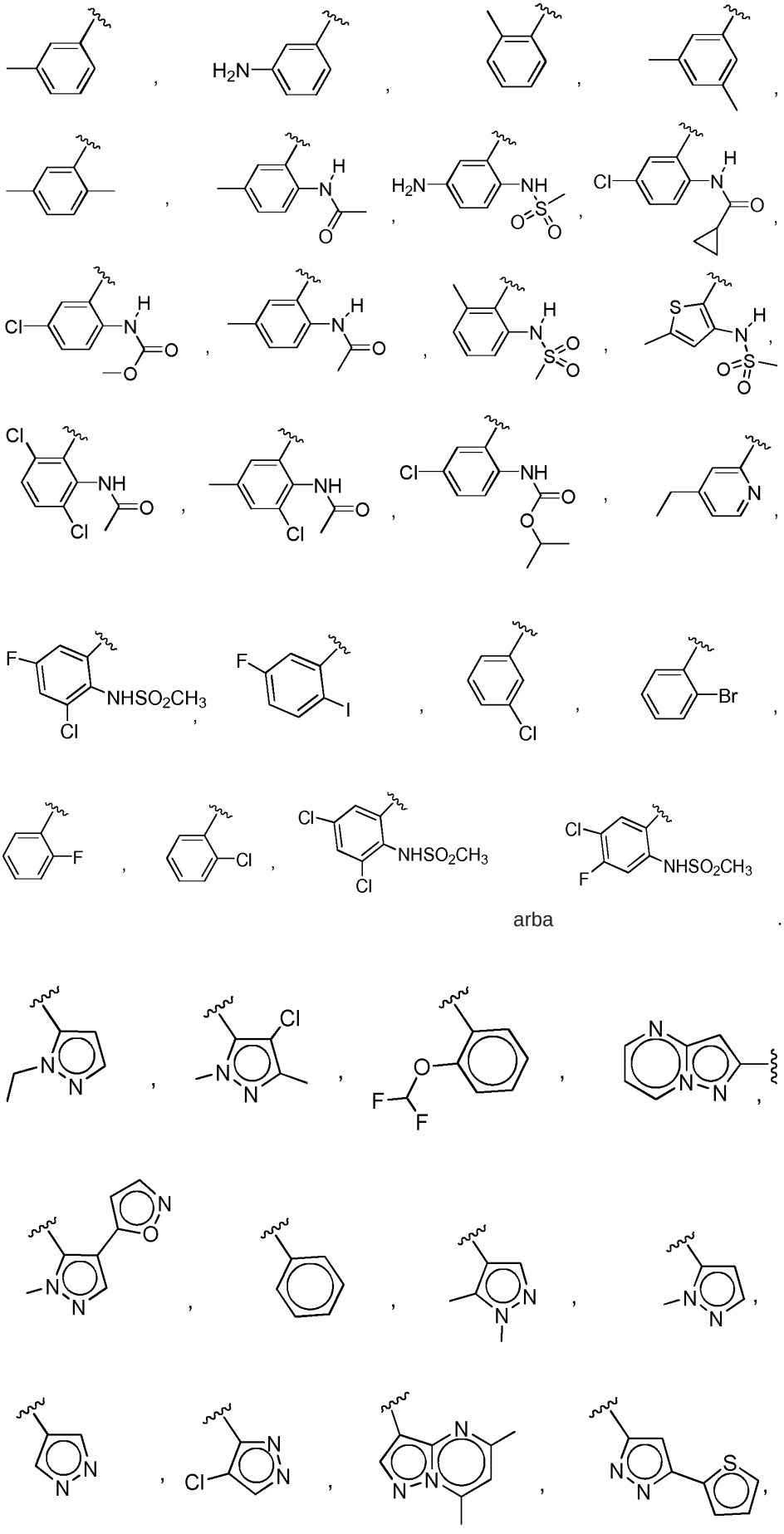
20. Junginys pagal bet kurį iš 1-19 punktą, kur kiekvienas R^6 nepriklausomai, yra parinktas iš OR^{11}, $NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(O)R^{11}$, $NR^{11}C(O)OR^{11}$, CN, $NR^{11}S(O)_pR^a$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$, halogeno, $(C_1$-$C_8)$alkilo, $(C_2$-$C_8)$alkinilo, C_6-C_{20} arilo, C_2-C_{20} heterociklilo ir $(C_3$-$C_7)$cikloalkilo, kur bet kuris C_1-$C_8)$alkilas, $(C_2$-$C_8)$alkinilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas ir $(C_3$-$C_7)$cikloalkilas, esantis R^6 grupėje, yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau okso, halogenu, hidroksi, NH_2, CN, N_3, $N(R^a)_2$, NHR^a, SH, SR^a, $S(O)_pR^a$, OR^a, $(C_1$-$C_8)$alkilu, $(C_1$-$C_8)$halogenalkilu, $-C(O)R^a$, -C(O)H,

-C(=O)OR^a, -C(=O)OH, -C(=O)N(R^a)$_2$, -C(=O)NHR^a , -C(=O)NH$_2$, NHS(O)$_p$R^a, NR^{a}S(O)$_p$R^a, NHC(O)R^a, NR^{a}C(O)R^a, NHC(O)OR^a, NR^{a}C(O)OR^a, NR^{a}C(O)NHR^a, NR^{a}C(O)N(R^a)$_2$, NR^{a}C(O)NH$_2$, NHC(O)NHR^a, NHC(O)N(R^a)$_2$, NHC(O)NH$_2$, =NH, =NOH, =NOR^a, NR^{a}S(O)$_p$NHR^a, NR^{a}S(O)$_p$N(R^a)$_2$, NR^{a}S(O)$_p$NH$_2$, NHS(O)$_p$NHR^a, NHS(O)$_p$N(R^a)$_2$, NHS(O)$_p$NH$_2$, -OC(=O)R^a, -OP(O)(OH)$_2$ arba R^a.

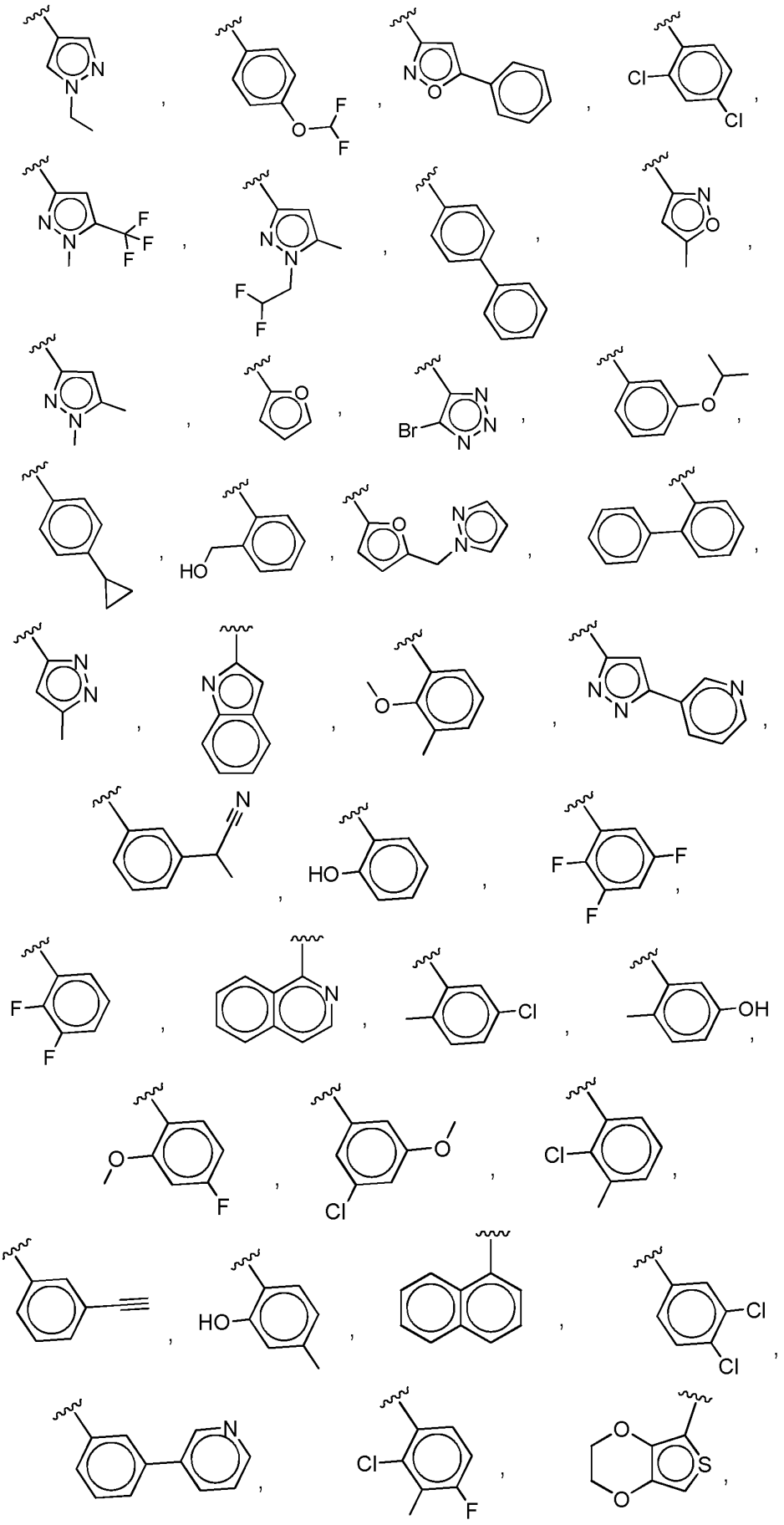
21. Junginys pagal bet kurį iš 1-19 punktą, kur kiekvienas R^6, nepriklausomai, yra parinktas iš NR^{11}S(O)$_p$R^a, NR^{11}C(O)OR^{11}, NR^{11}C(O)R^{11}, (C$_1$-C$_8$)alkilo ir halogeno.

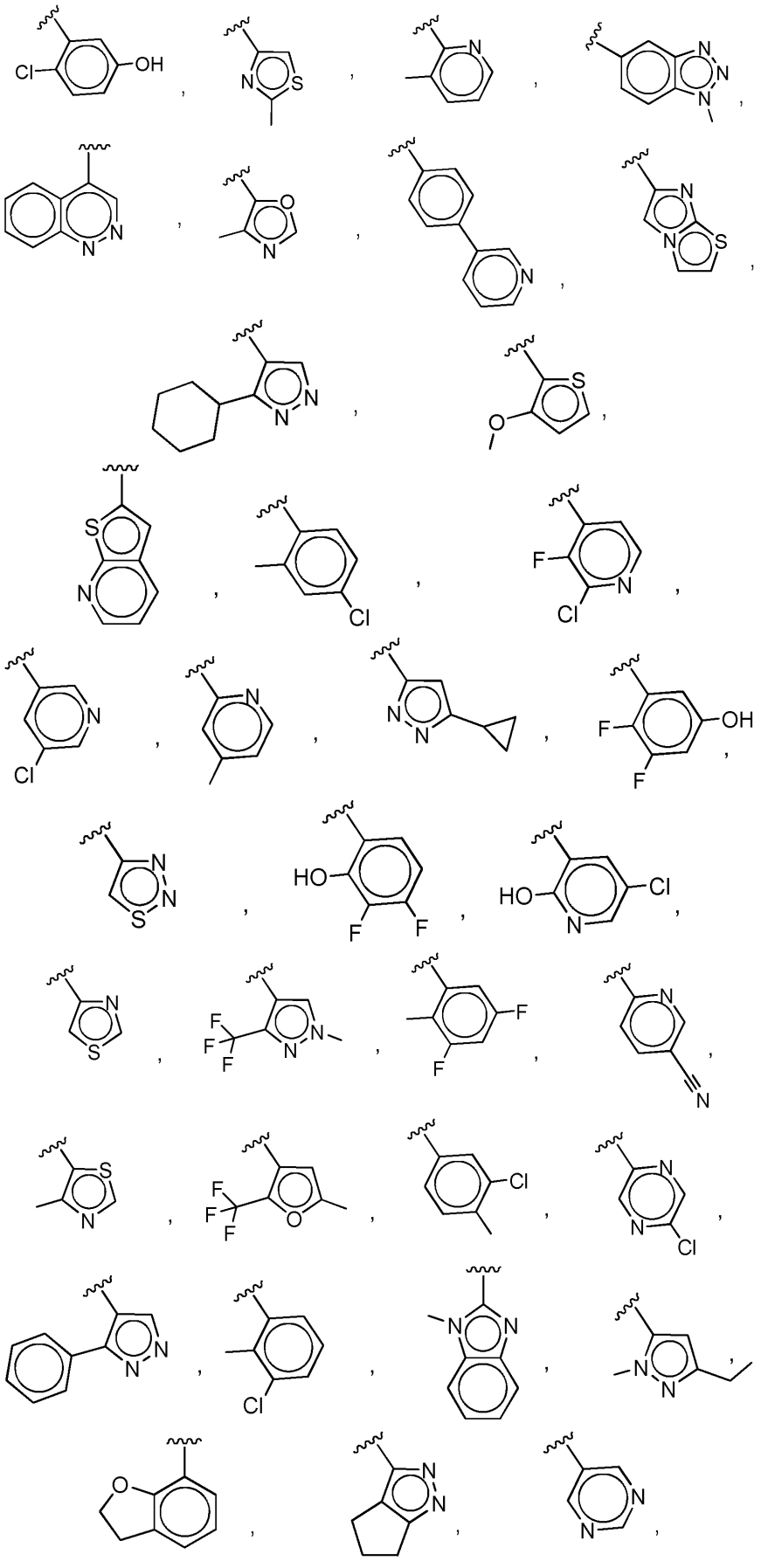
22. Junginys pagal bet kurį iš 1-17 punktą, kur Ar yra:

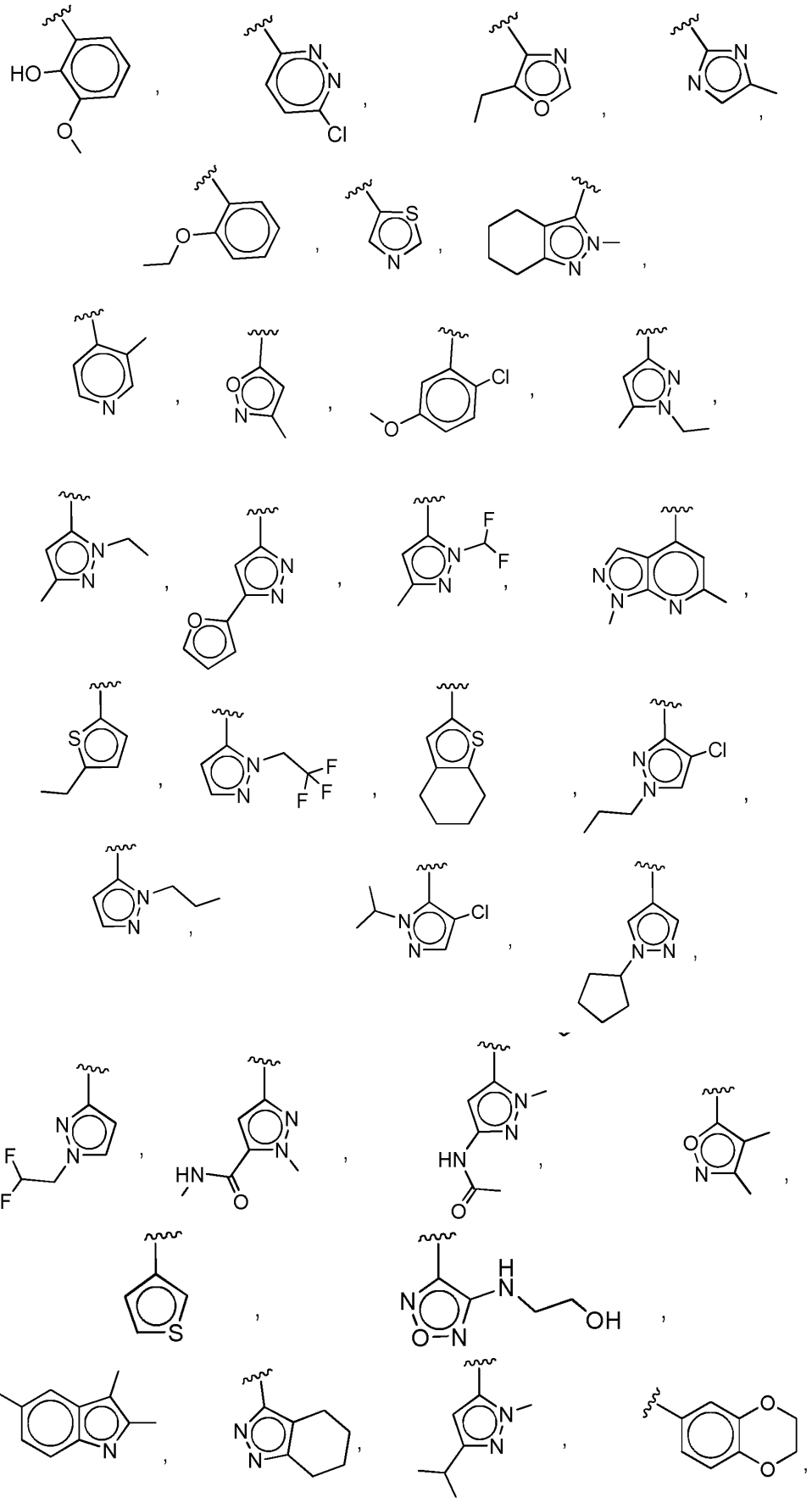


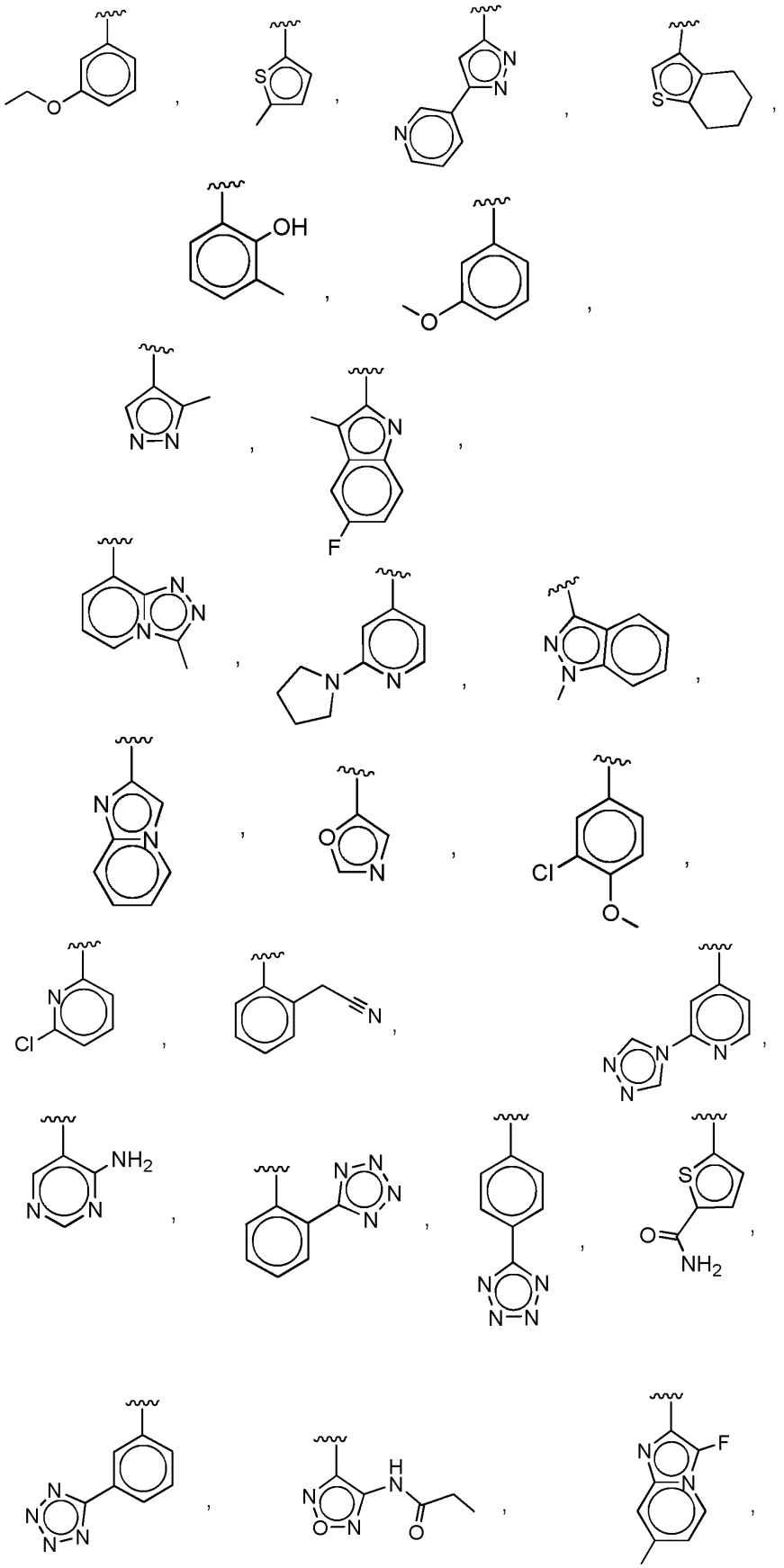


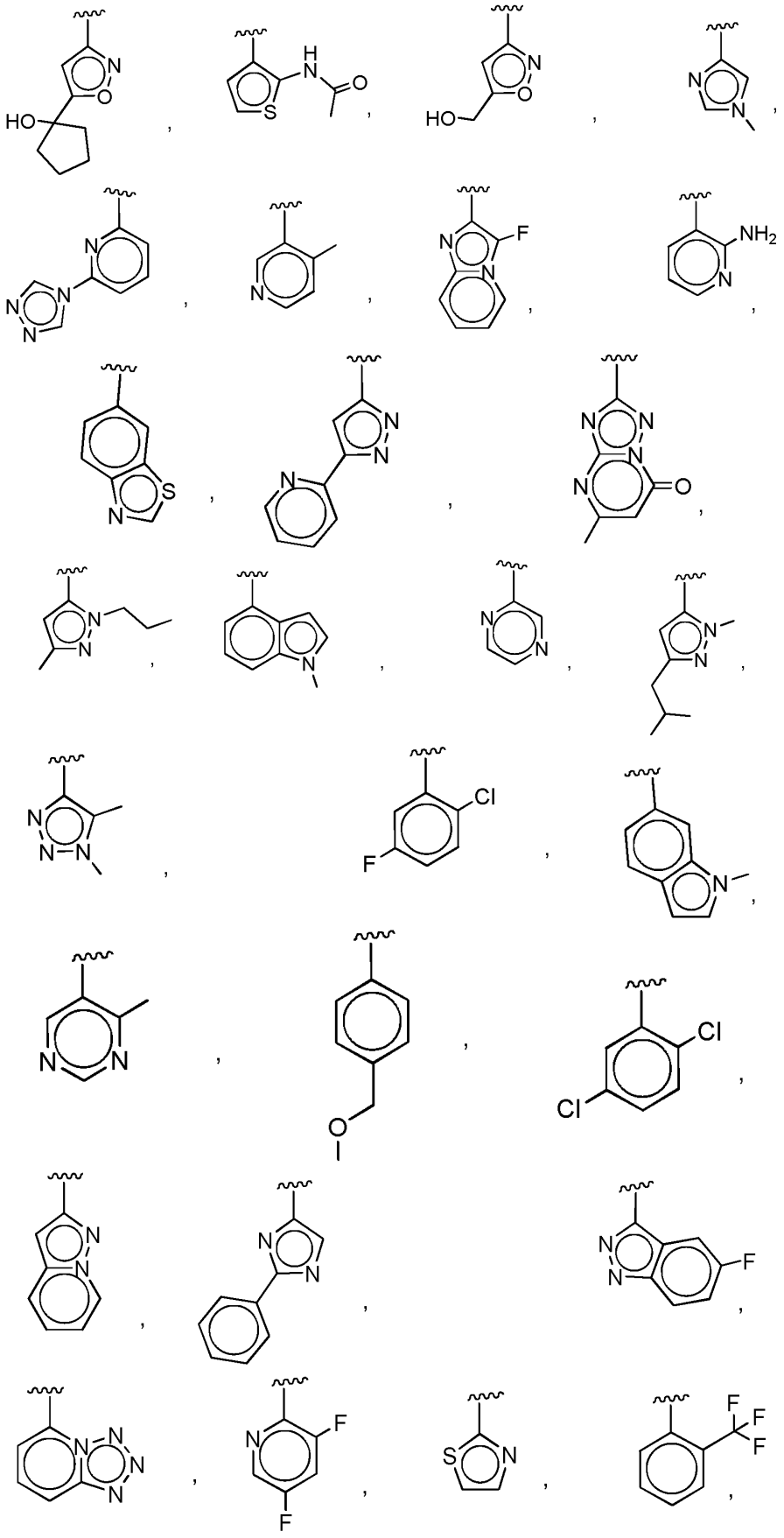
arba

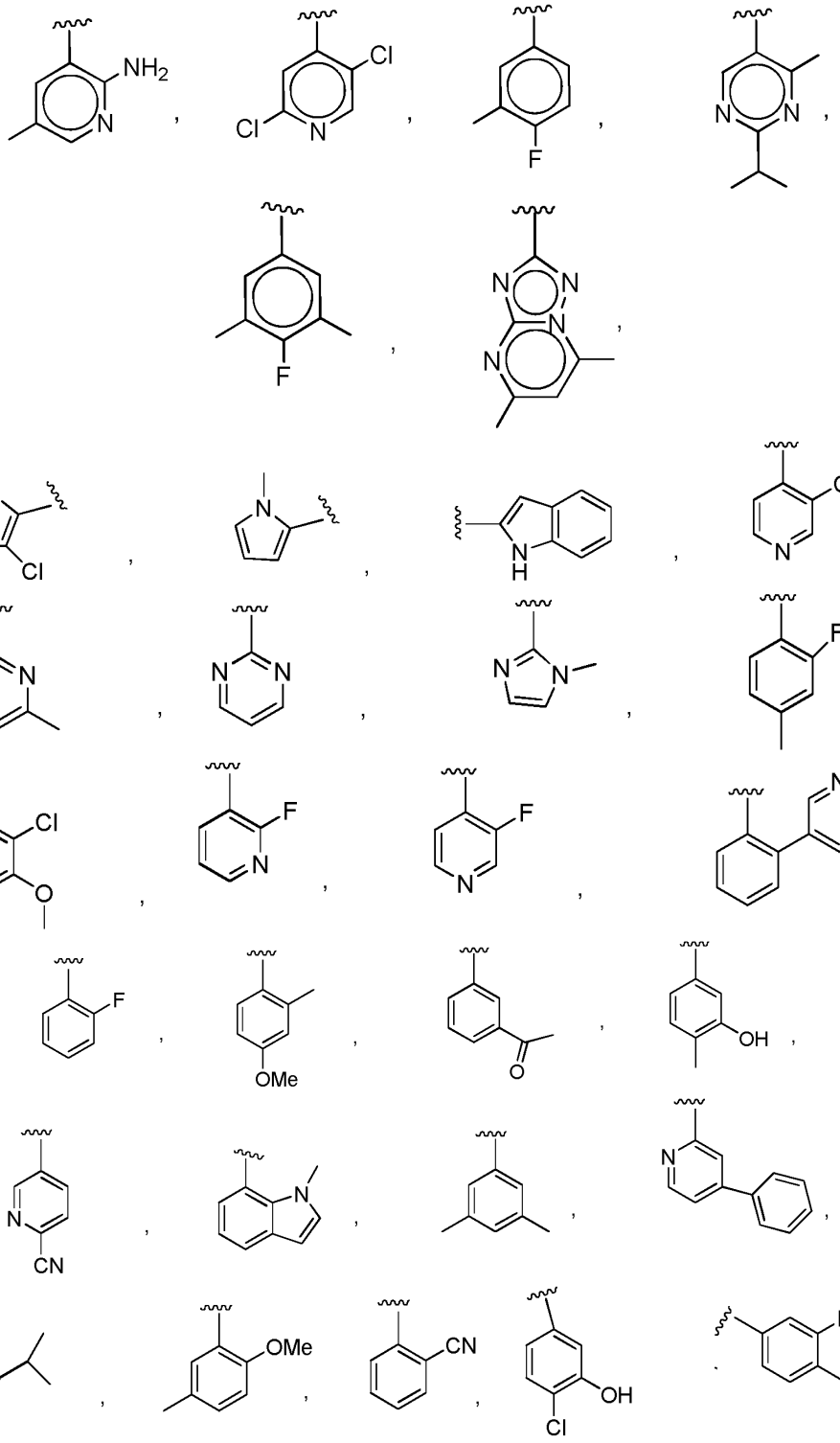






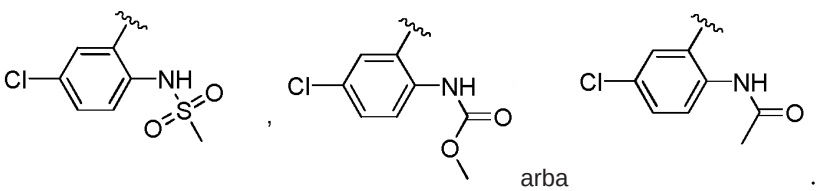






arba .

23. Junginys pagal bet kurį iš 1-17 punktą, kur Ar yra:



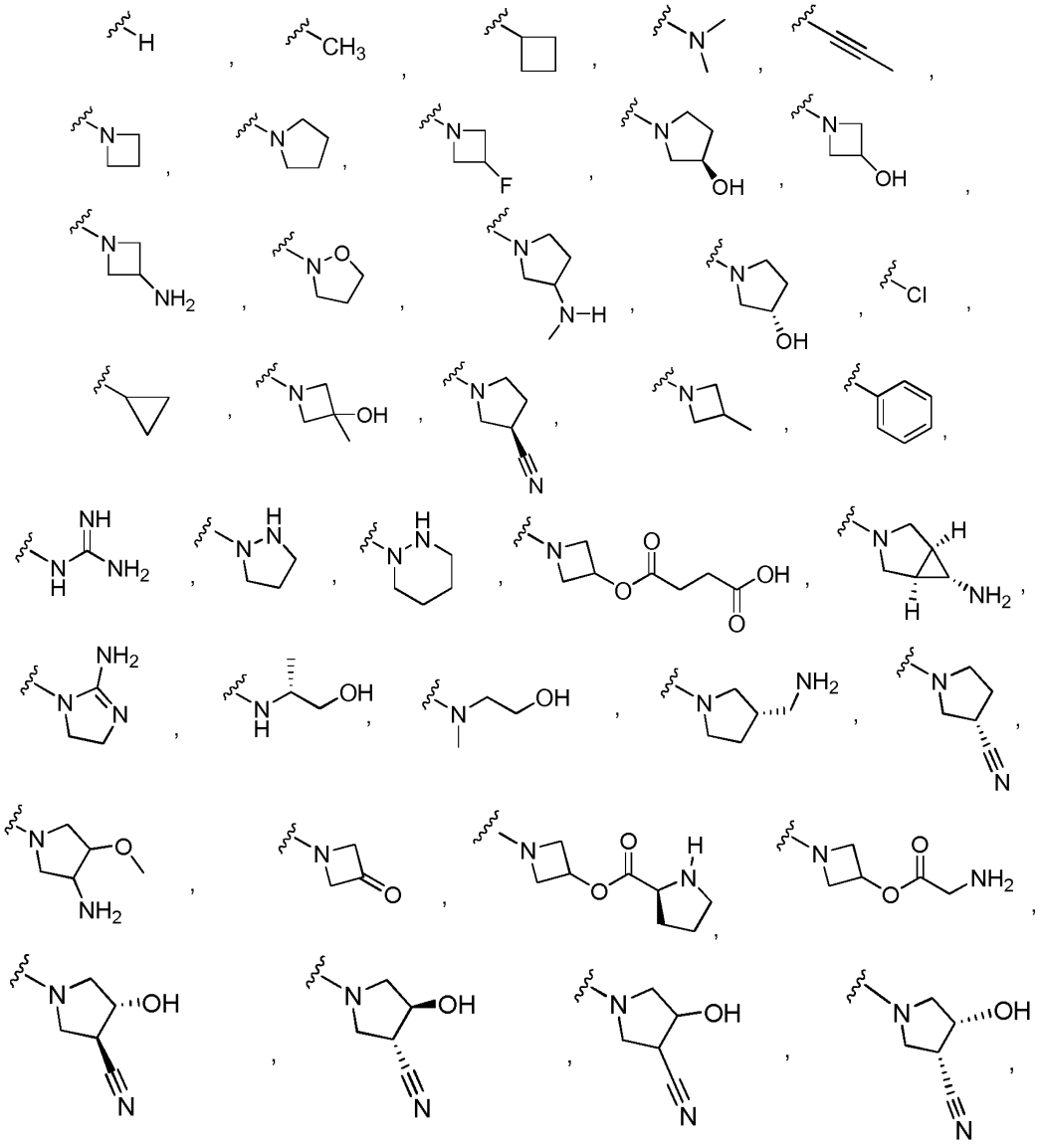
arba .

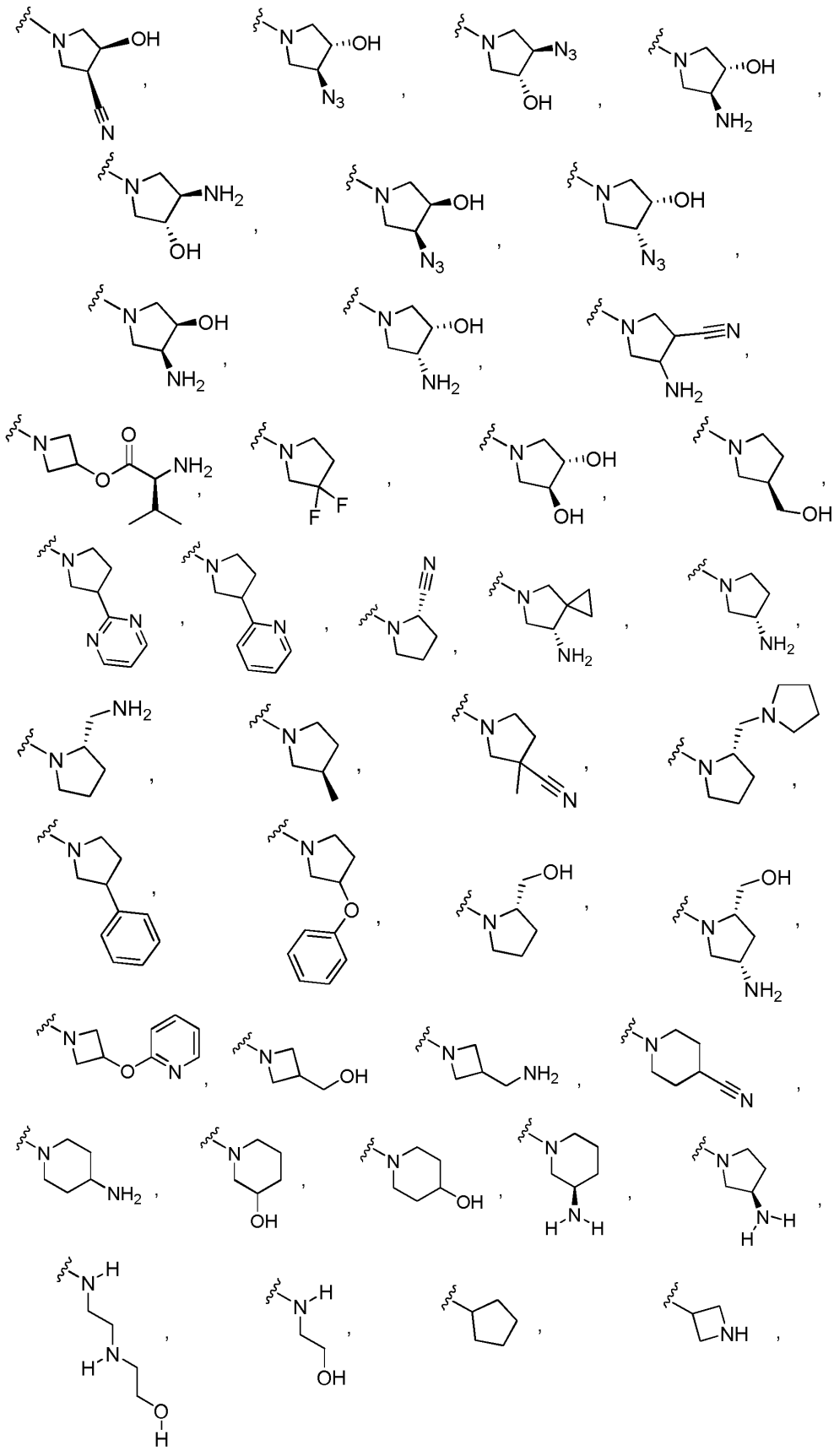
24. Junginys pagal bet kurį iš 1-23 punktą, kur R^8 yra H, $NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(=NR^{11})NR^{11}R^{12}$, halogenas, $(C_1$-$C_8)$alkilas, $(C_2$-$C_8)$alkinilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas arba $(C_3$-$C_7)$cikloalkilas, kur bet kuris $(C_1$-$C_8)$alkilas, $(C_2$-$C_8)$ alkinilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas arba $(C_3$-$C_7)$cikloalkilas, esantys grupėje R^8, yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau okso, halogenu, hidroksi, NH_2, CN, N_3, $N(R^a)_2$, NHR^a, SH, SR^a, $S(O)_pR^a$, OR^a, $(C_1$-$C_8)$alkilu, $(C_1$-$C_8)$halogenalkilu, -C(O)R^a, -C(O)H, -C(=O)OR^a, -C(=O)OH, -C(=O)$N(R^a)_2$, -C(=O)NHR^a , -C(=O)NH_2, $NHS(O)_pR^a$, $NR^aS(O)_pR^a$, NHC(O)R^a, $NR^aC(O)R^a$, NHC(O)OR^a, $NR^aC(O)OR^a$, $NR^aC(O)NHR^a$, $NR^aC(O)N(R^a)_2$, $NR^aC(O)NH_2$, $NHC(O)NHR^a$, $NHC(O)N(R^a)_2$, $NHC(O)NH_2$, =NH, =NOH, =NOR^a, $NR^aS(O)_pNHR^a$, $NR^aS(O)_pN(R^a)_2$, $NR^aS(O)_pNH_2$, $NHS(O)_pNHR^a$, $NHS(O)_pN(R^a)_2$, $NHS(O)_pNH_2$, -OC(=O)R^a, $-OP(O)(OH)_2$ arba R^a.

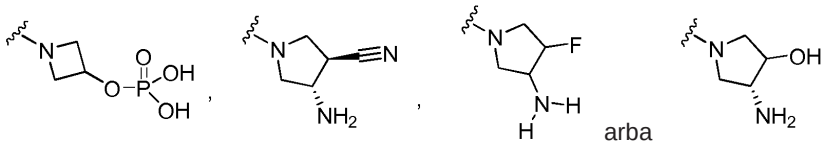
25. Junginys pagal bet kurį iš 1-23 punktą, kur R^8 yra C_2-C_{20} heterociklilas, kur C_2-C_{20} heterociklilas yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau okso, halogenu, hidroksi, NH_2, CN, N_3, $N(R^a)_2$, NHR^a, SH, SR^a, $S(O)_pR^a$, OR^a, $(C_1$-$C_8)$alkilu, $(C_1$-$C_8)$halogenalkilu, -C(O)R^a, -C(O)H, -C(=O)OR^a, -C(=O)OH, -C(=O)$N(R^a)_2$, -C(=O)NHR^a , -C(=O)NH_2, $NHS(O)_pR^a$, $NR^aS(O)_pR^a$, NHC(O)R^a, $NR^aC(O)R^a$, NHC(O)OR^a, $NR^aC(O)OR^a$, $NR^aC(O)NHR^a$, $NR^aC(O)N(R^a)_2$, $NR^aC(O)NH_2$, $NHC(O)NHR^a$, $NHC(O)N(R^a)_2$, $NHC(O)NH_2$, =NH, =NOH, =NOR^a, $NR^aS(O)_pNHR^a$, $NR^aS(O)_pN(R^a)_2$, $NR^aS(O)_pNH_2$, $NHS(O)_pNHR^a$, $NHS(O)_pN(R^a)_2$, $NHS(O)_pNH_2$, -OC(=O)R^a, $-OP(O)(OH)_2$ arba R^a.

26. Junginys pagal bet kurį iš 1-23 punktą, kur R^8 yra pirolidinilas arba azetidinilas, kur pirolidinilas arba azetidinilas yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau hidroksi, NH_2, CN arba $-OP(O)(OH)_2$.

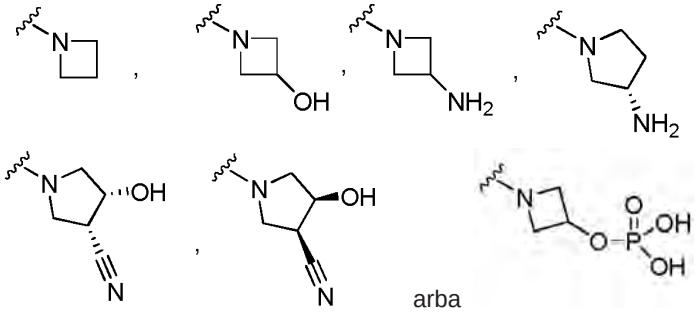
27. Junginys pagal bet kurį iš 1-23 punktą, kur R^8 yra :



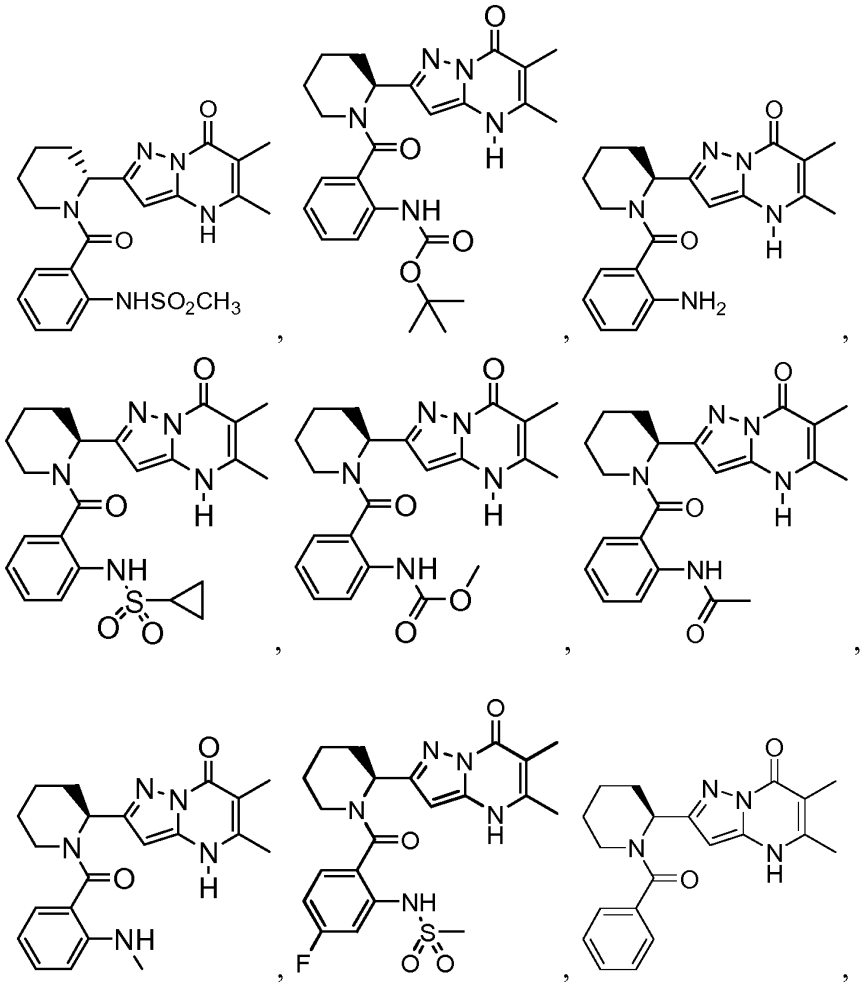


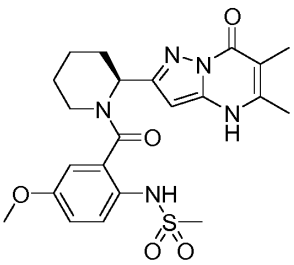
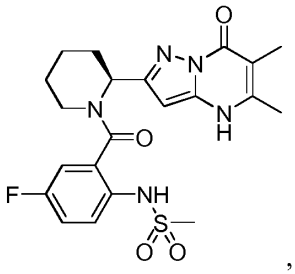
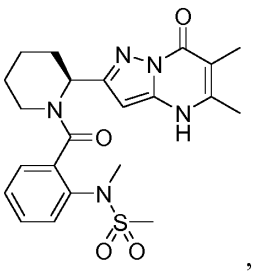
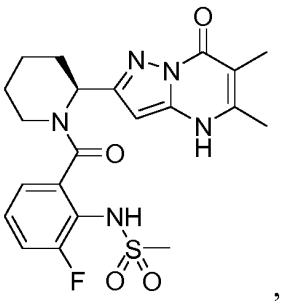
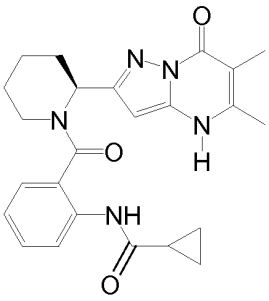
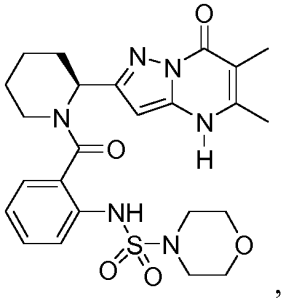
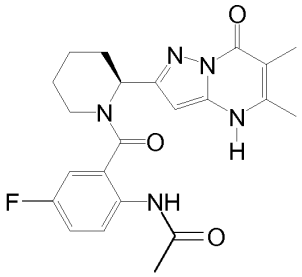
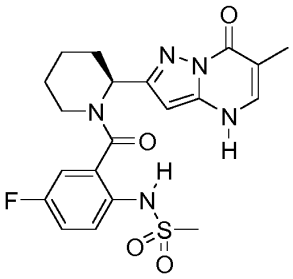
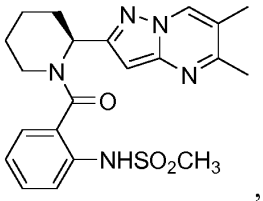
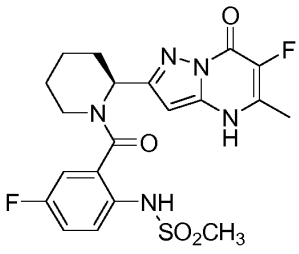
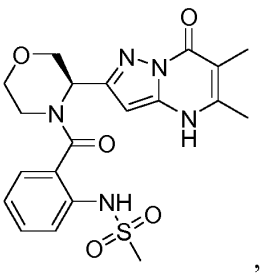
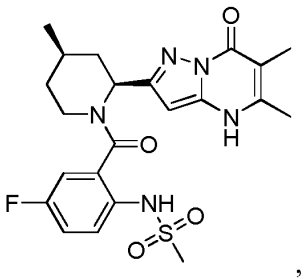
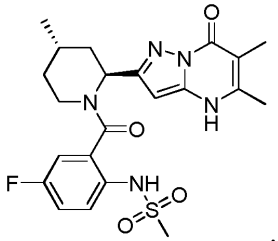
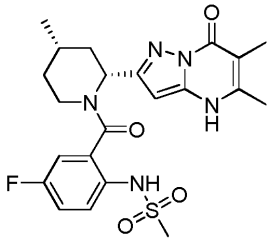
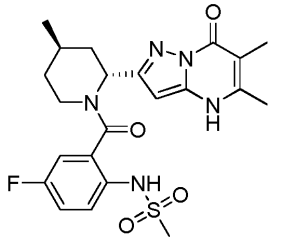
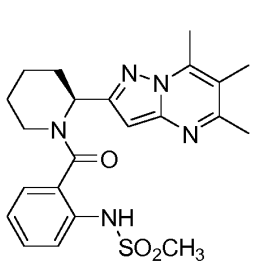
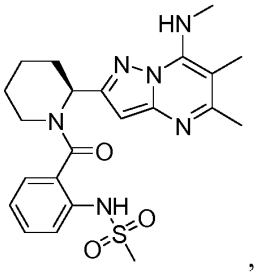
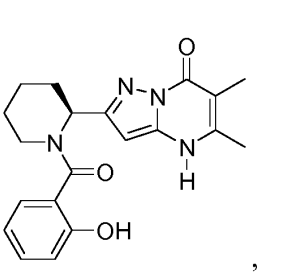

arba

28. Junginys pagal bet kurį iš 1-23 punktą, kur R^8 yra:

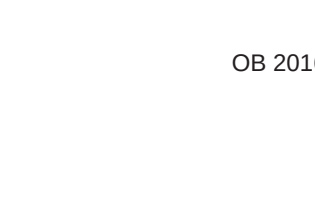

arba

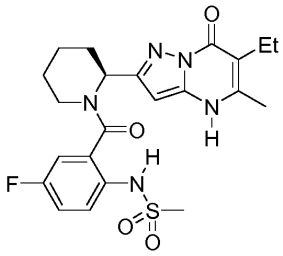
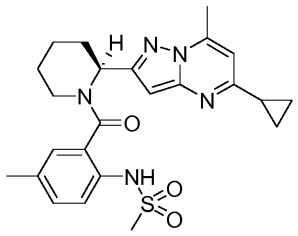
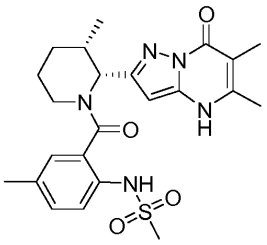
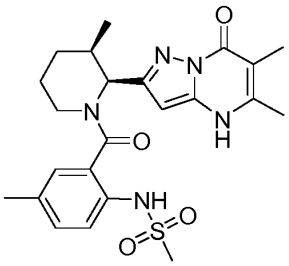
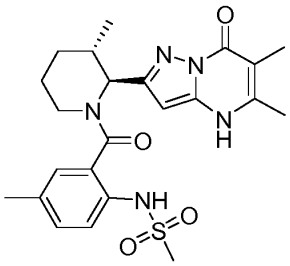
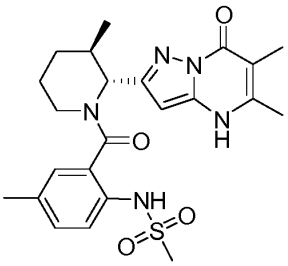
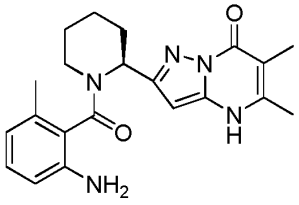
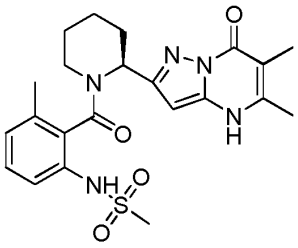
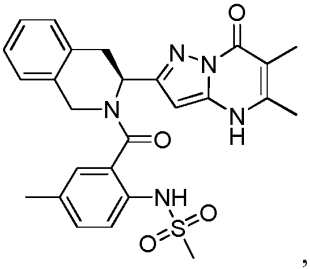
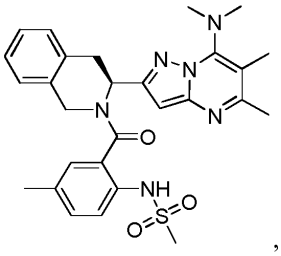
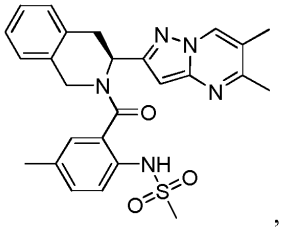
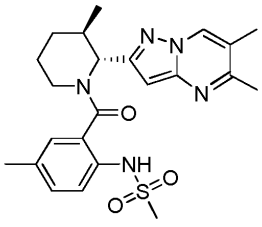
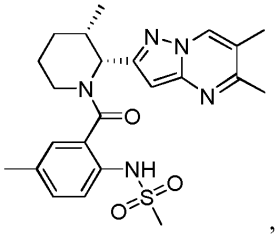
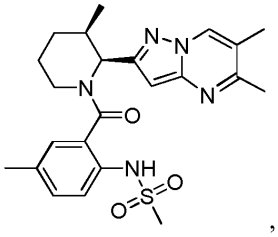
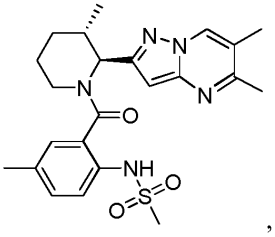
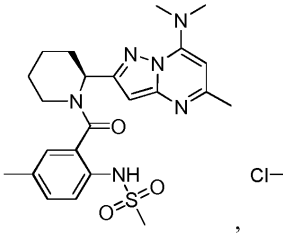
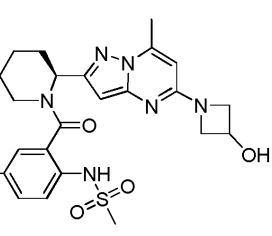
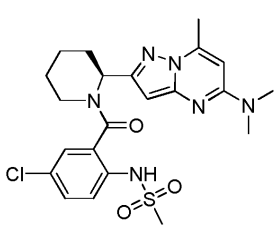
29. Junginys pagal 1 punktą, parinktas iš grupės, susidedančios iš:




,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

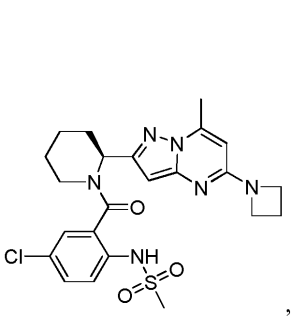
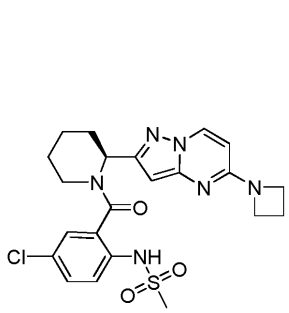
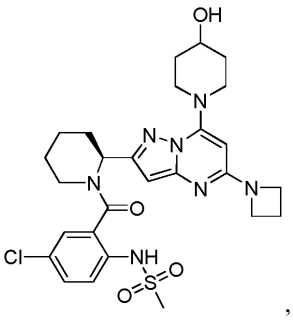
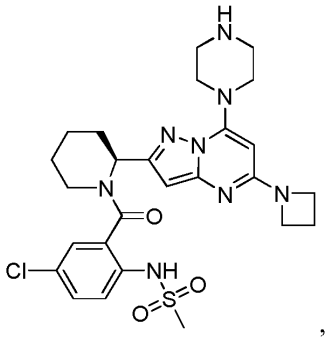
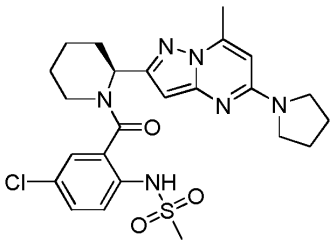
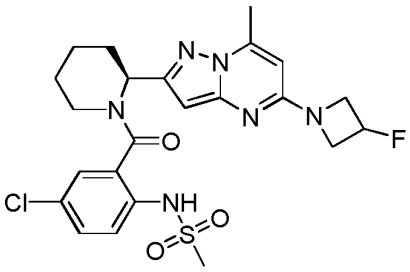
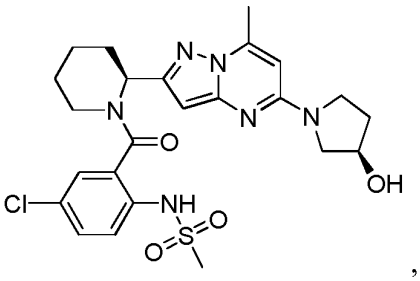
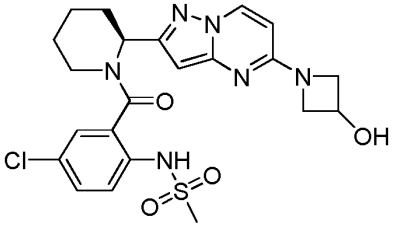
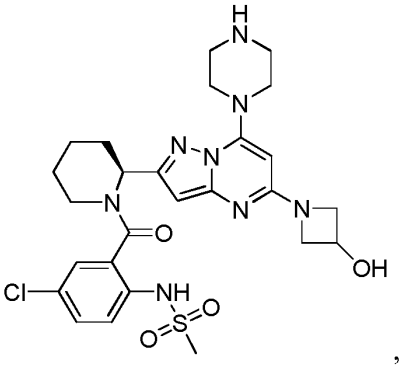
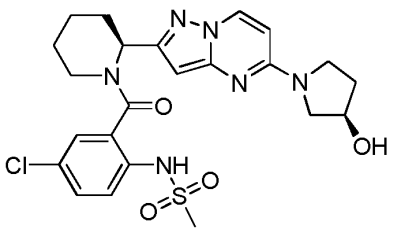
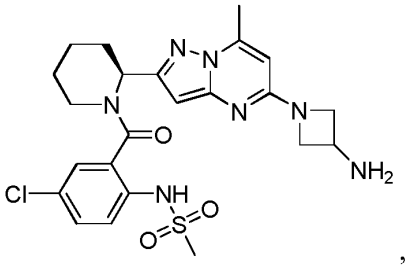
,

,

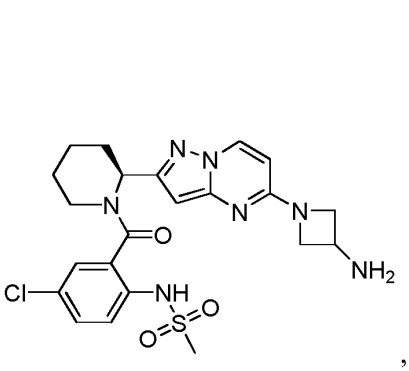
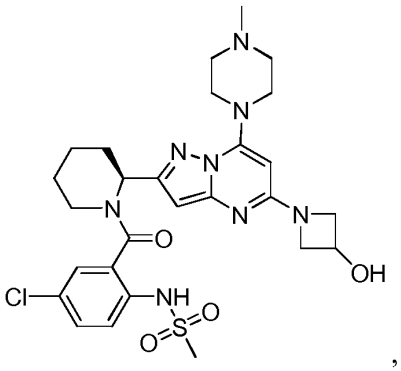
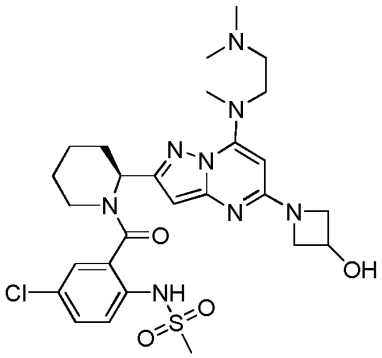
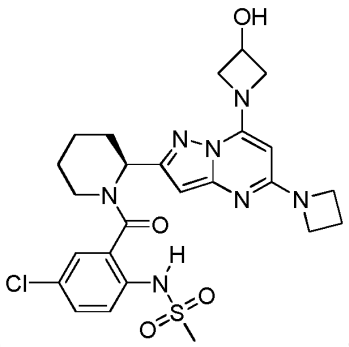
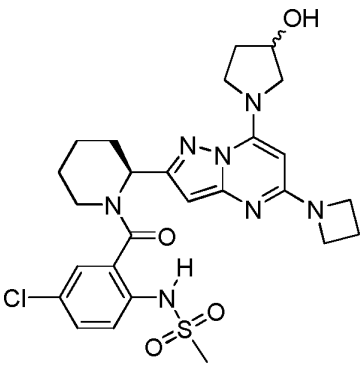
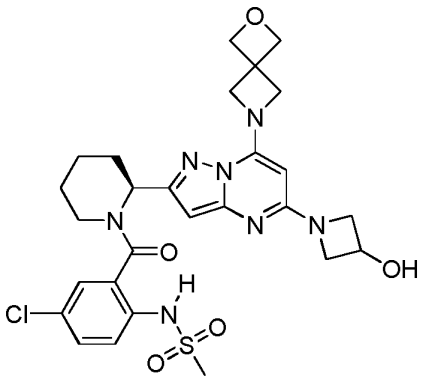
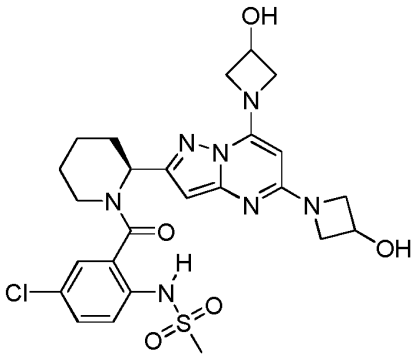
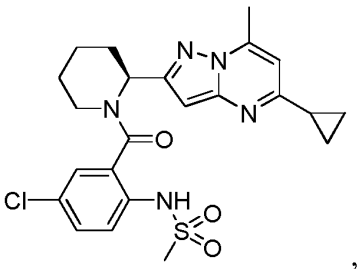
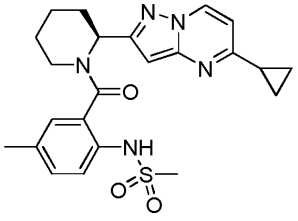
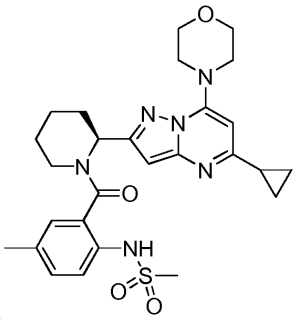
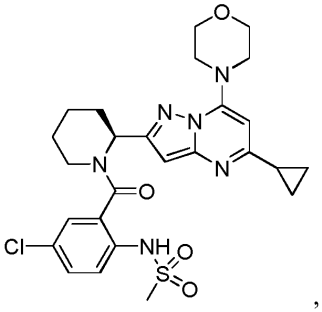

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

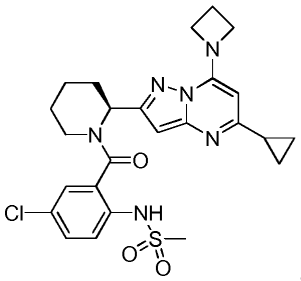
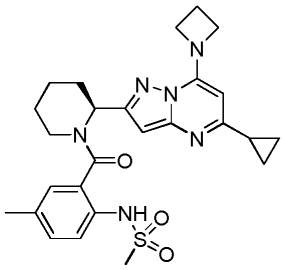
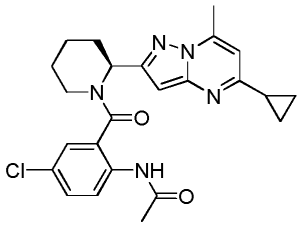
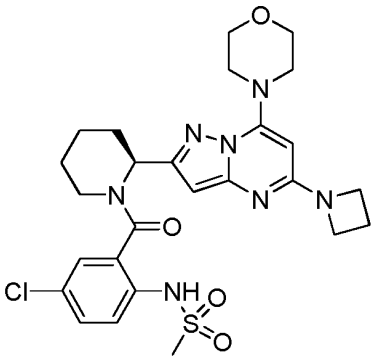
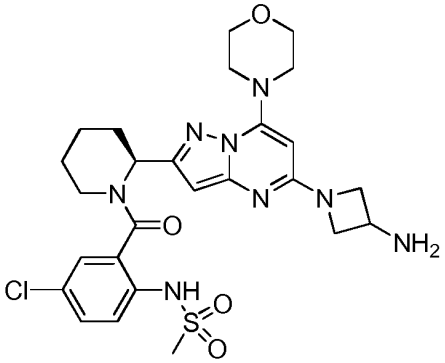
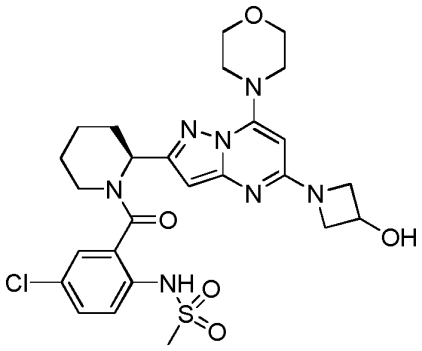
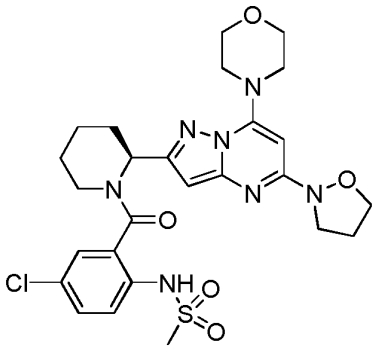
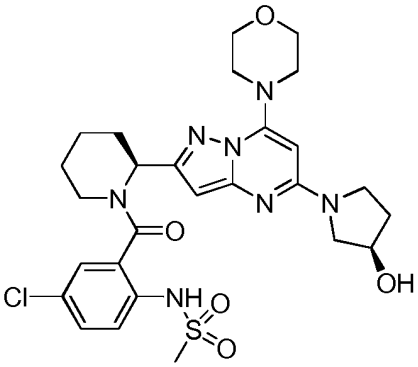
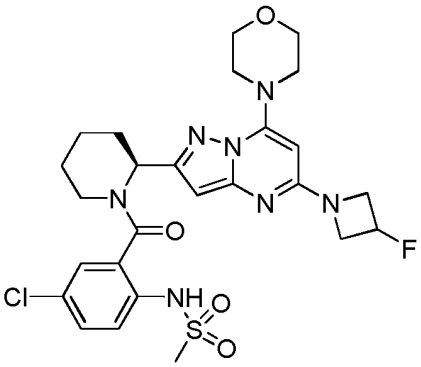
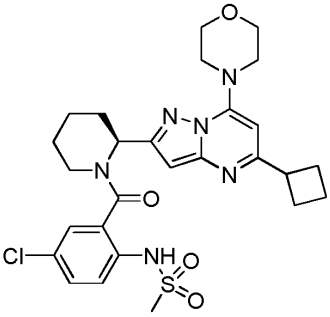
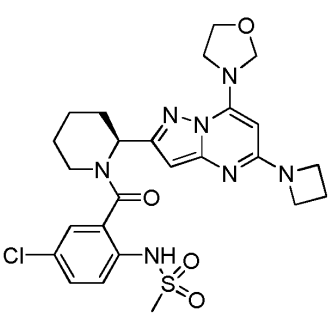
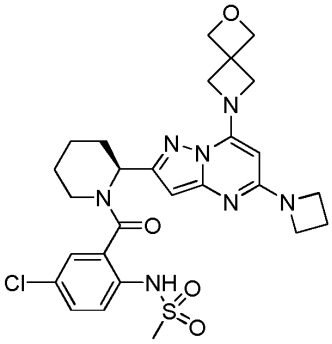
,

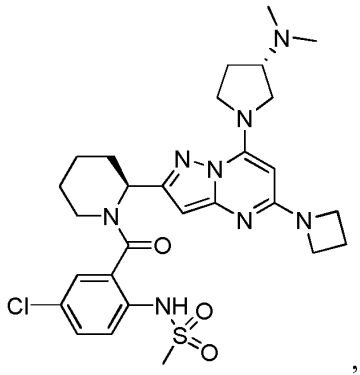
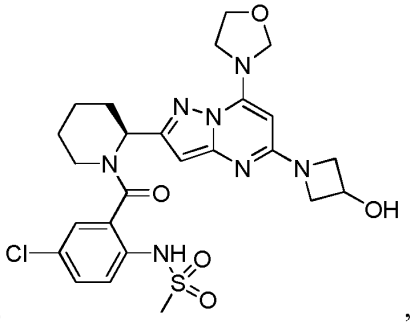
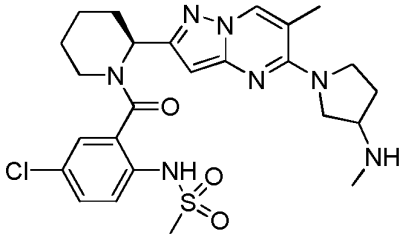
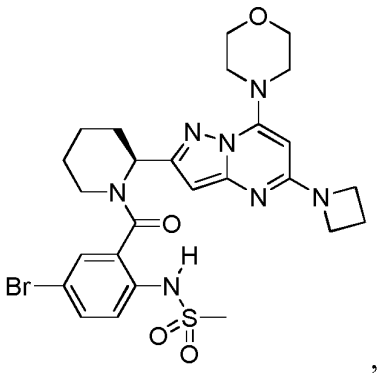
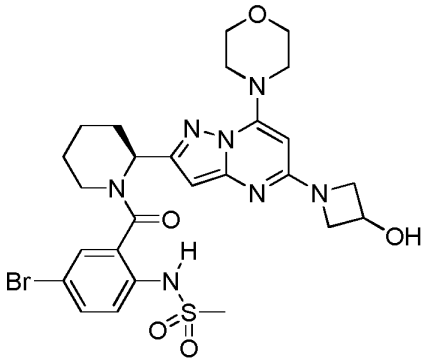
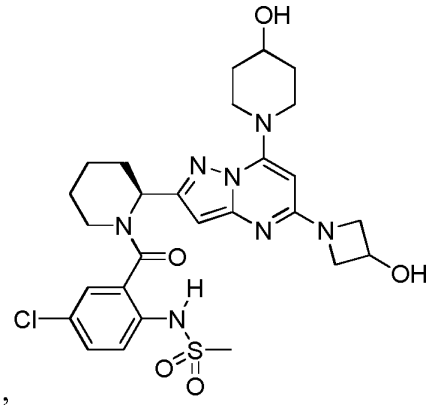
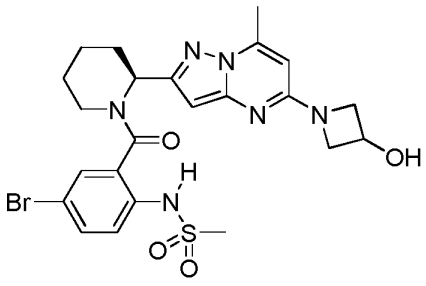
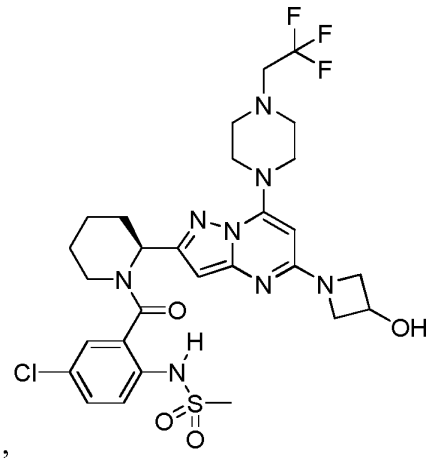
,

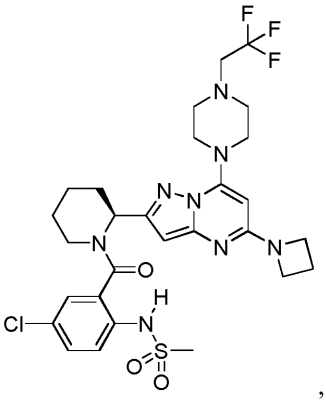
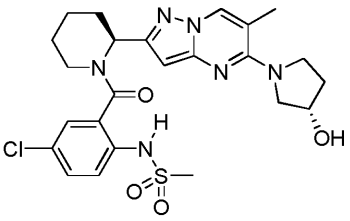
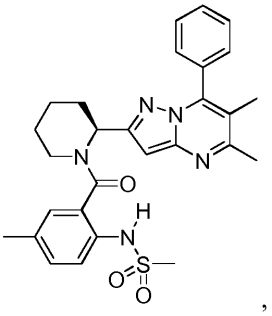
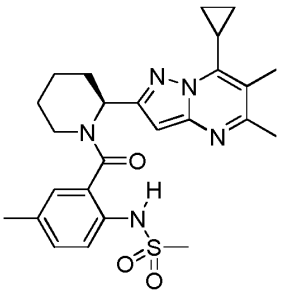
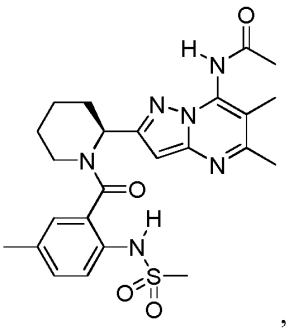
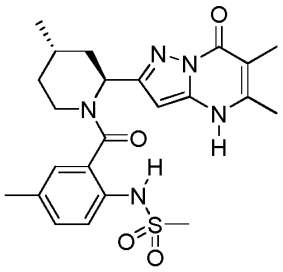
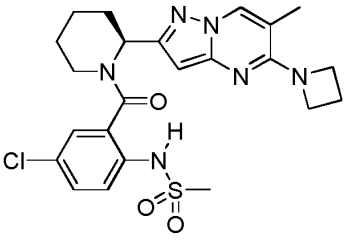
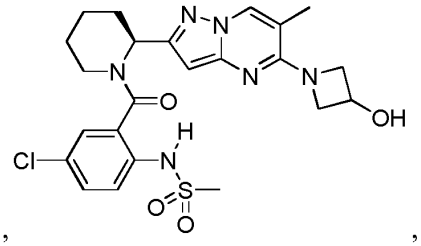
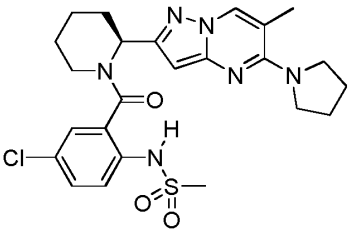
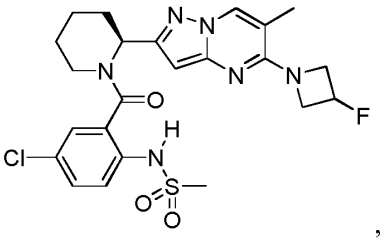
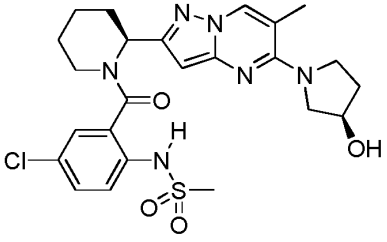
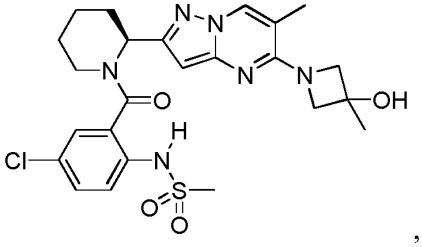
,

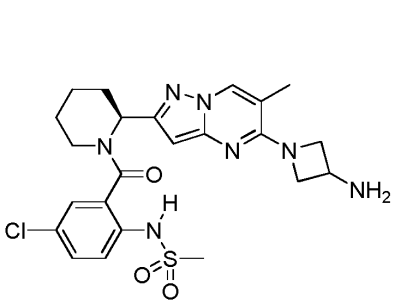
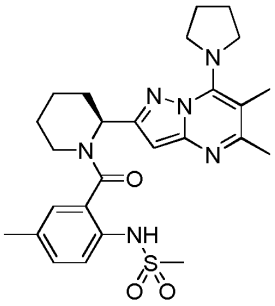
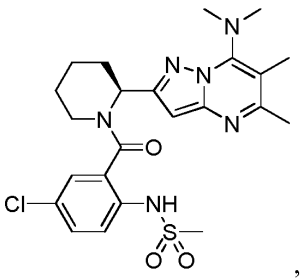
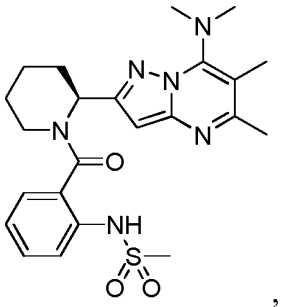
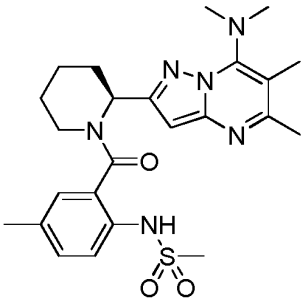
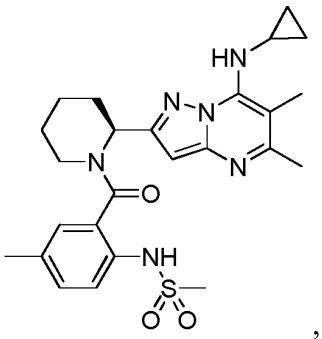
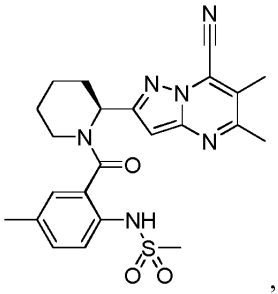
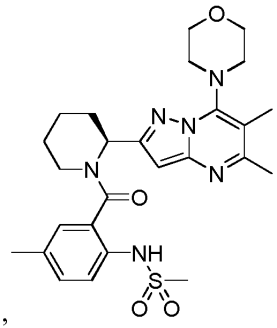
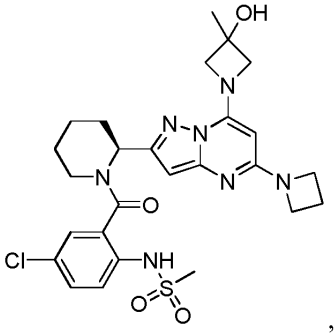
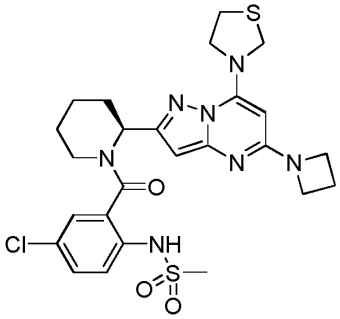
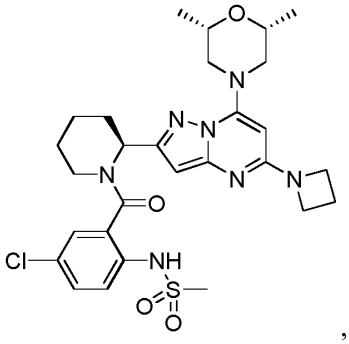
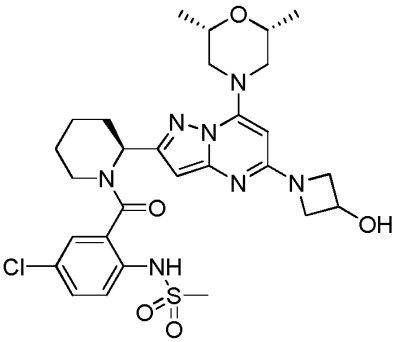
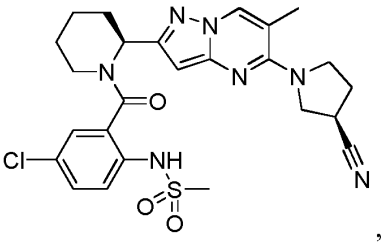

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

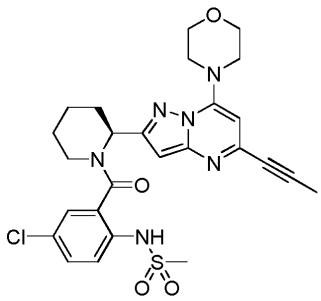
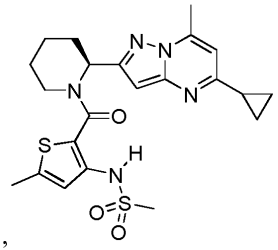
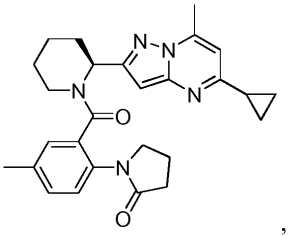
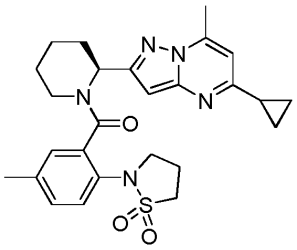
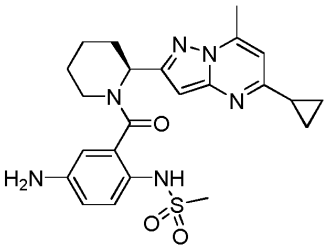
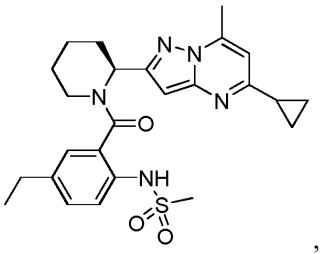
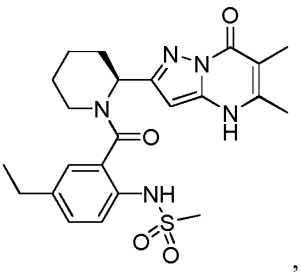
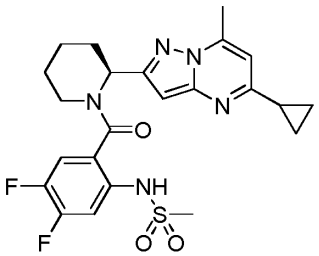
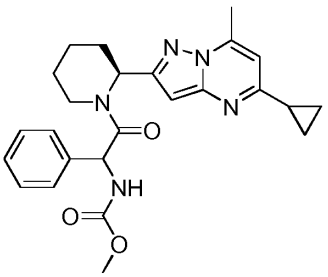
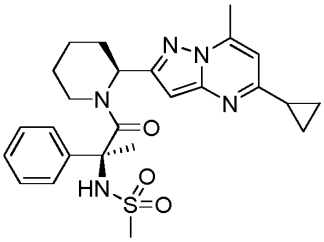
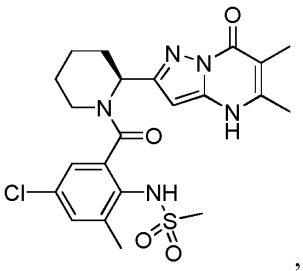
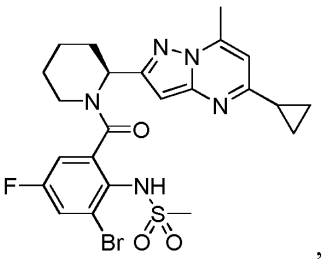
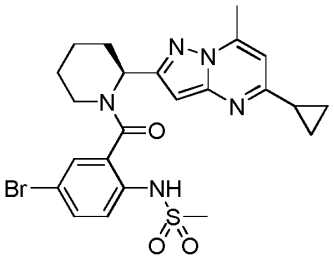
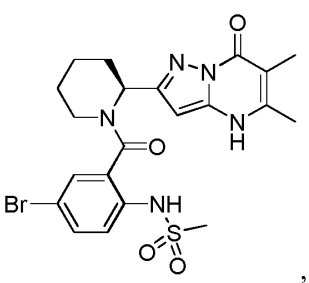
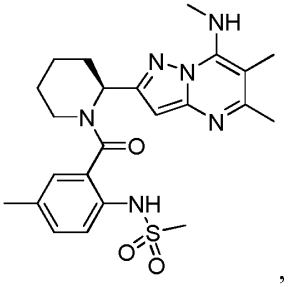
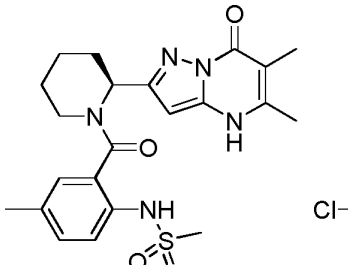
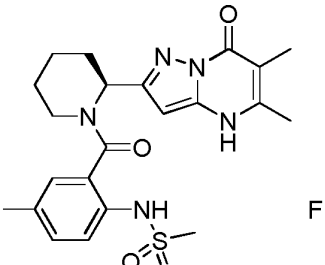
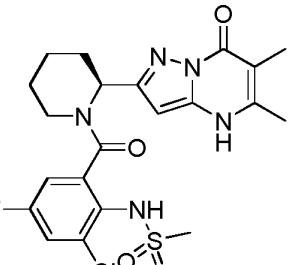
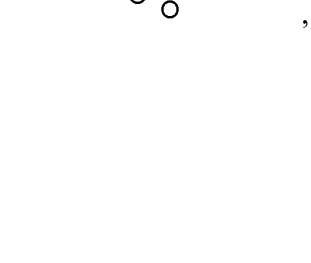
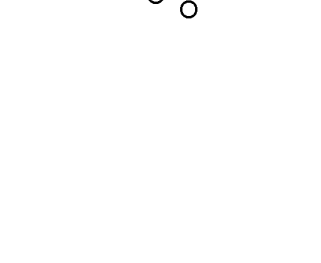
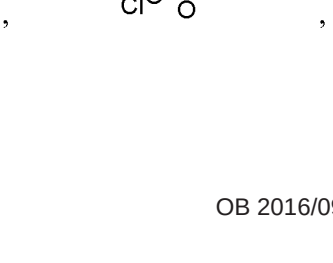

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

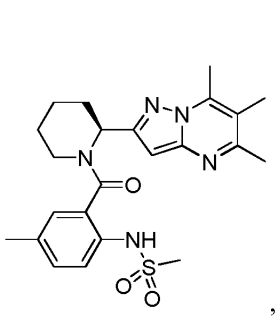
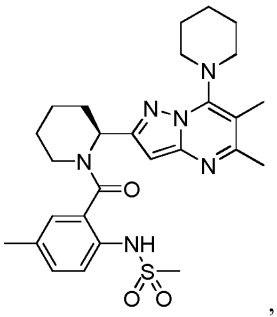
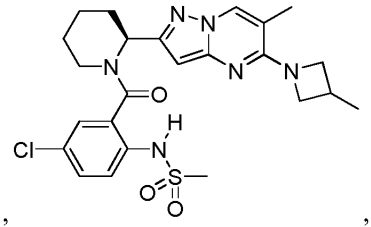
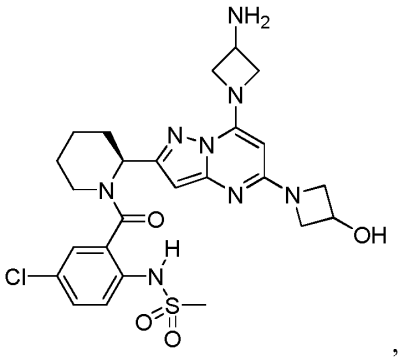
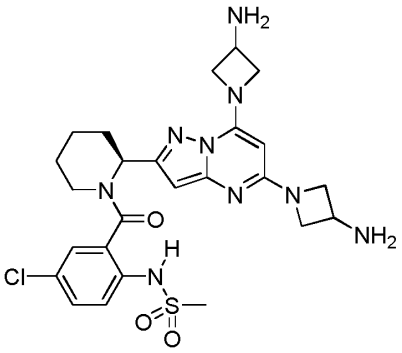
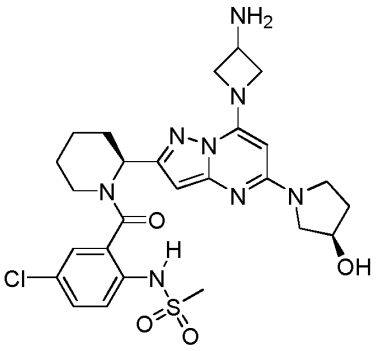
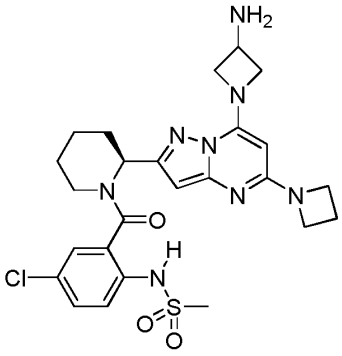
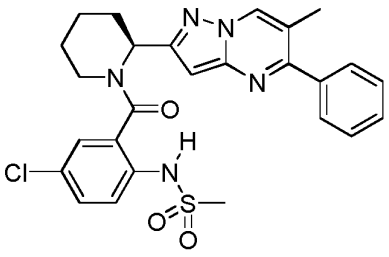
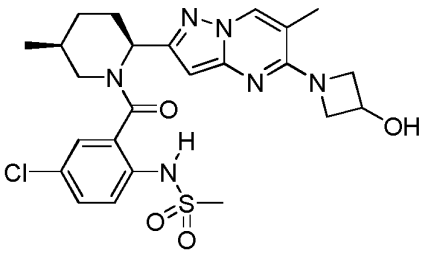
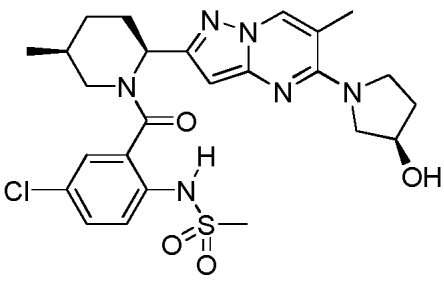
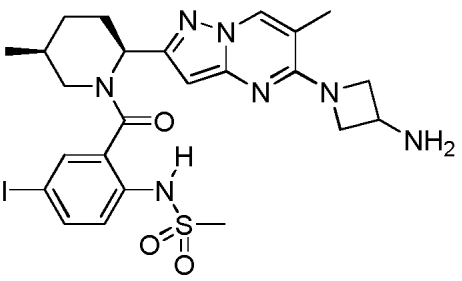

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

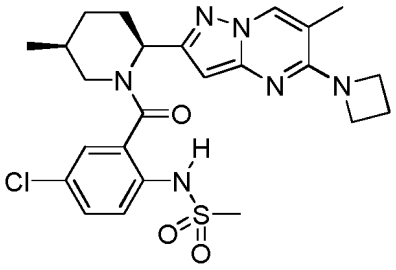

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

.

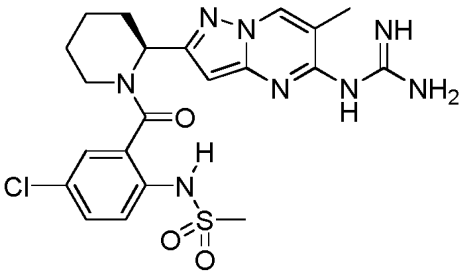

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

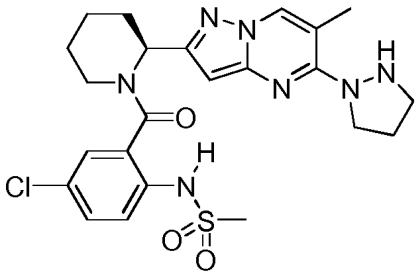

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

.



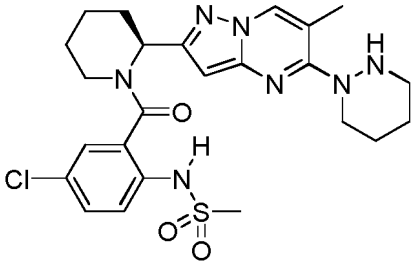
,



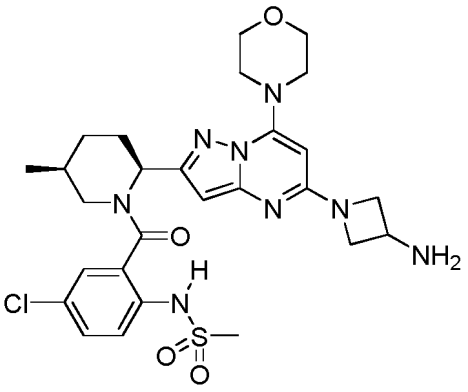
,



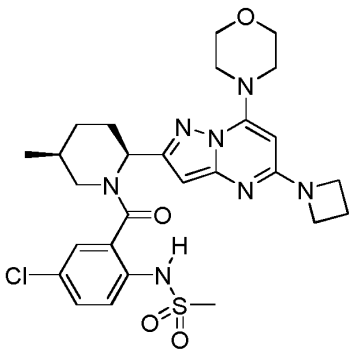
,



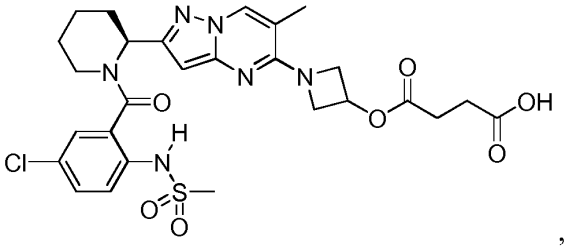
,



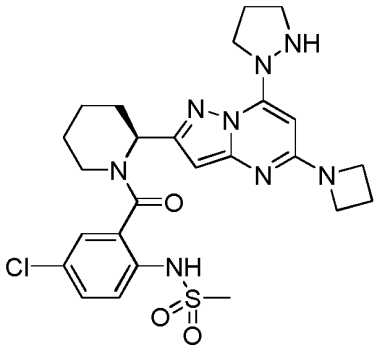
,



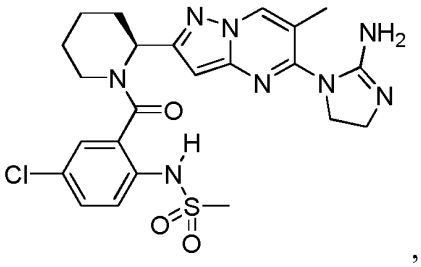
,



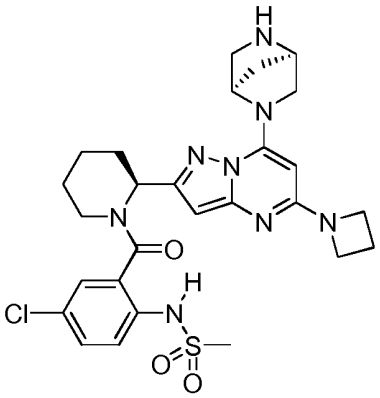
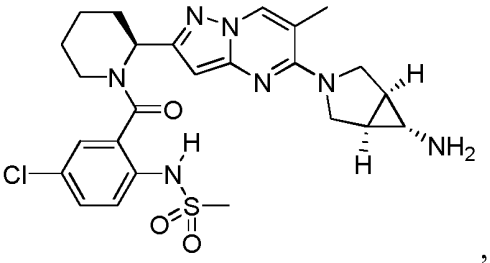
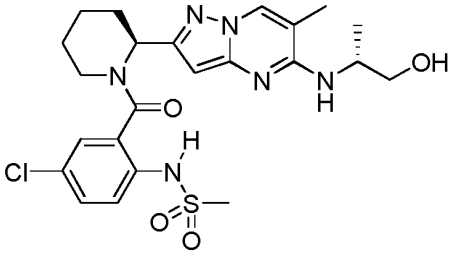
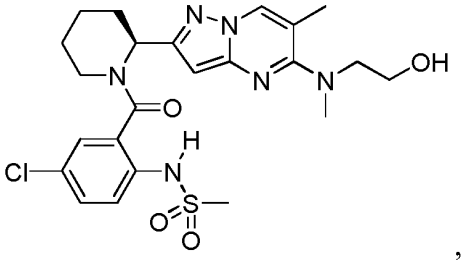
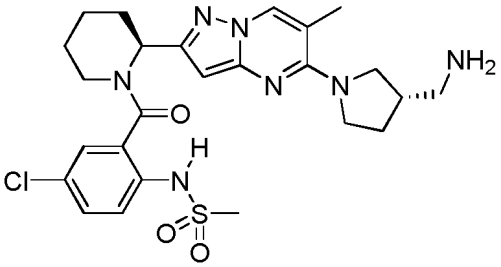
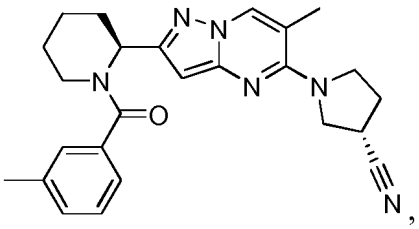
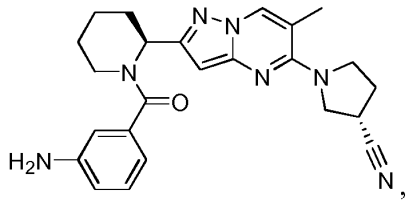
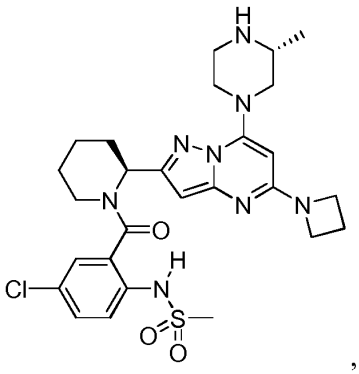
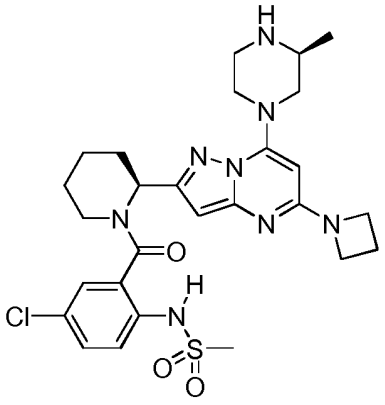
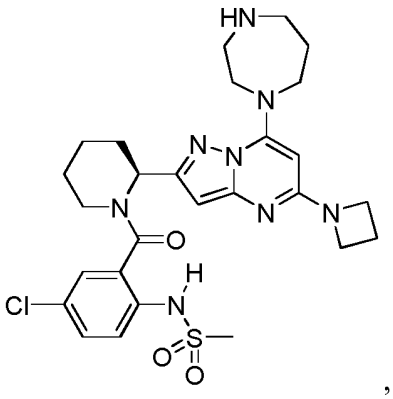
,

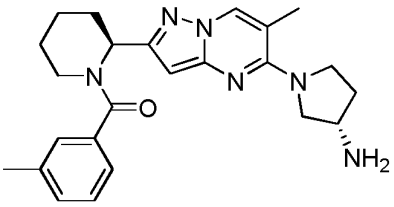
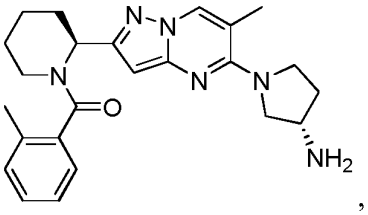
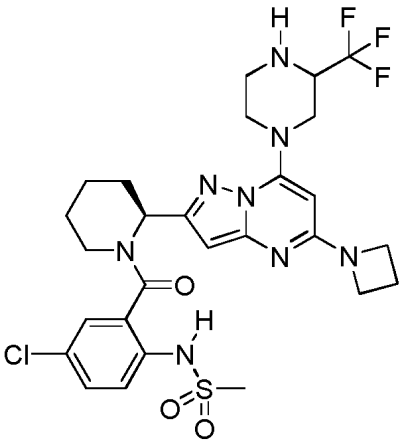
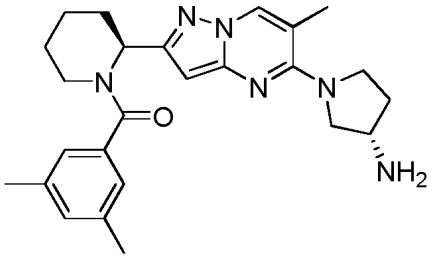
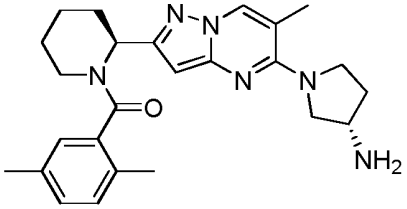
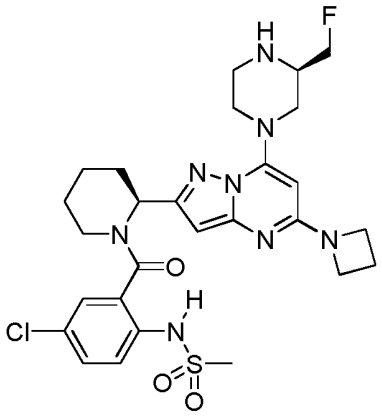
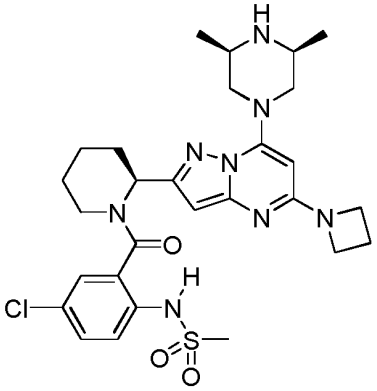


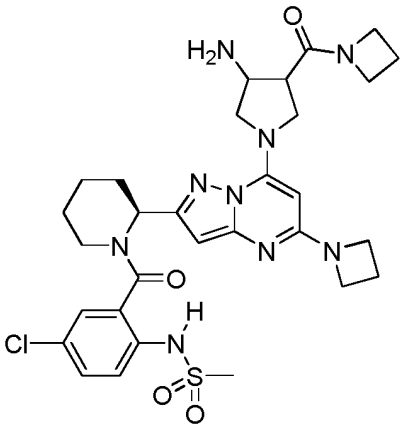
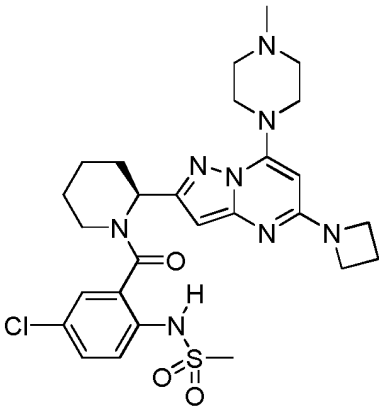
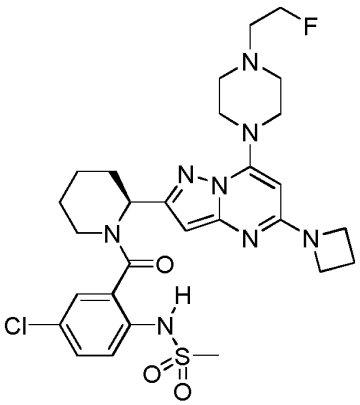
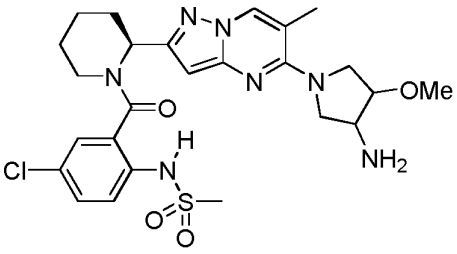
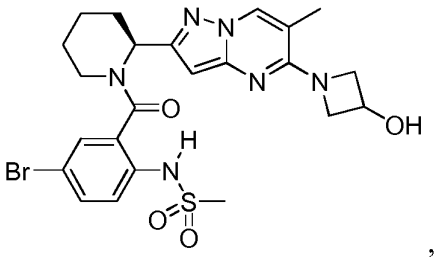
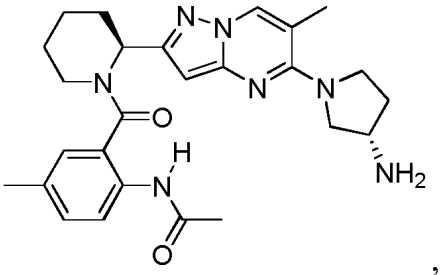
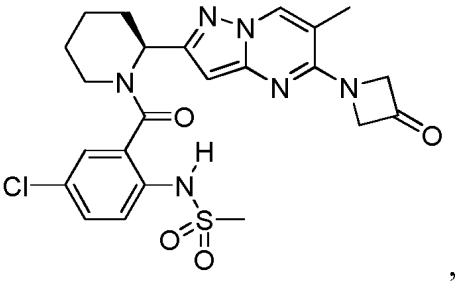
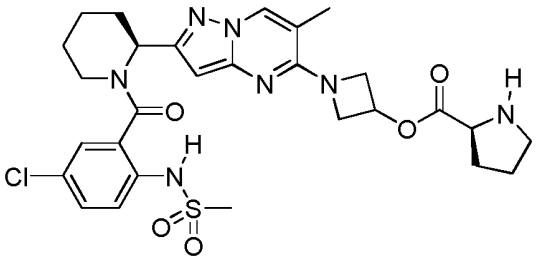
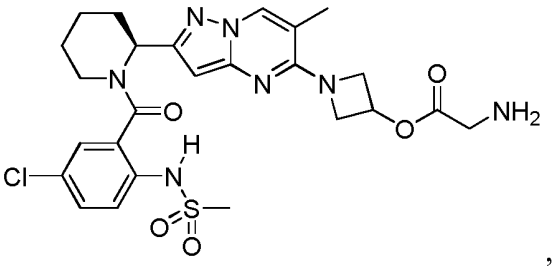
,

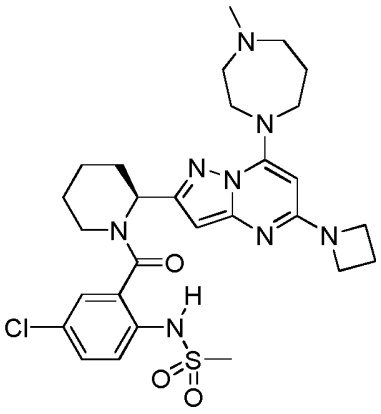
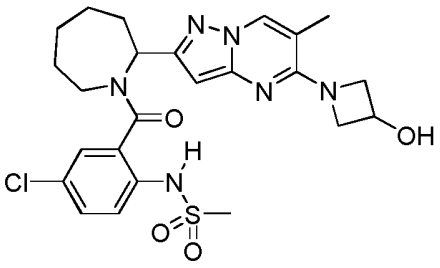
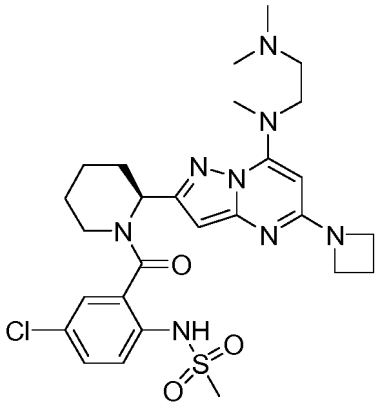
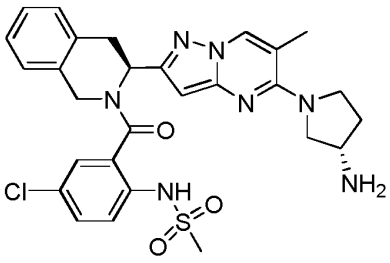
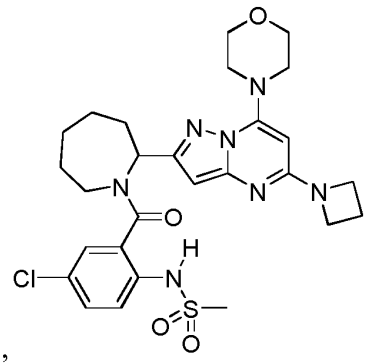
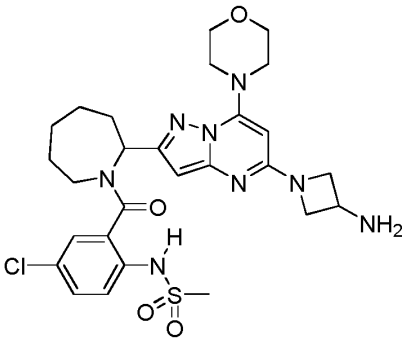
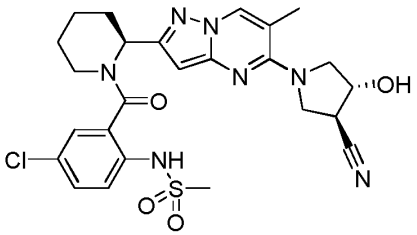
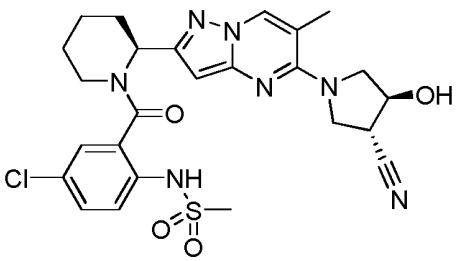
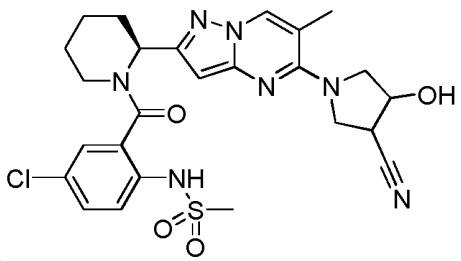


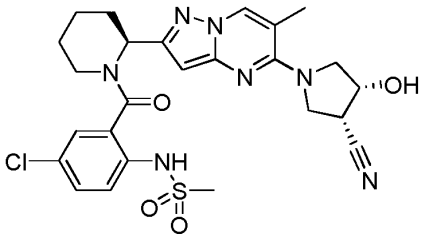
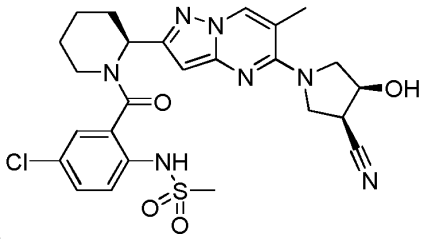
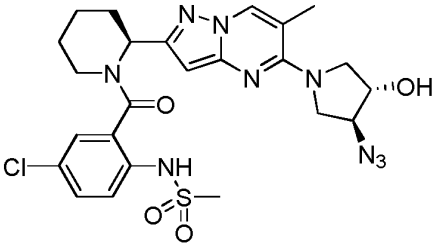
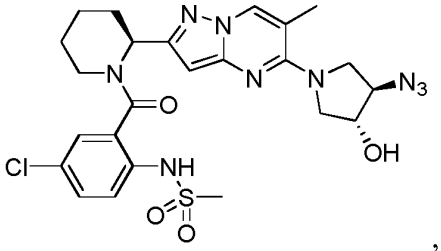
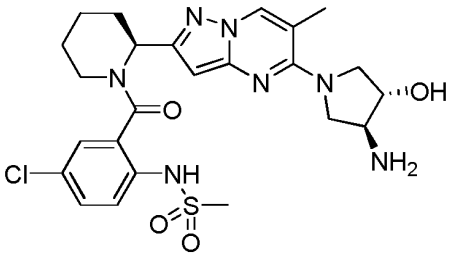
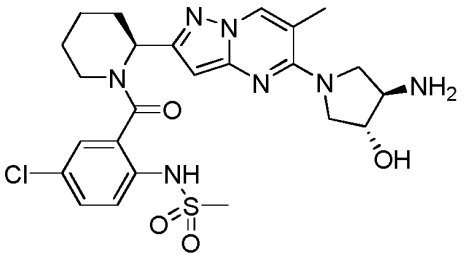
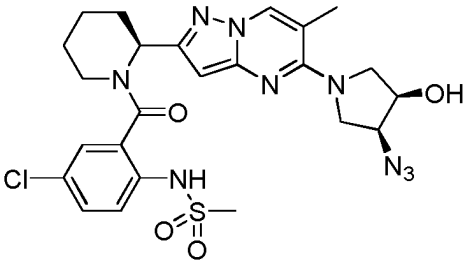
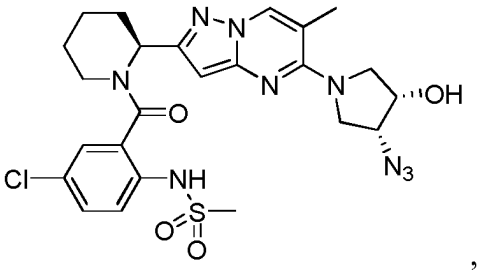
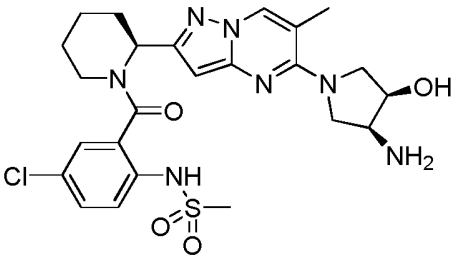
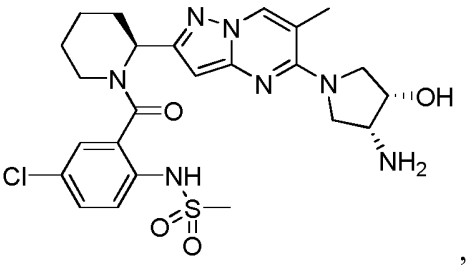
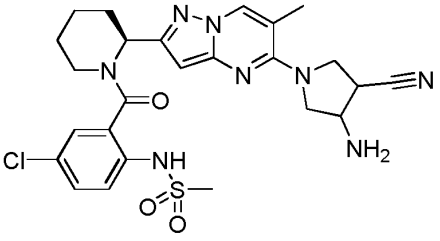
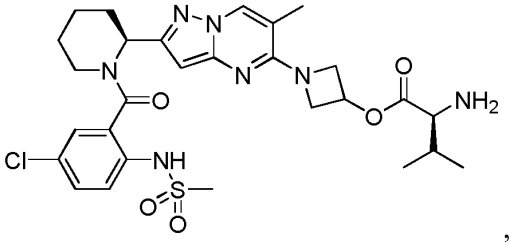
,

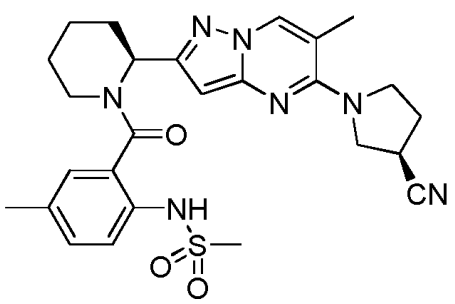
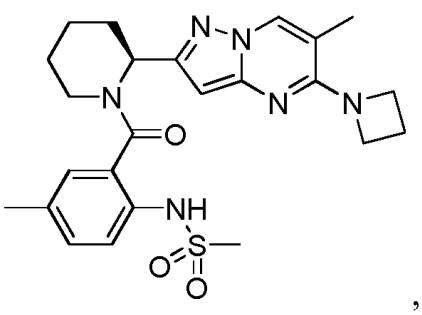
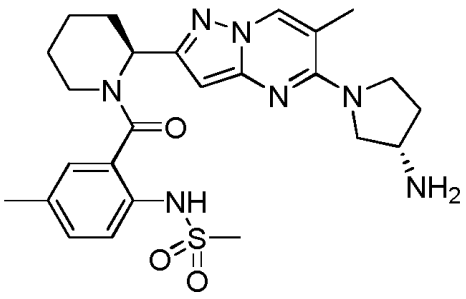
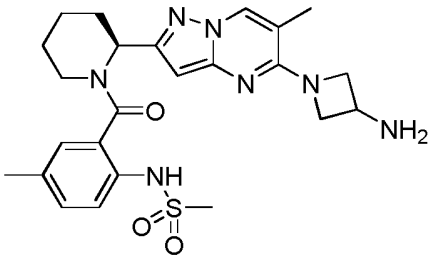
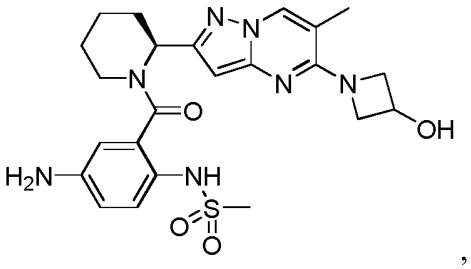
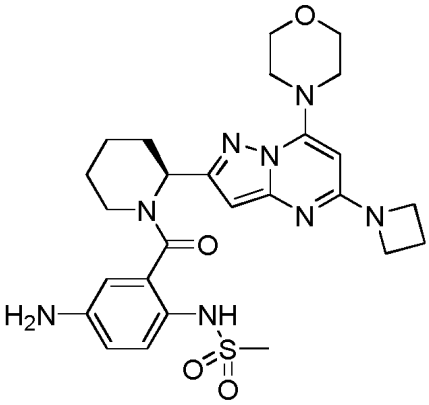
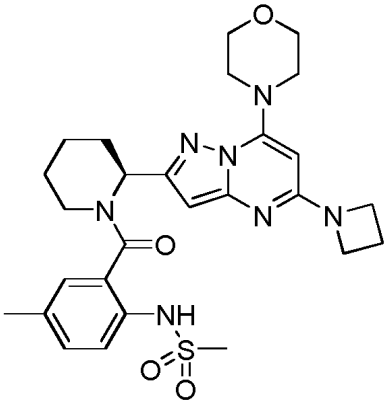
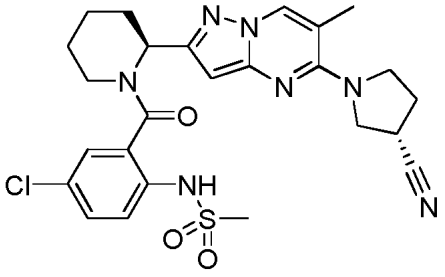

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

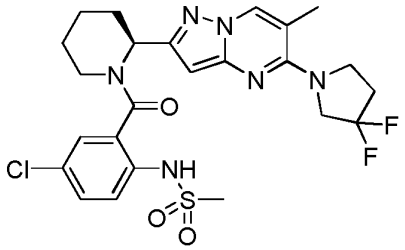
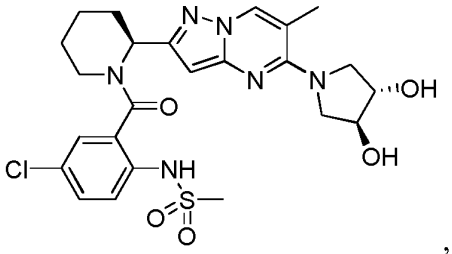
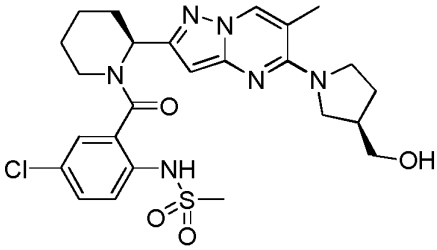
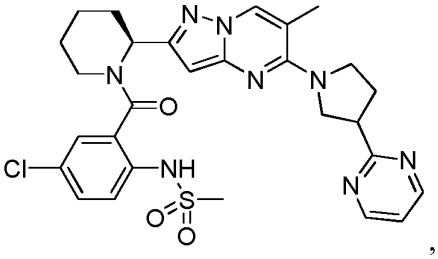
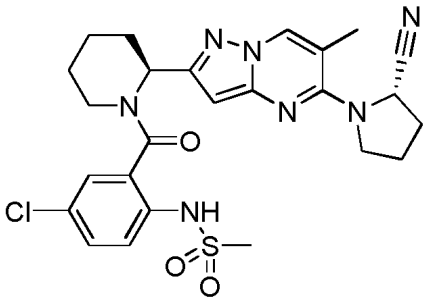
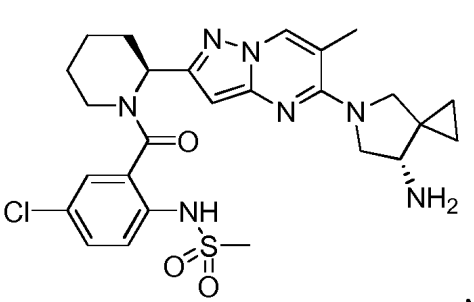
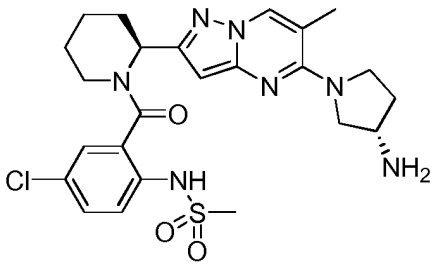
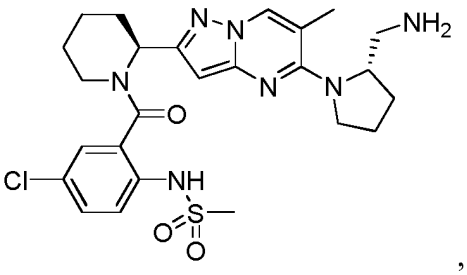
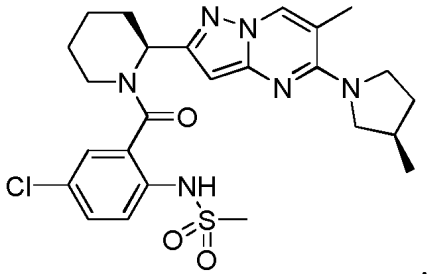
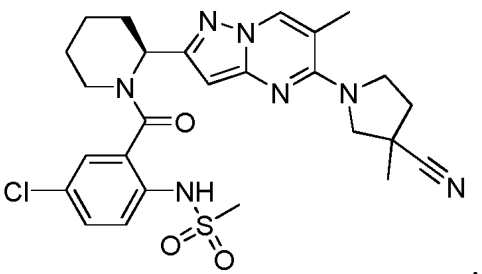

,

,

,

,

,

,

,

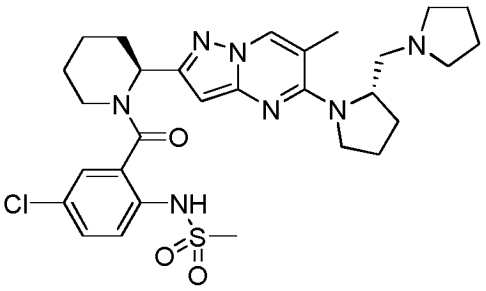
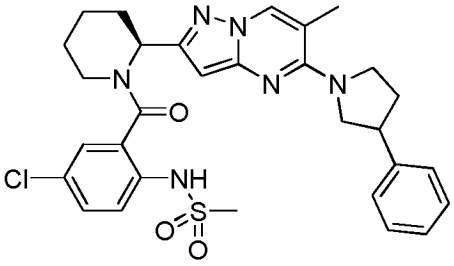
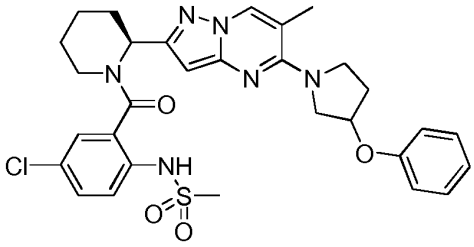
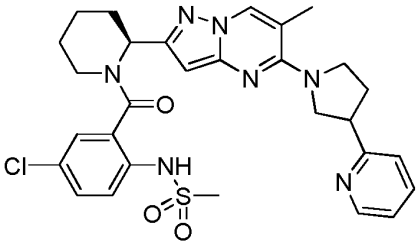
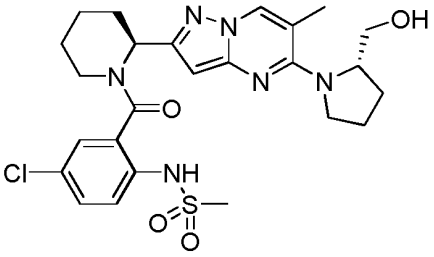
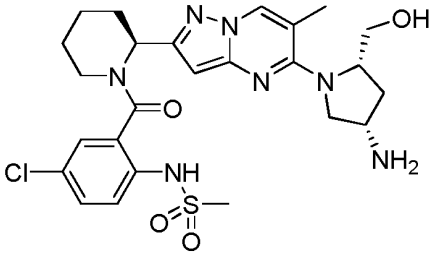
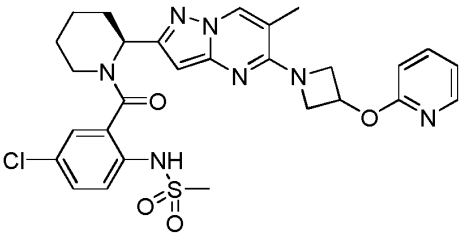
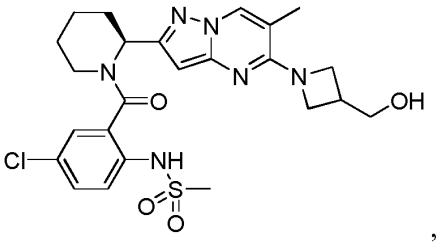
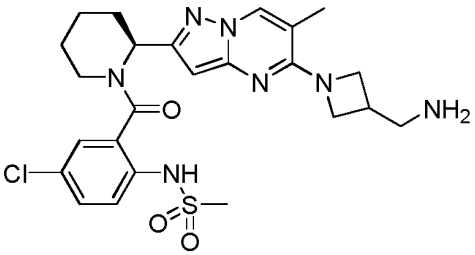
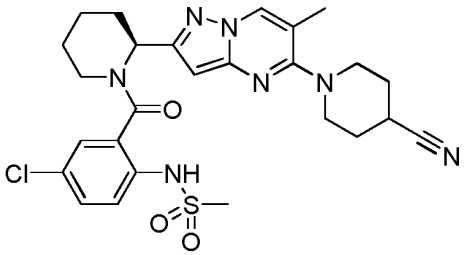
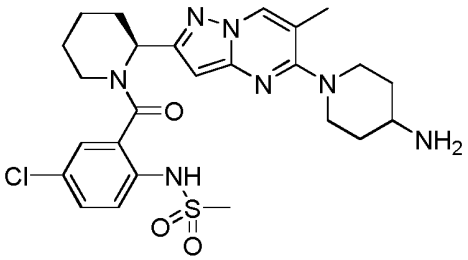
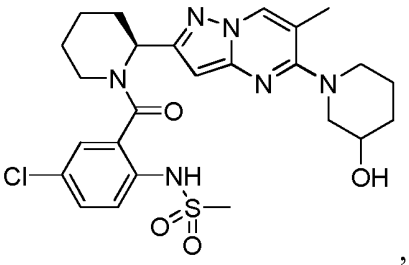

,

,

,

,

,

,

,

,

,

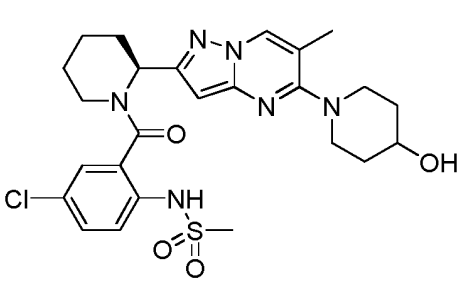
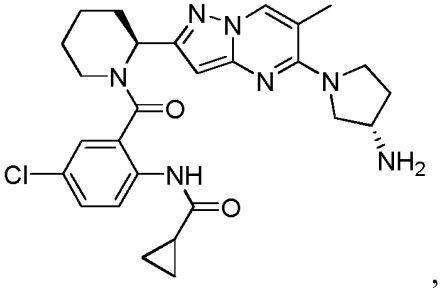
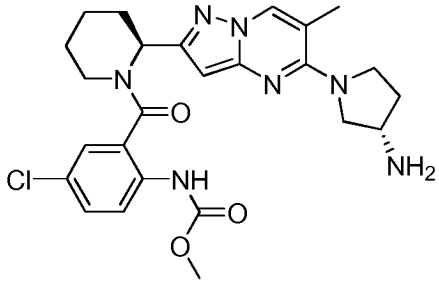
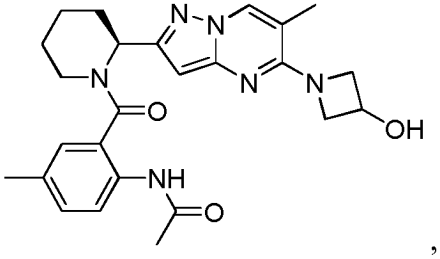
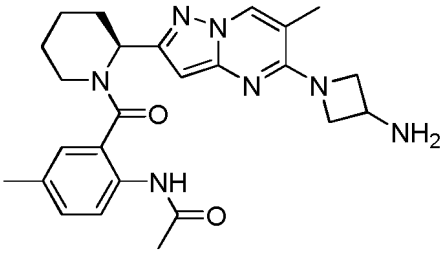
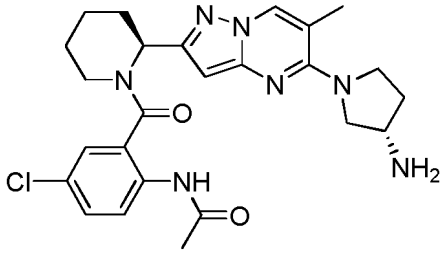
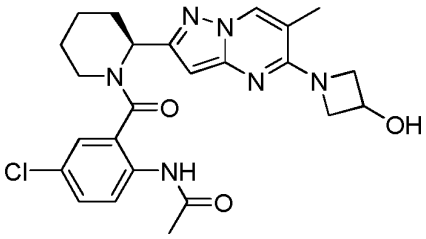
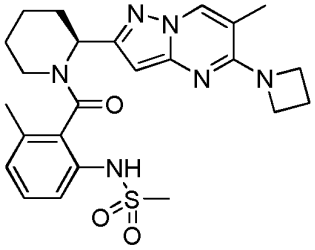
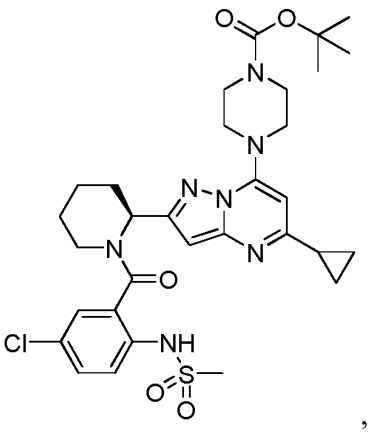
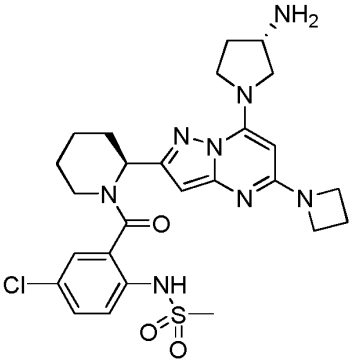
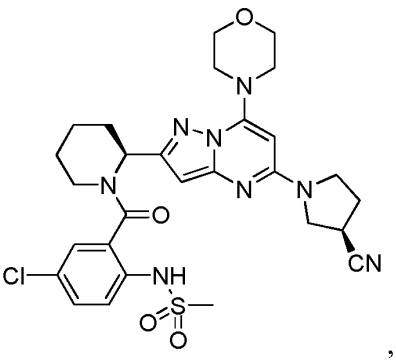

,

,


,

,

,

,

,

,

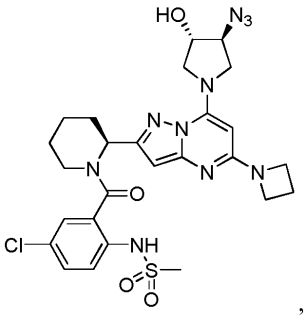
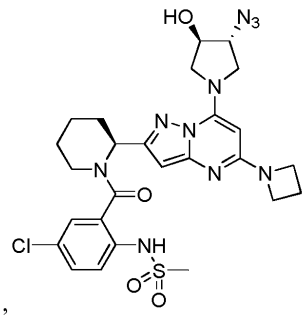
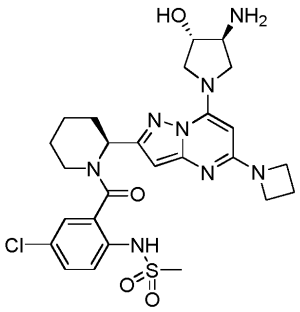
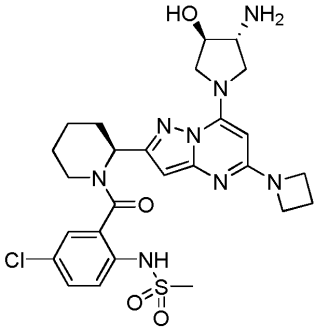
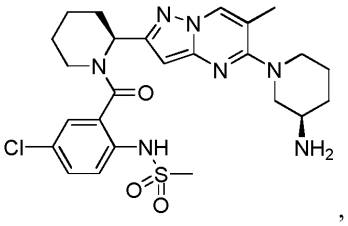
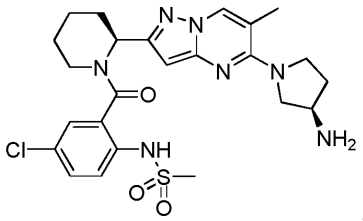
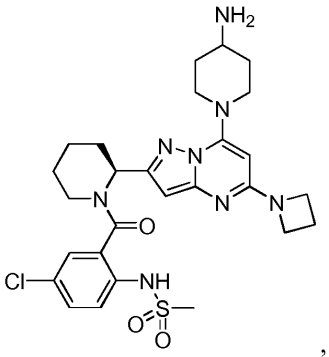
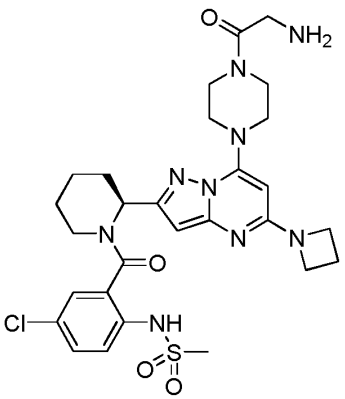
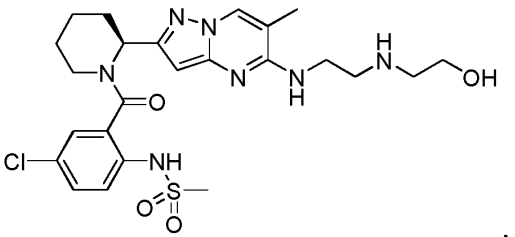
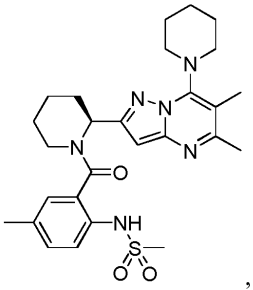
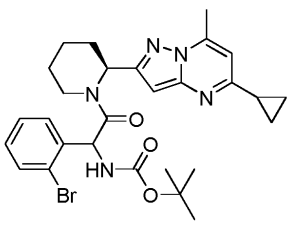
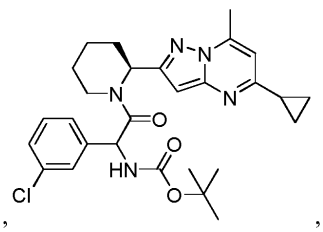

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

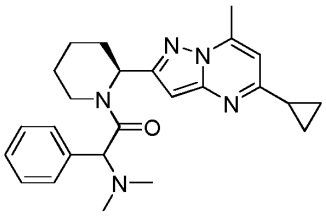

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

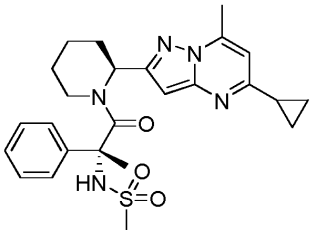

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

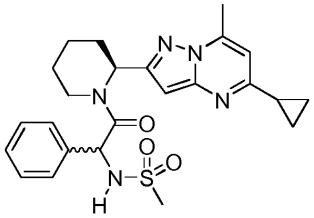

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,



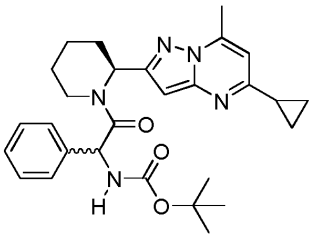
,



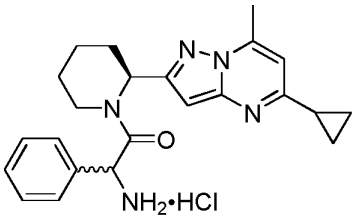
,



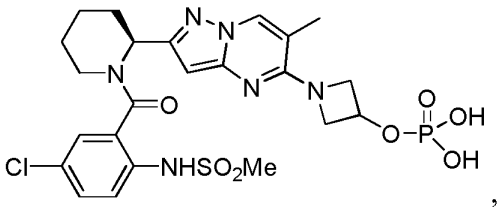
,



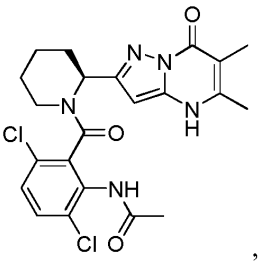
,



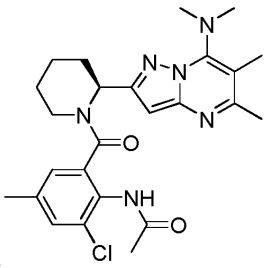
,



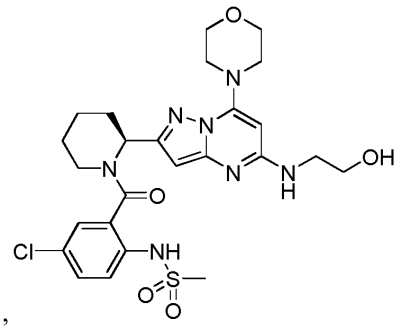
,



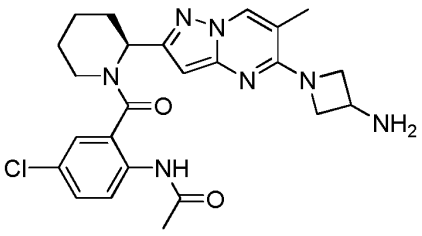
,



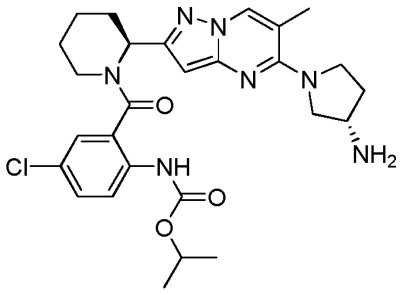
,



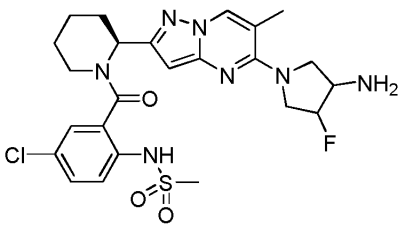
,



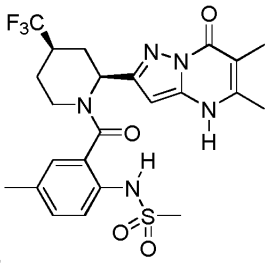
,



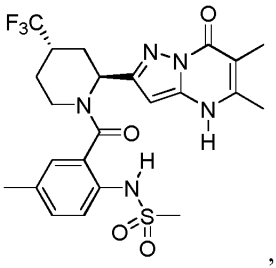
,



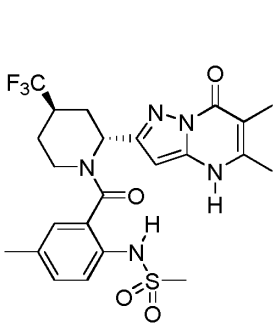
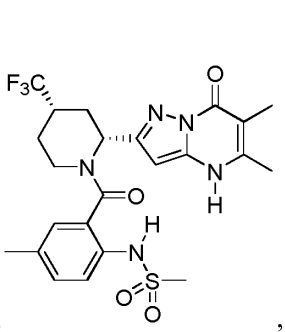
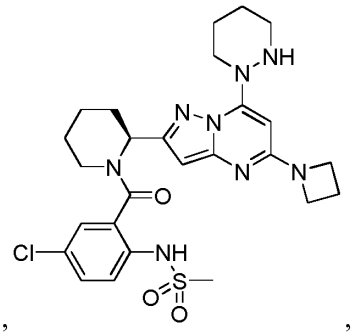
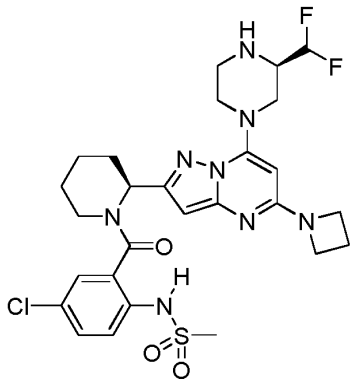
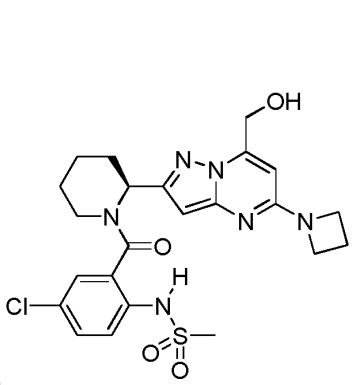
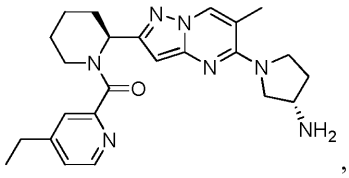
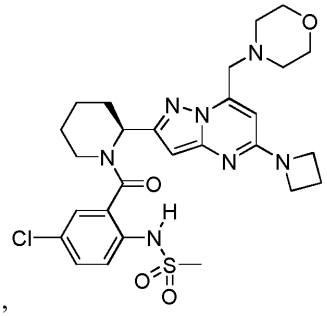
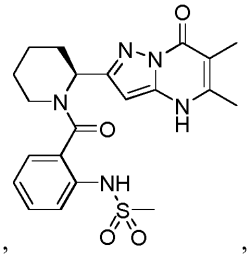
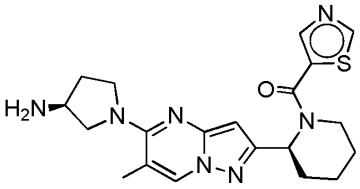
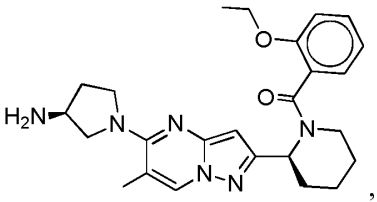
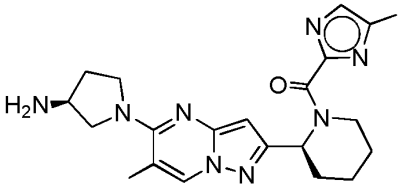
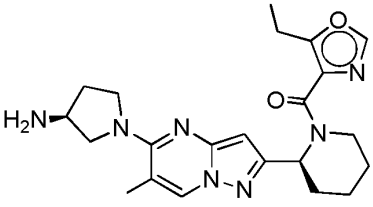
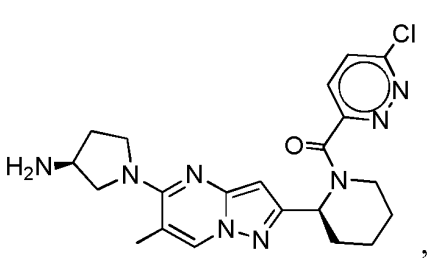
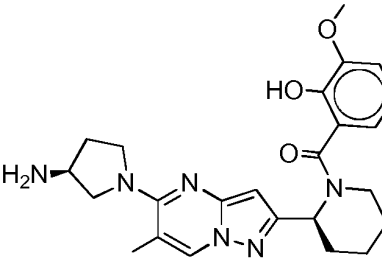
,

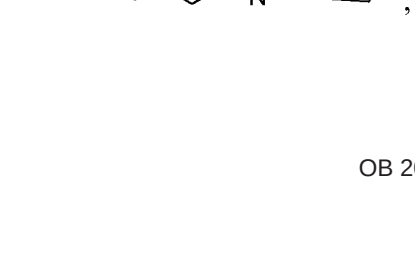


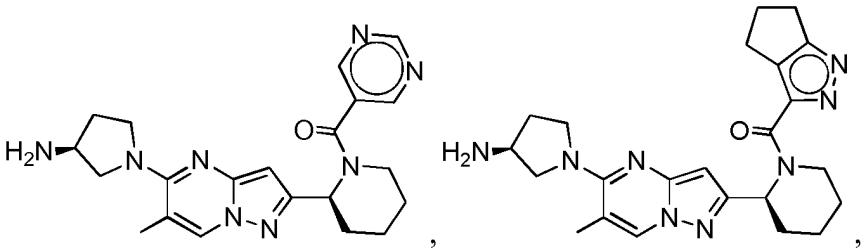
,

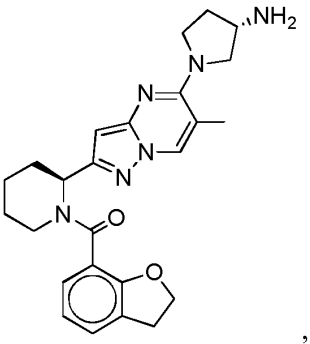
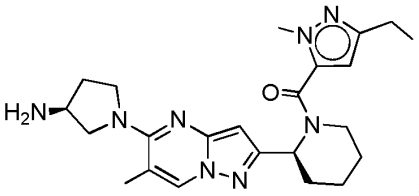
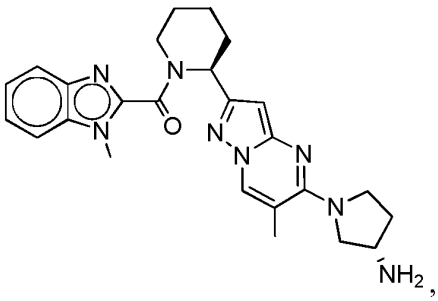
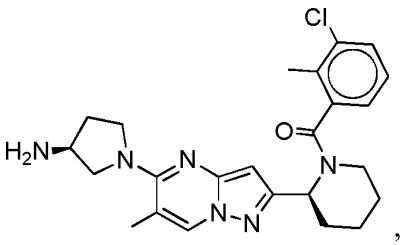
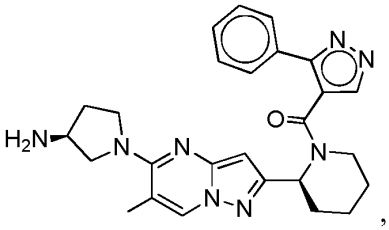
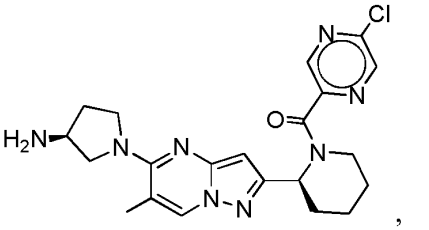
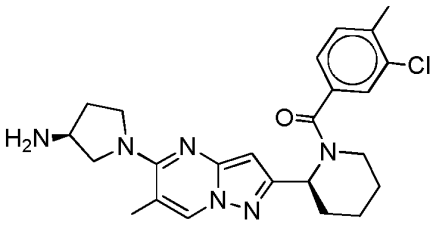
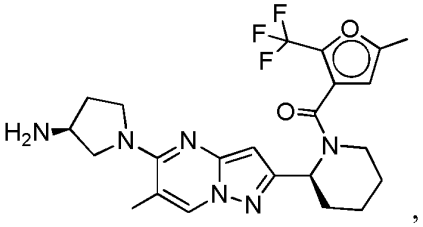
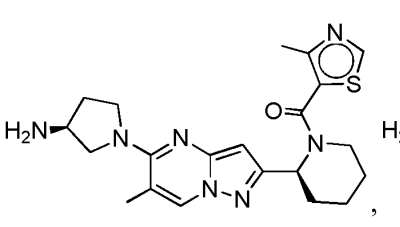
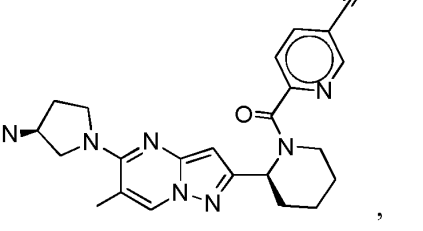


,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

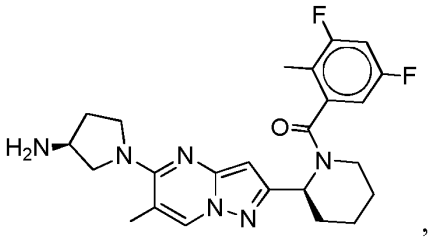
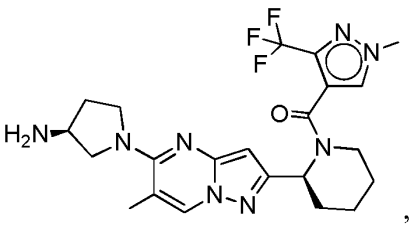
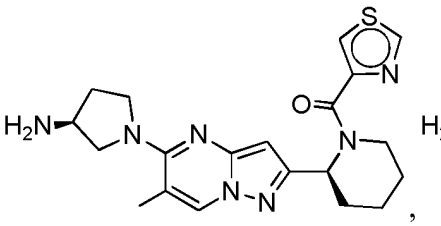
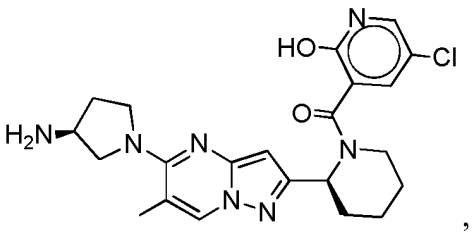
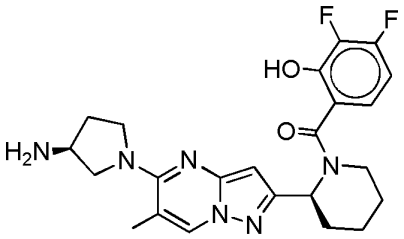
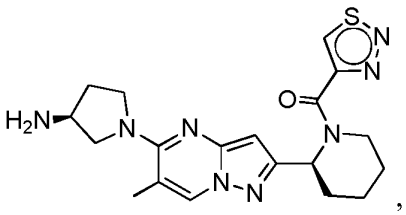
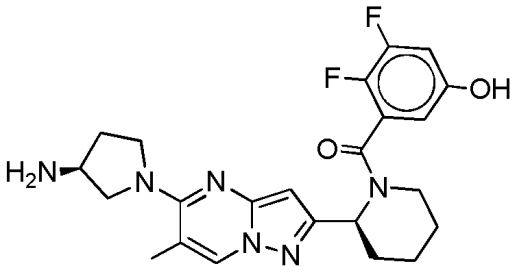
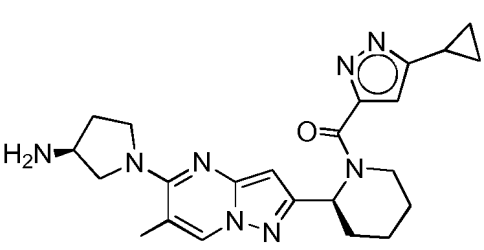
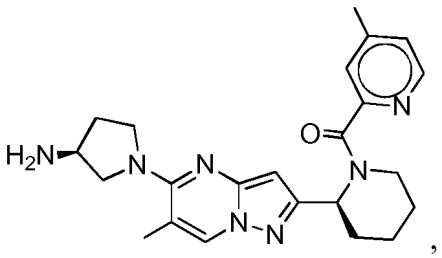
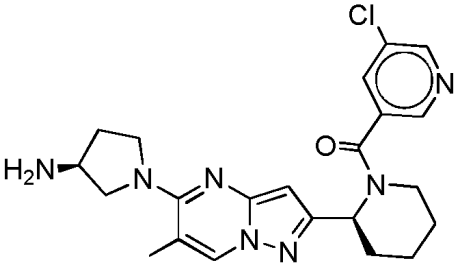
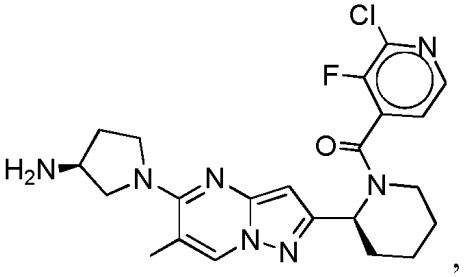
,

,

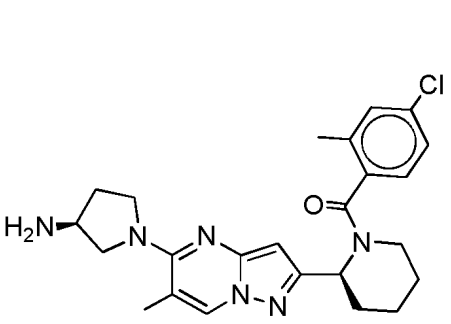
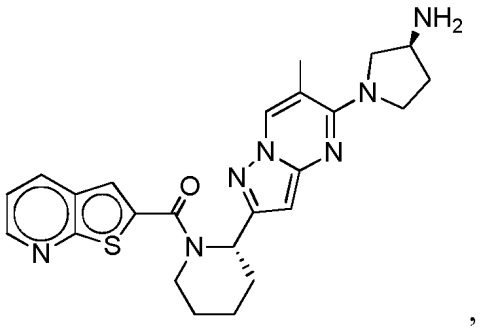
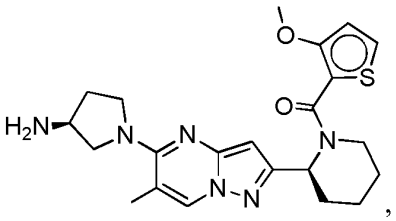
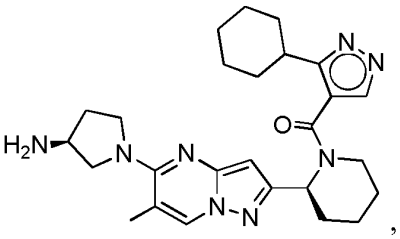
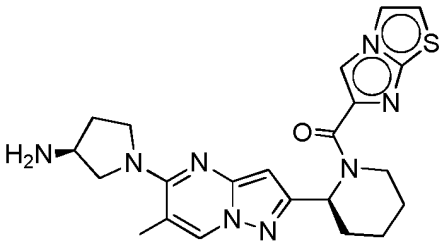
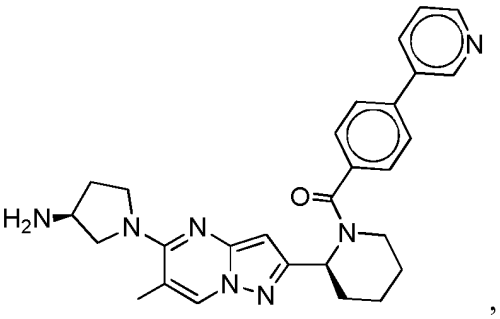
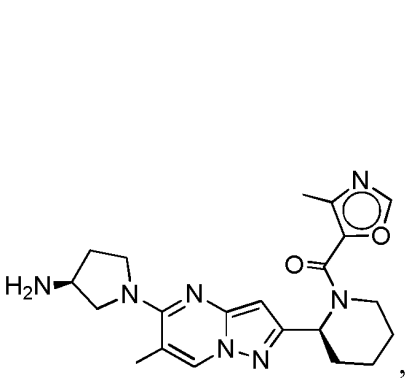
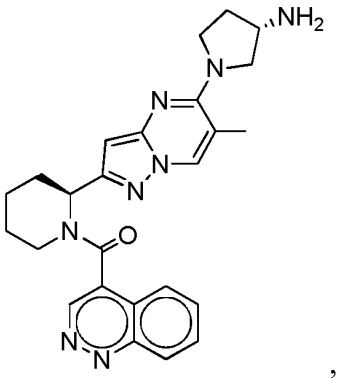
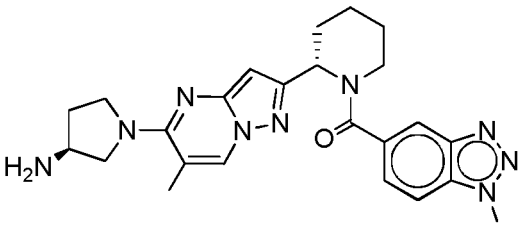
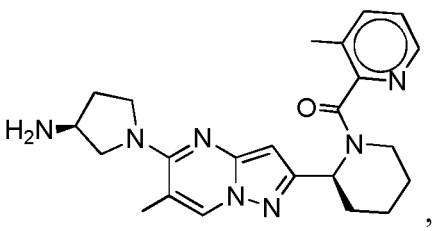

,

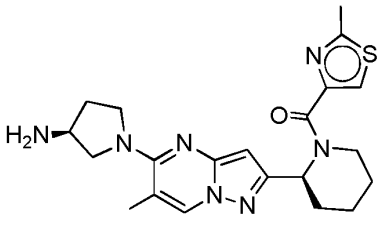
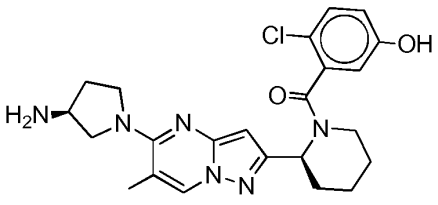
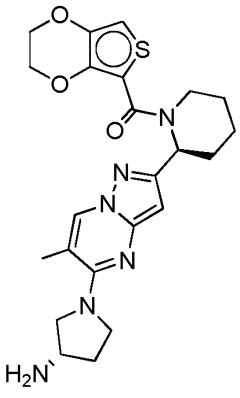
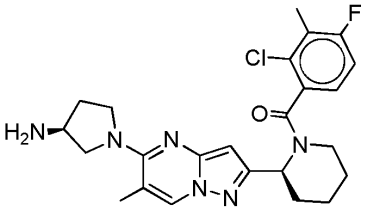
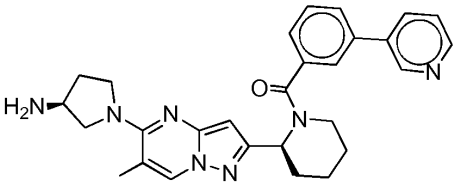
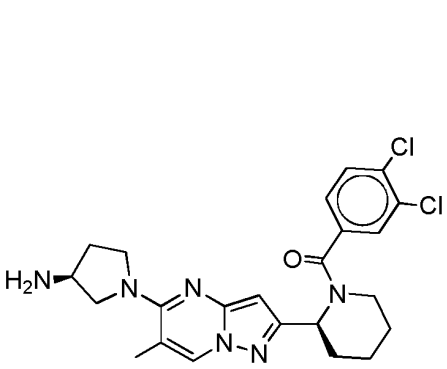
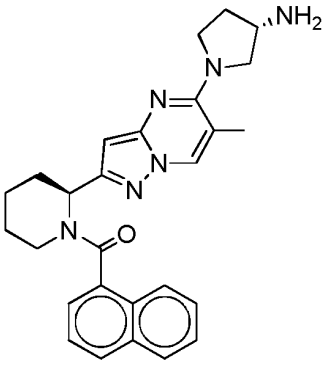
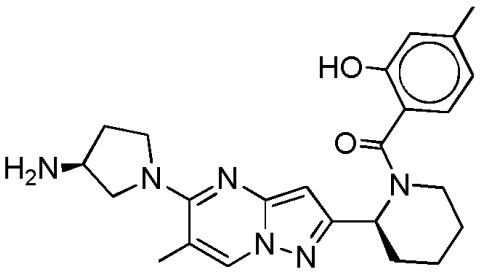
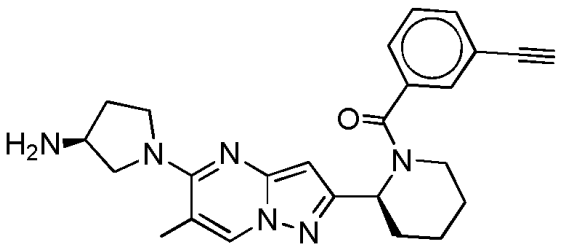
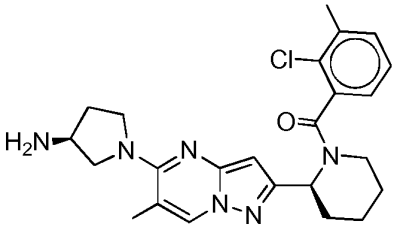
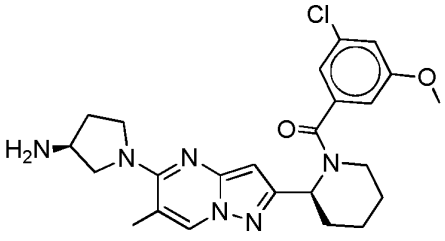
,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

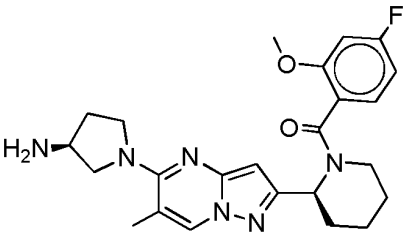
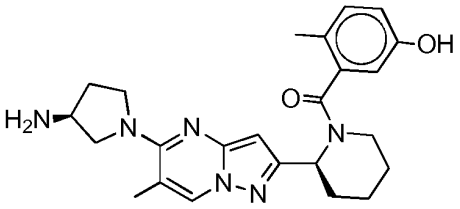
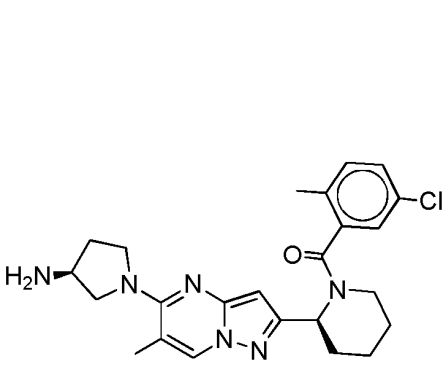
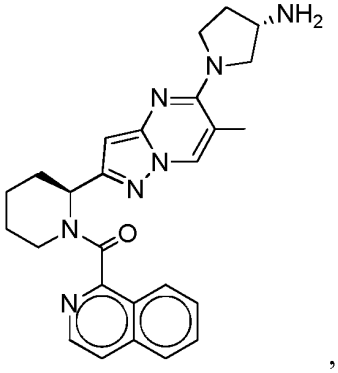
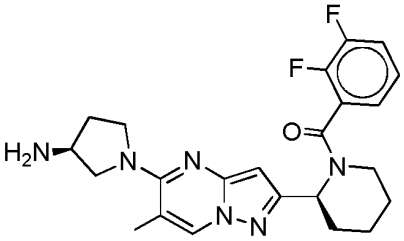
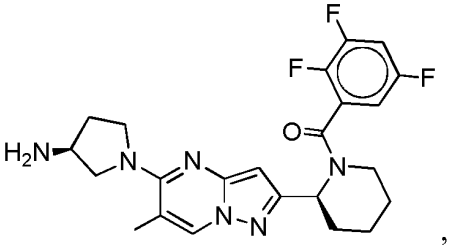
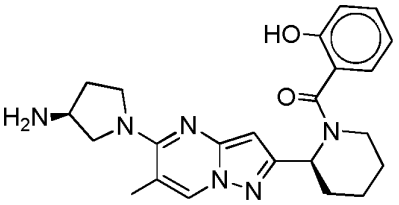
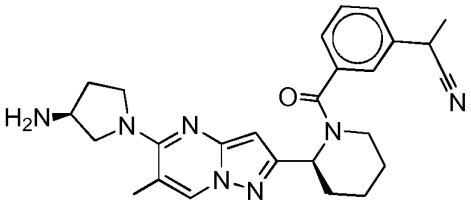
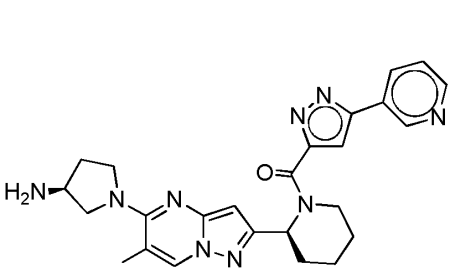
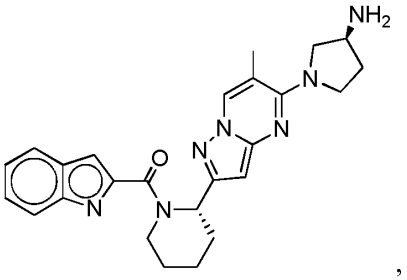
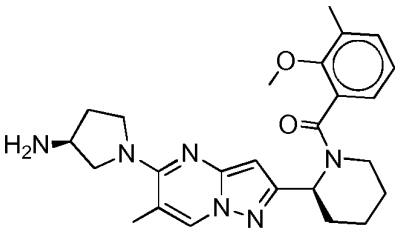
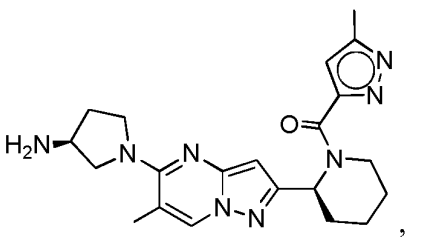
,

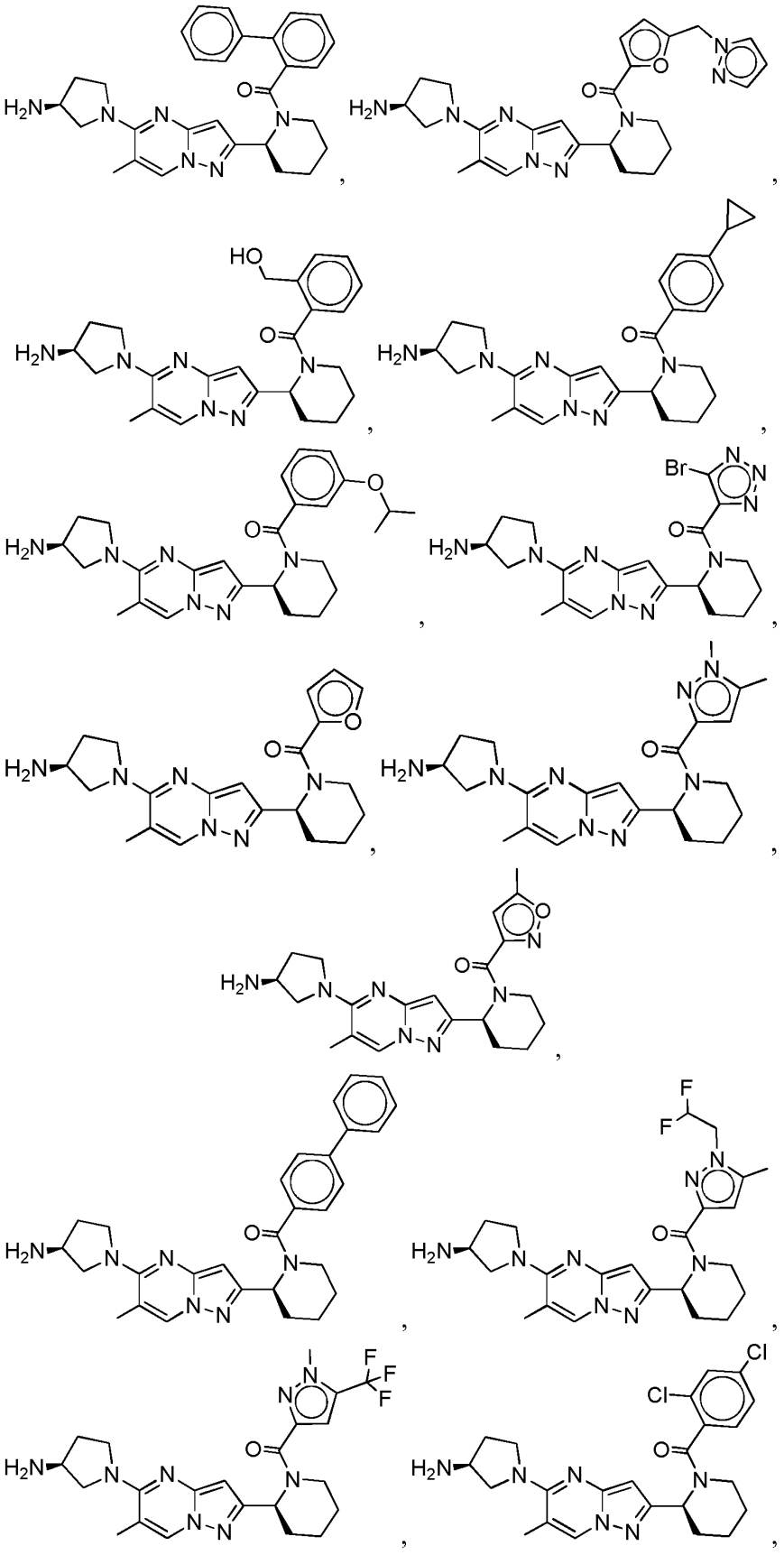
,

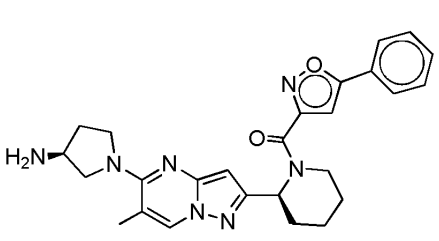
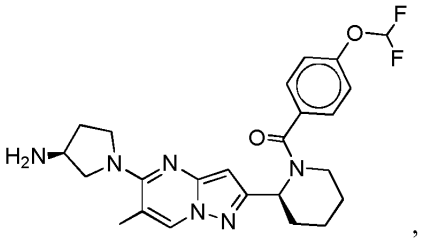
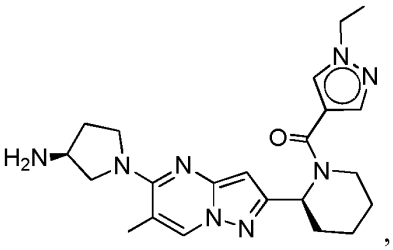
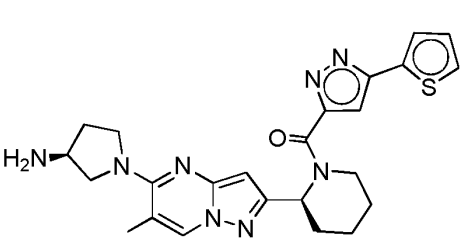
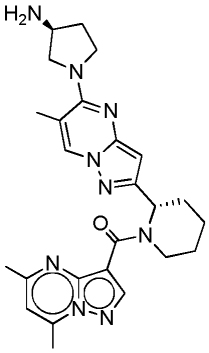
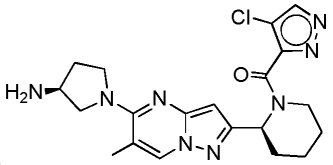
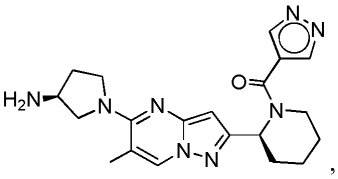
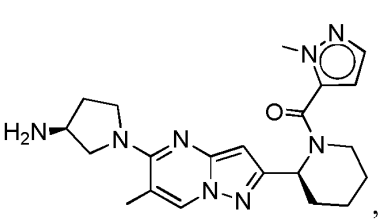
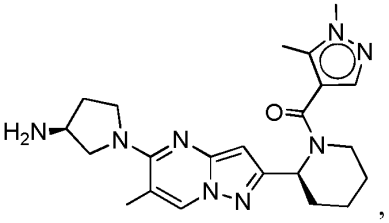
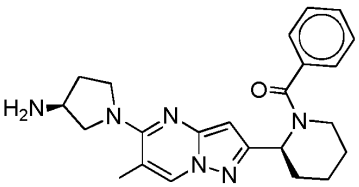
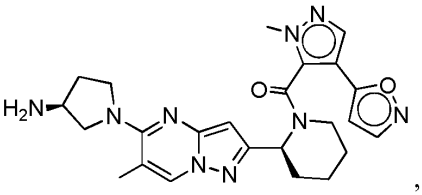
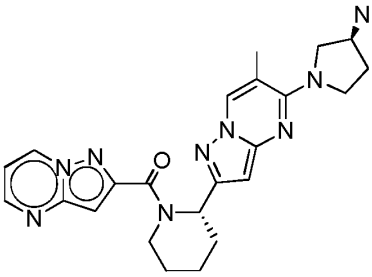
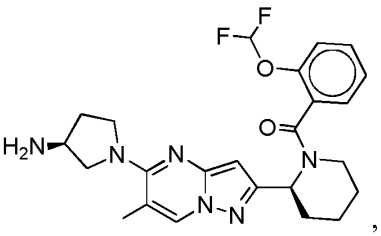
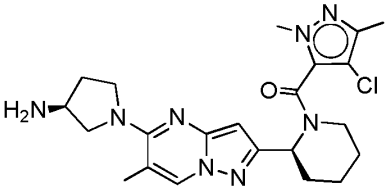
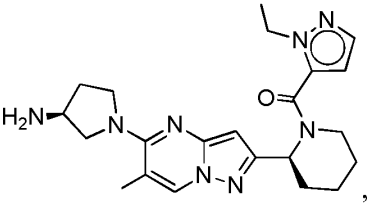

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

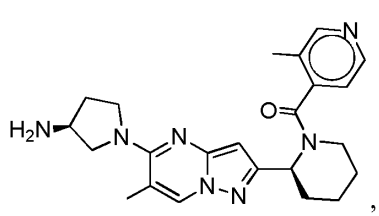
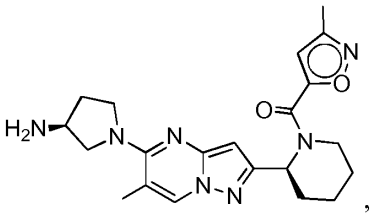
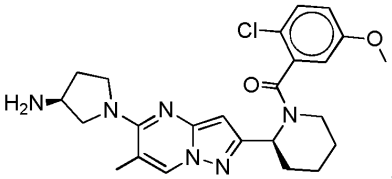
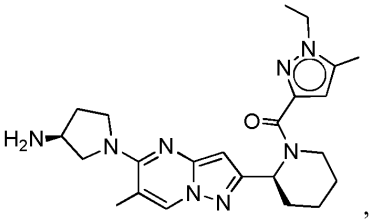
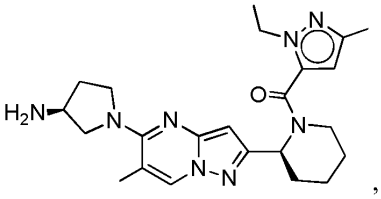
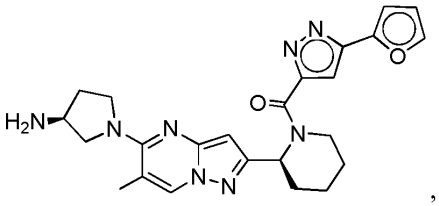
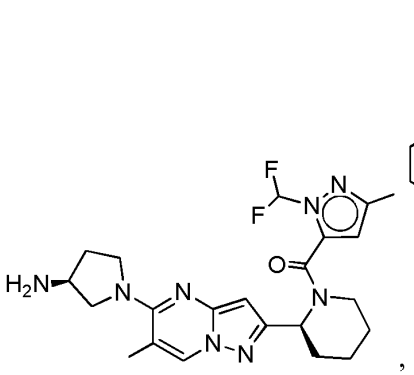
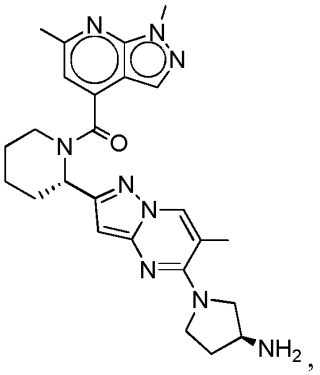
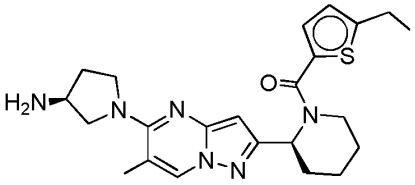
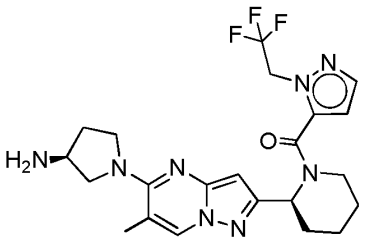
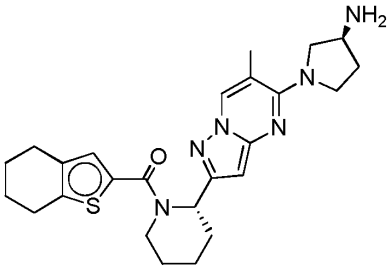
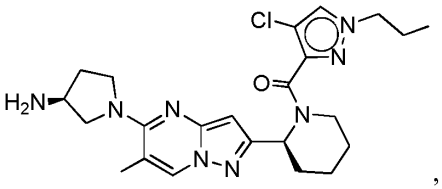
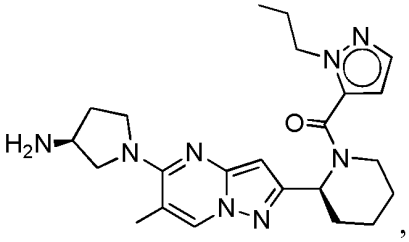
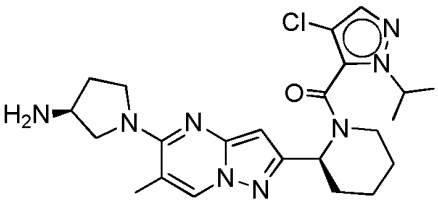

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

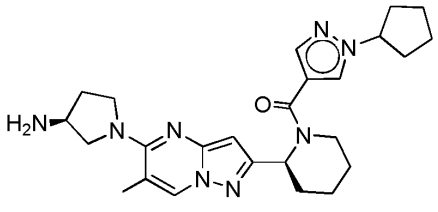
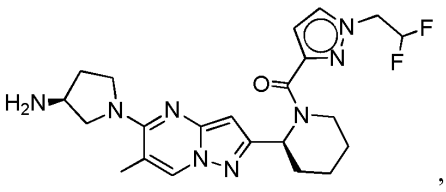
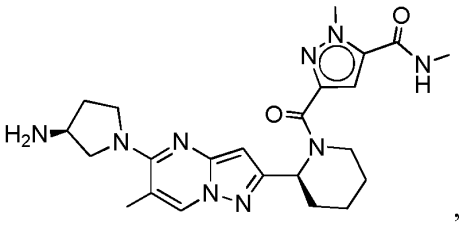
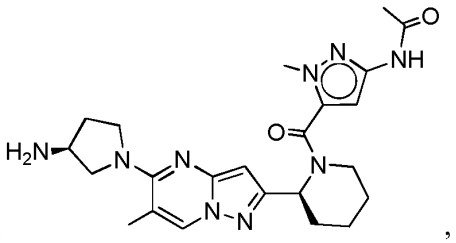
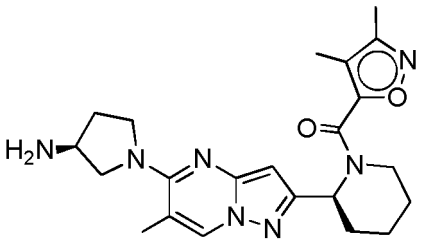
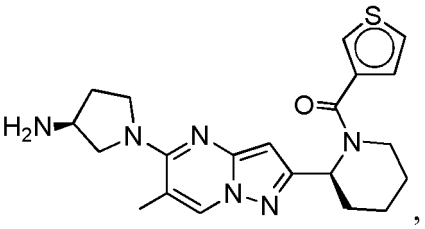
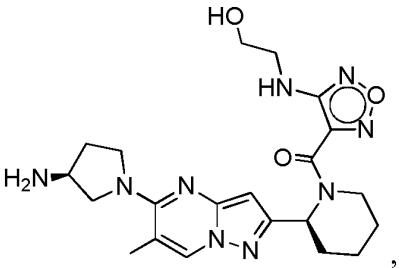
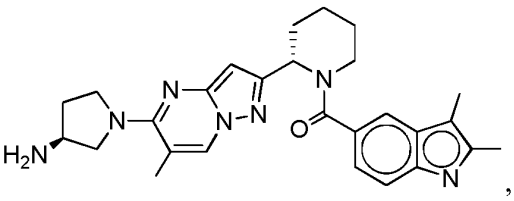
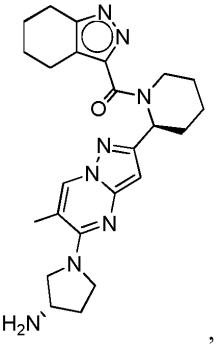
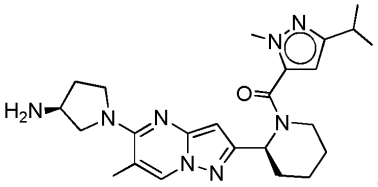
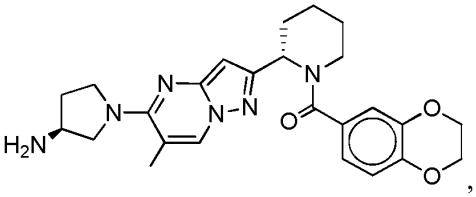
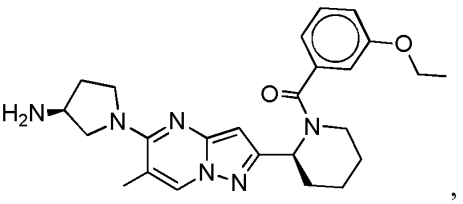
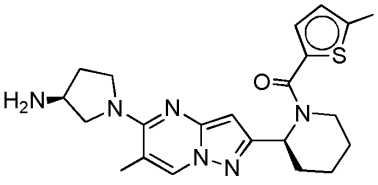
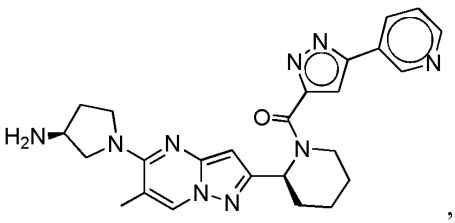

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

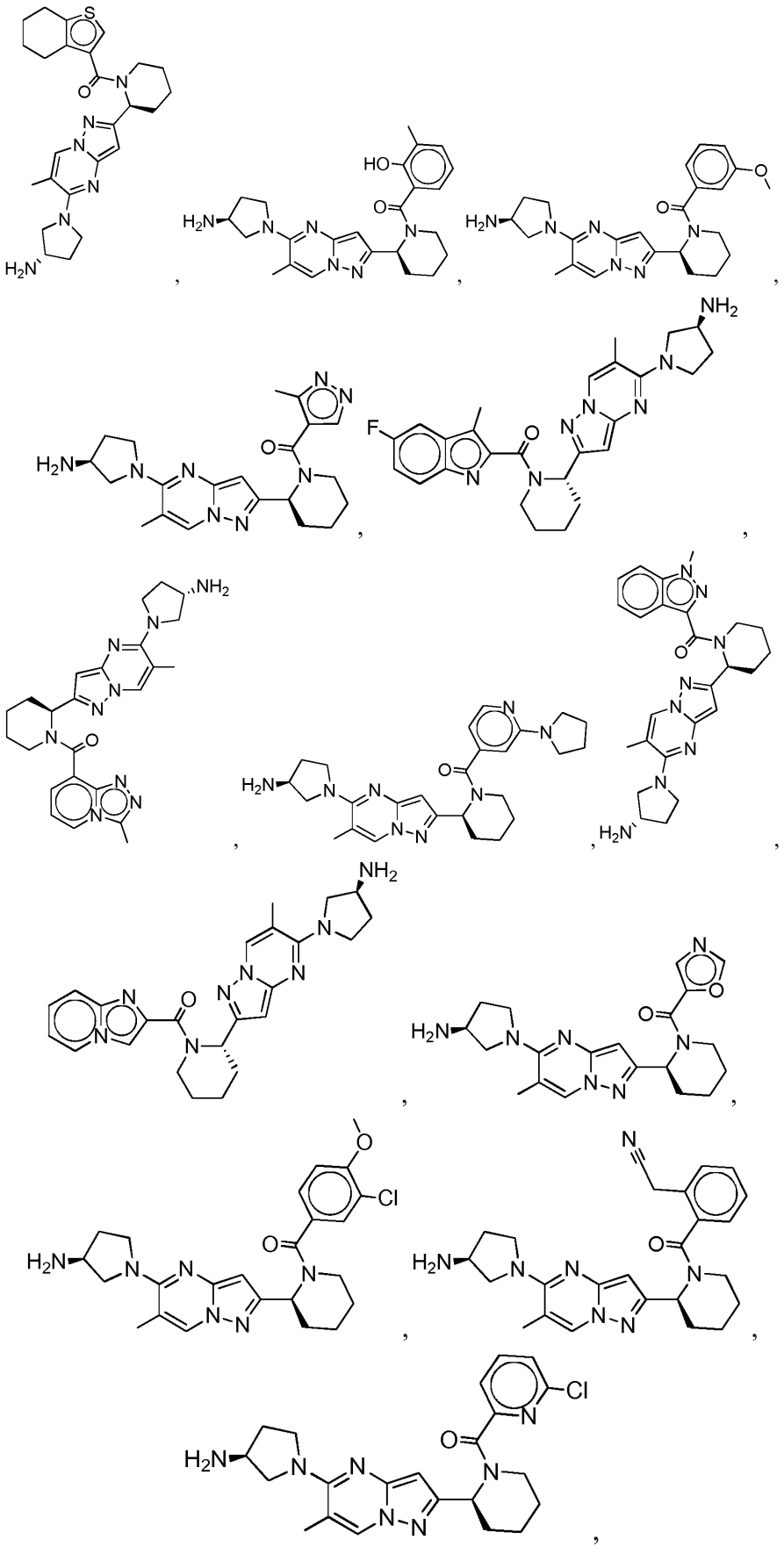

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

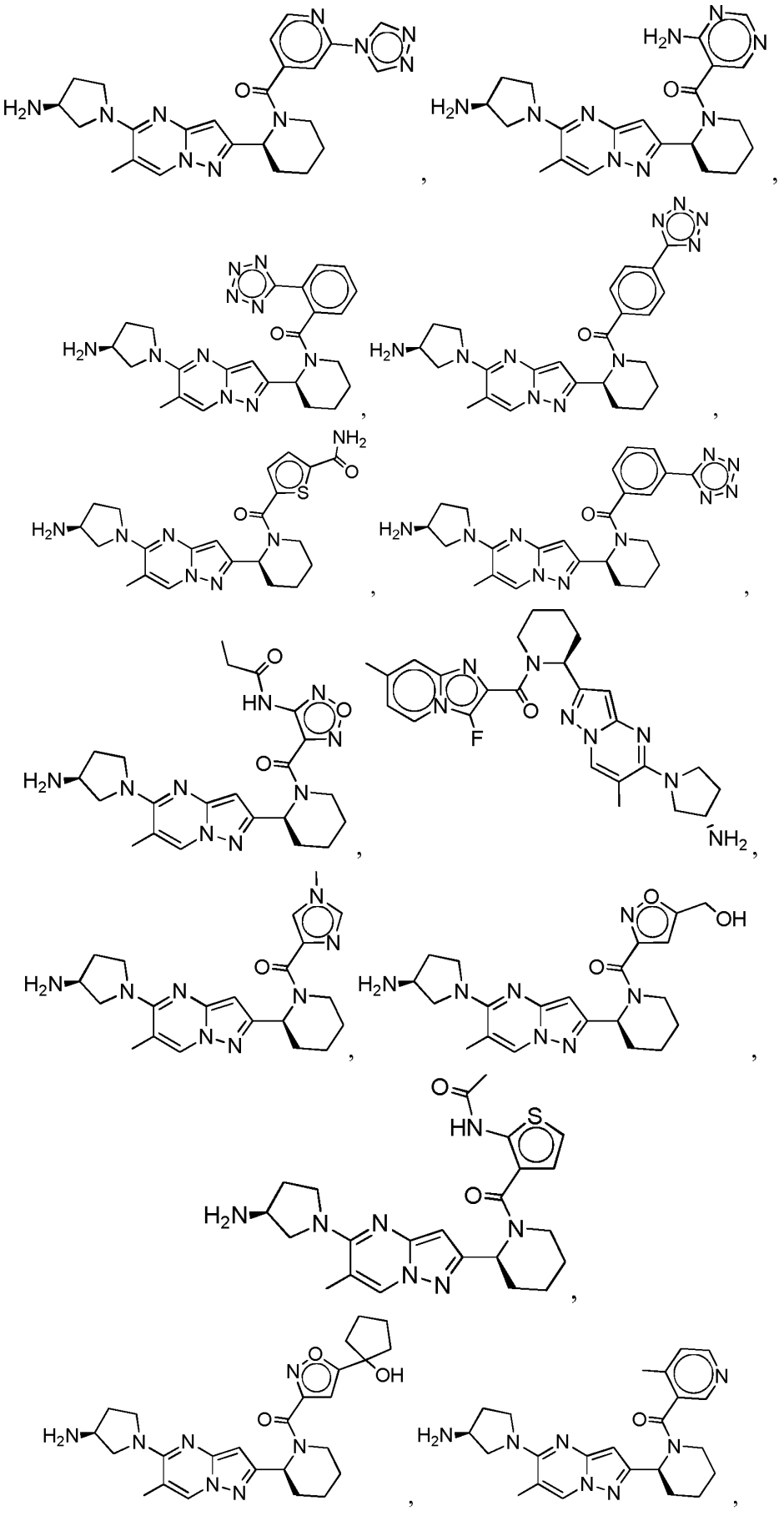


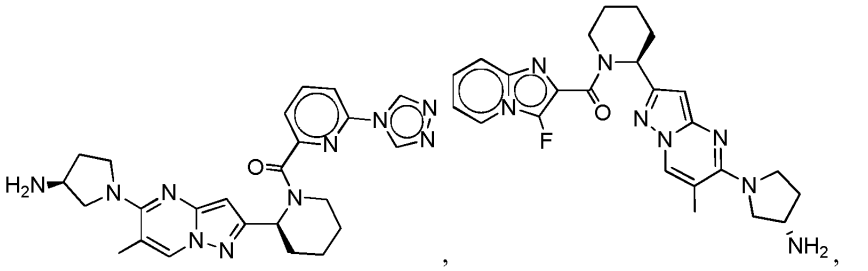

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

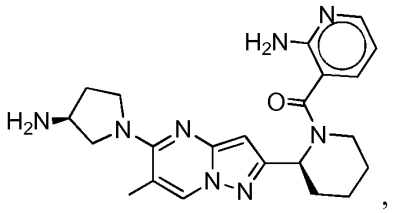
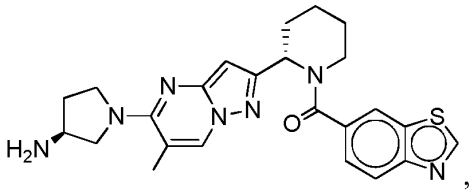
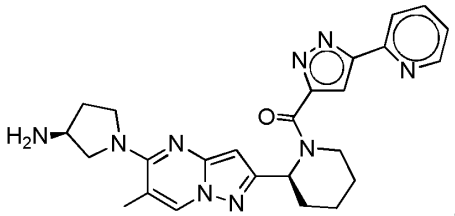
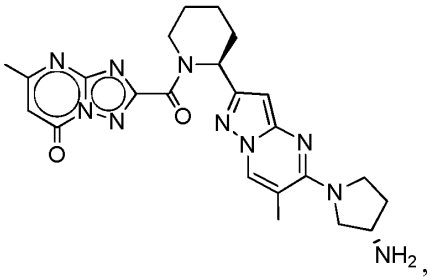
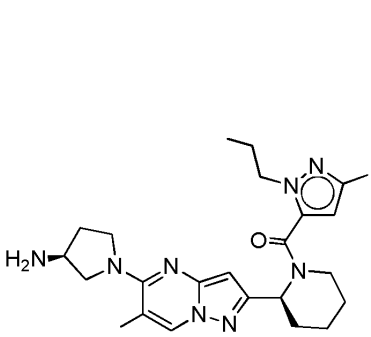
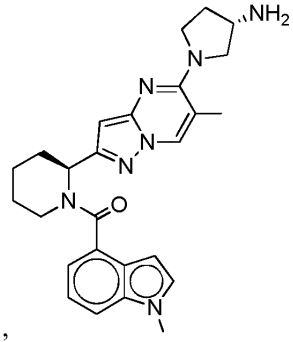
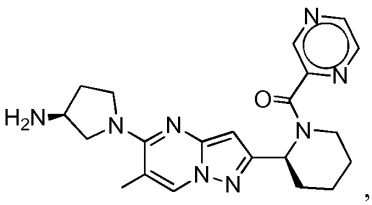
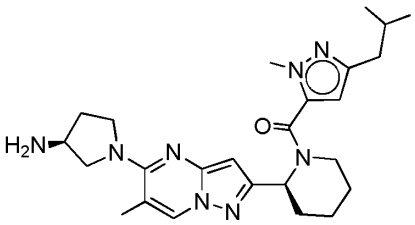
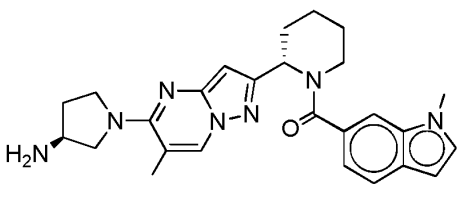
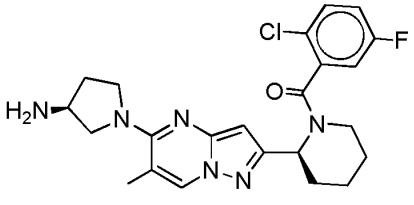
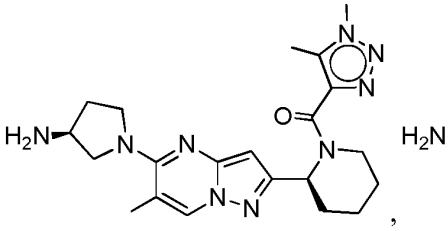
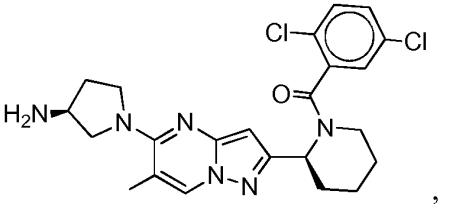

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

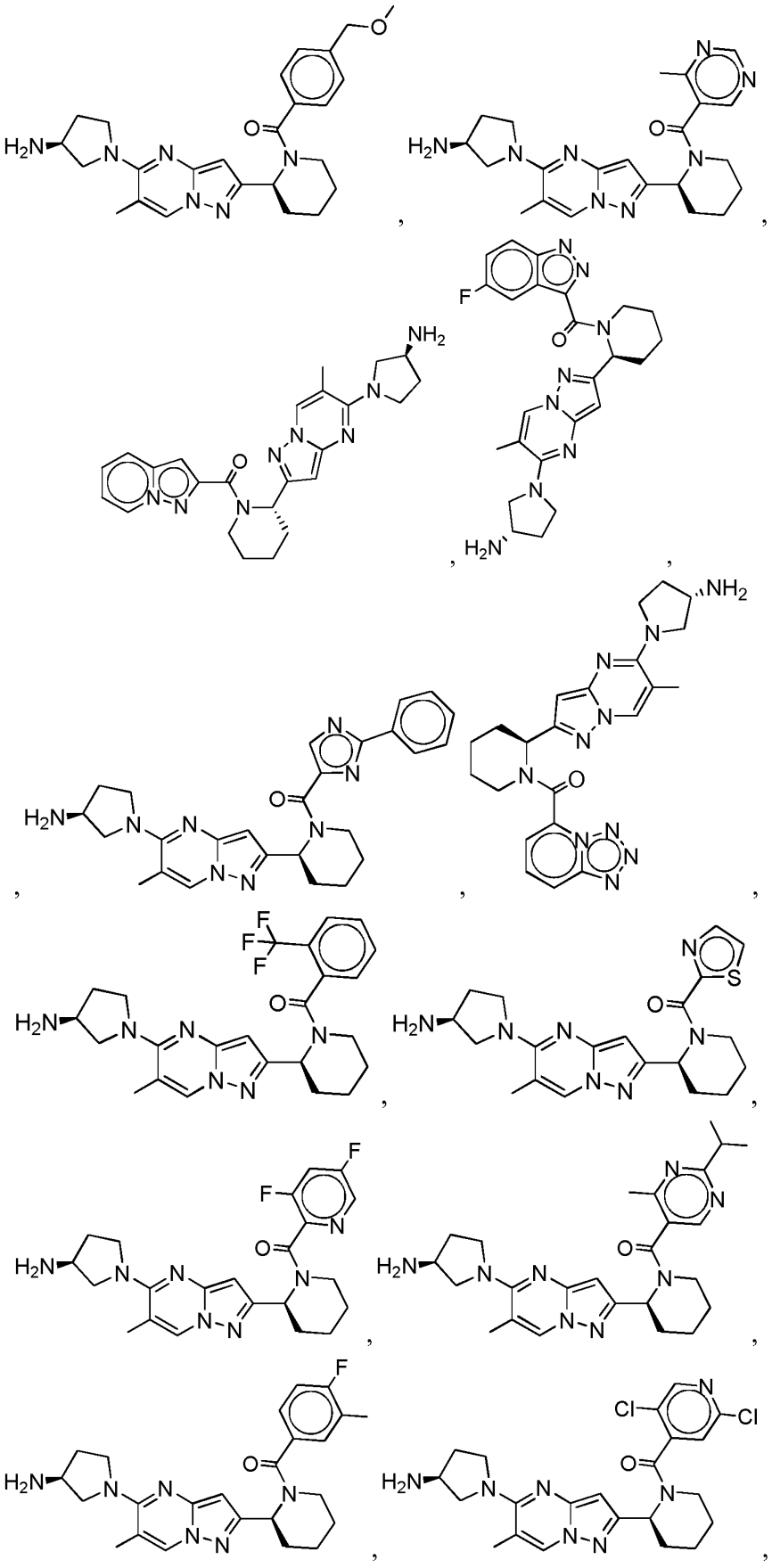

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

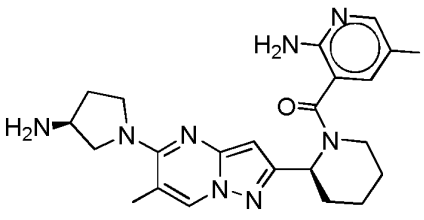
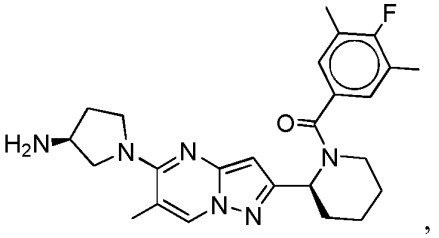




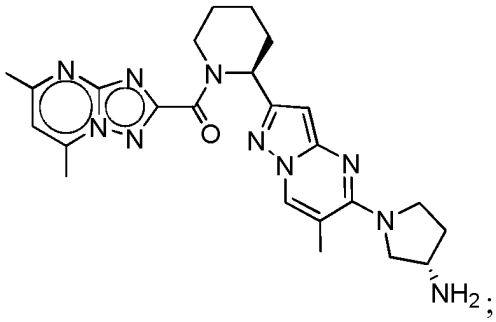

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,



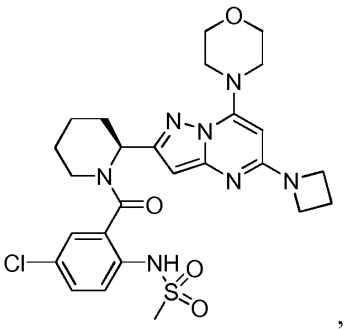
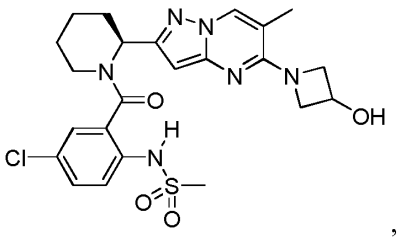

,

,

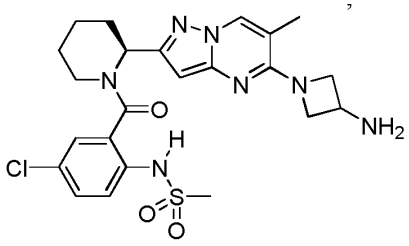
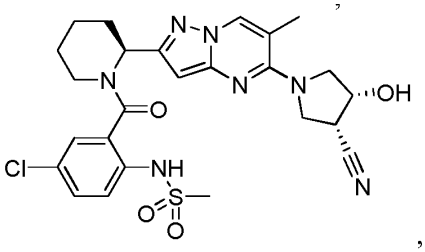
ir

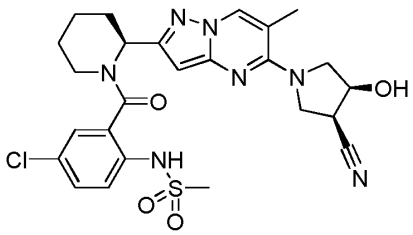
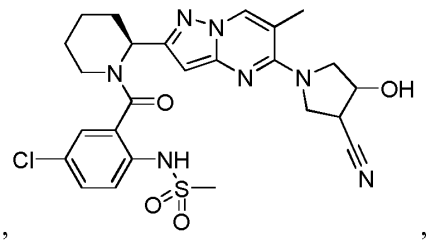

;

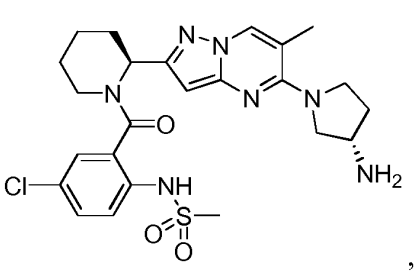
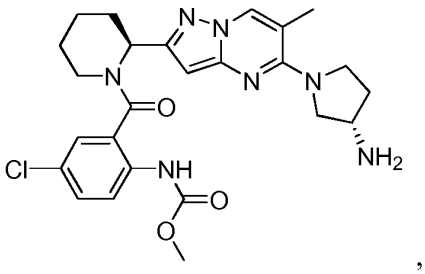
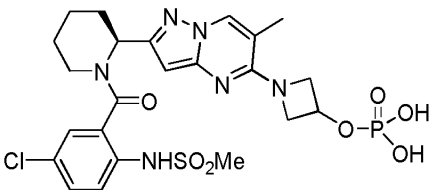
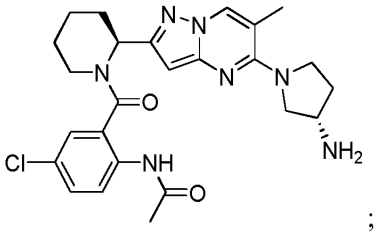
ir farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos ir esteriai.

30. Junginys pagal 1 punktą, parinktas iš grupės, susidedančios iš:


,

,

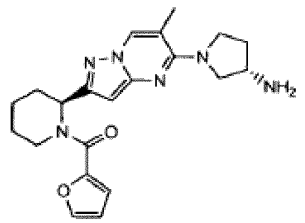
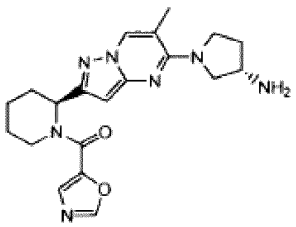
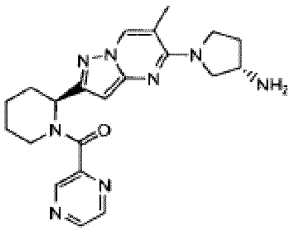
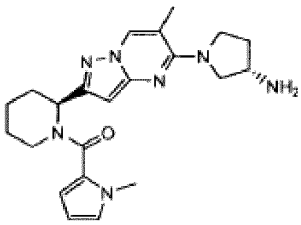
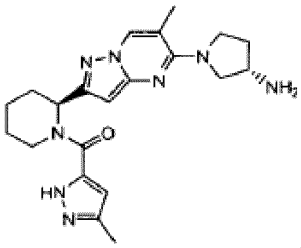
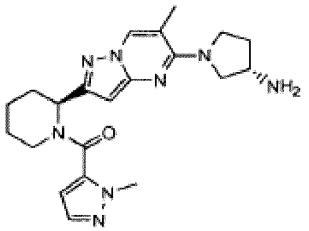
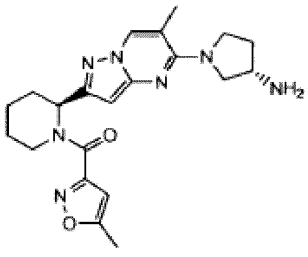
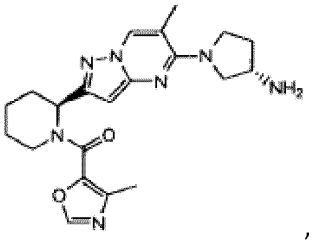
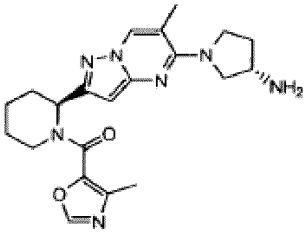
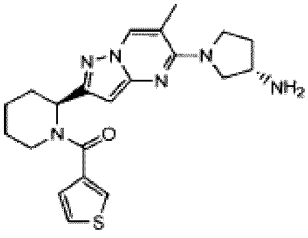
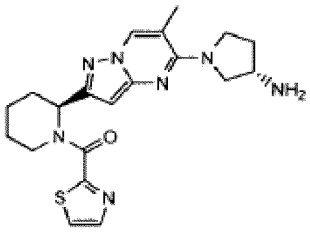
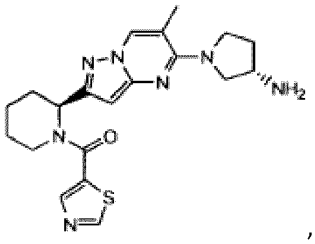
,

,

,

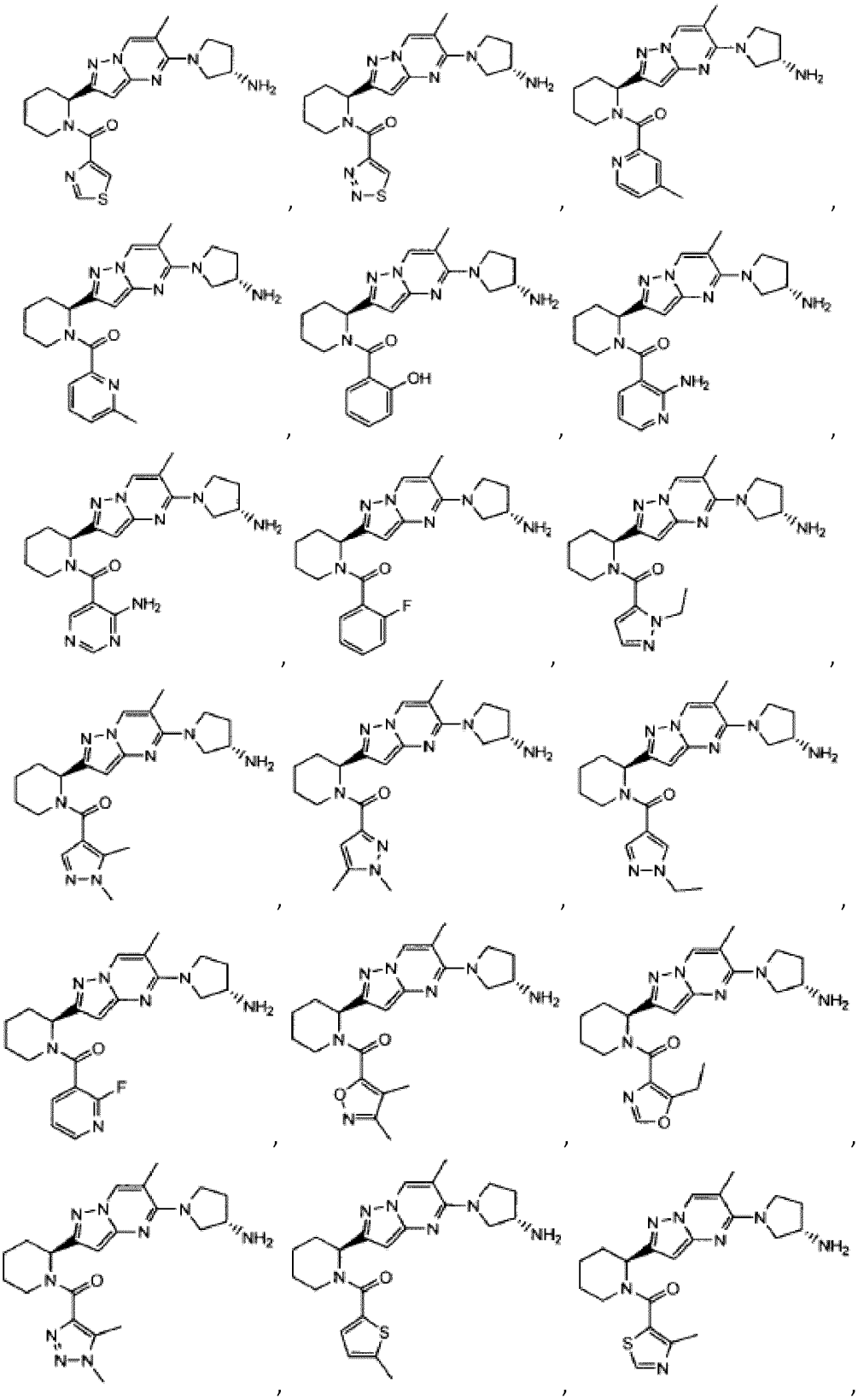

,

,

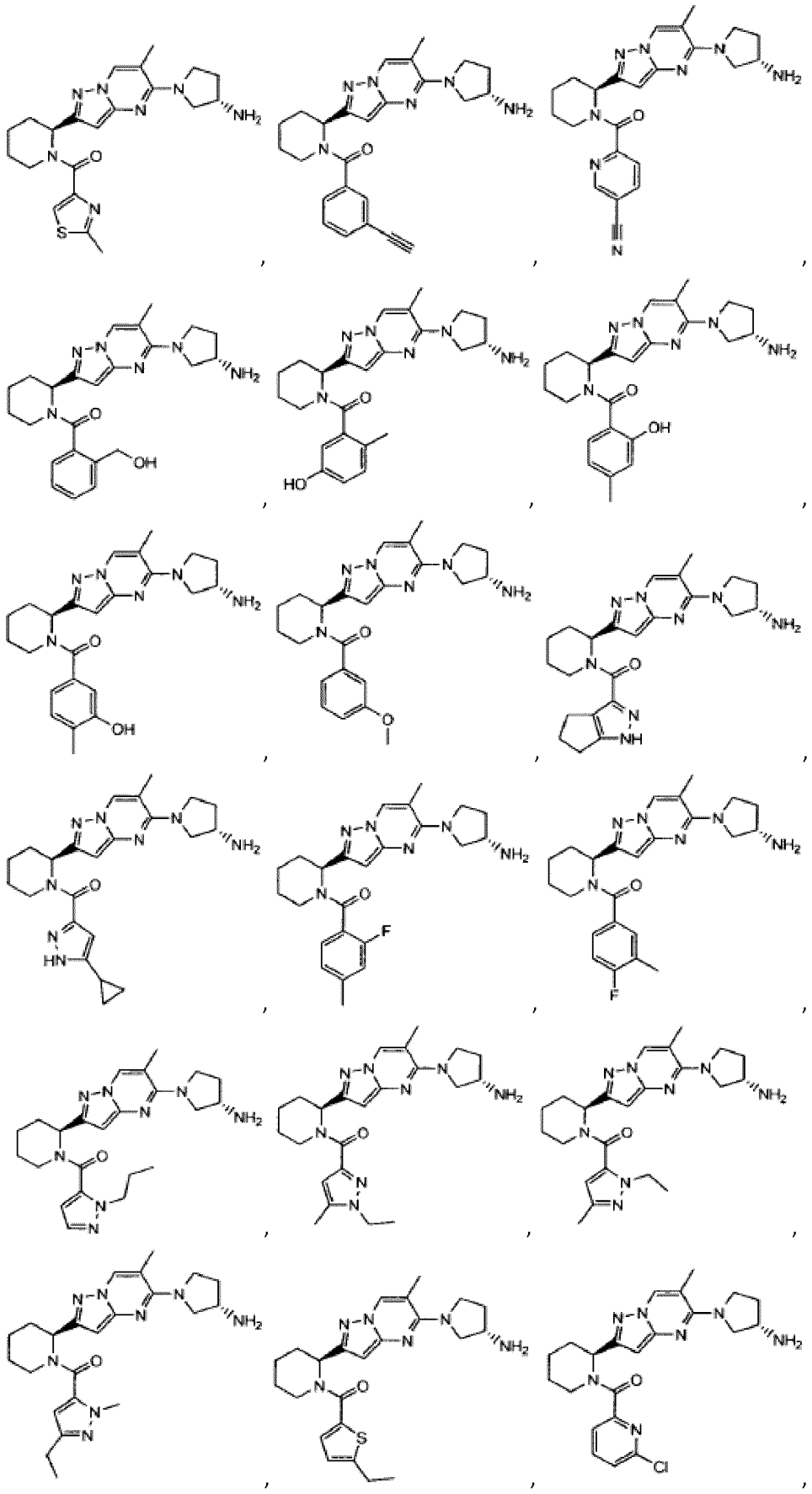

,

,

ir

;

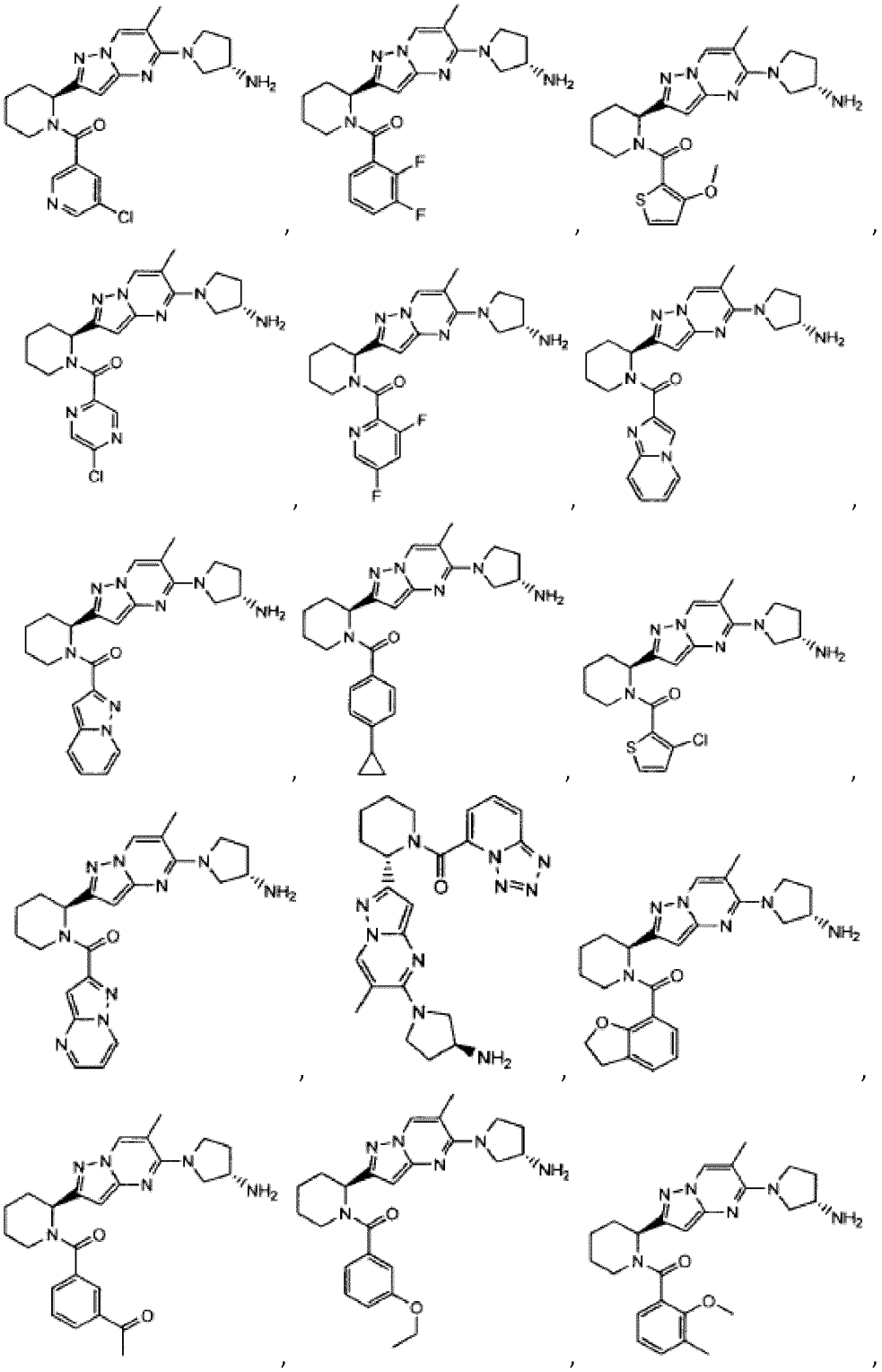
ir farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos ir esteriai.

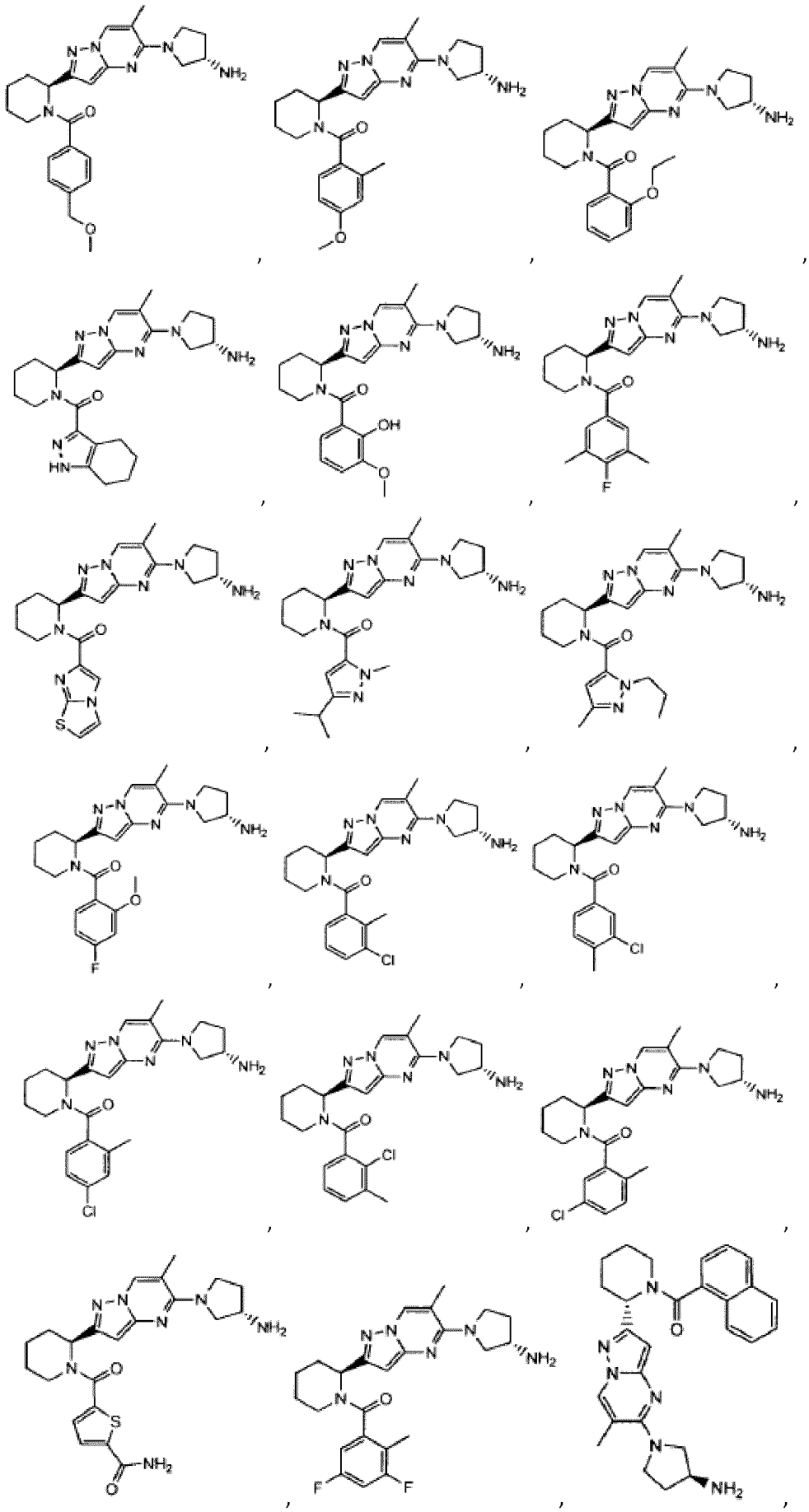
31. Junginys pagal 1 punktą, kuris yra parinktas iš

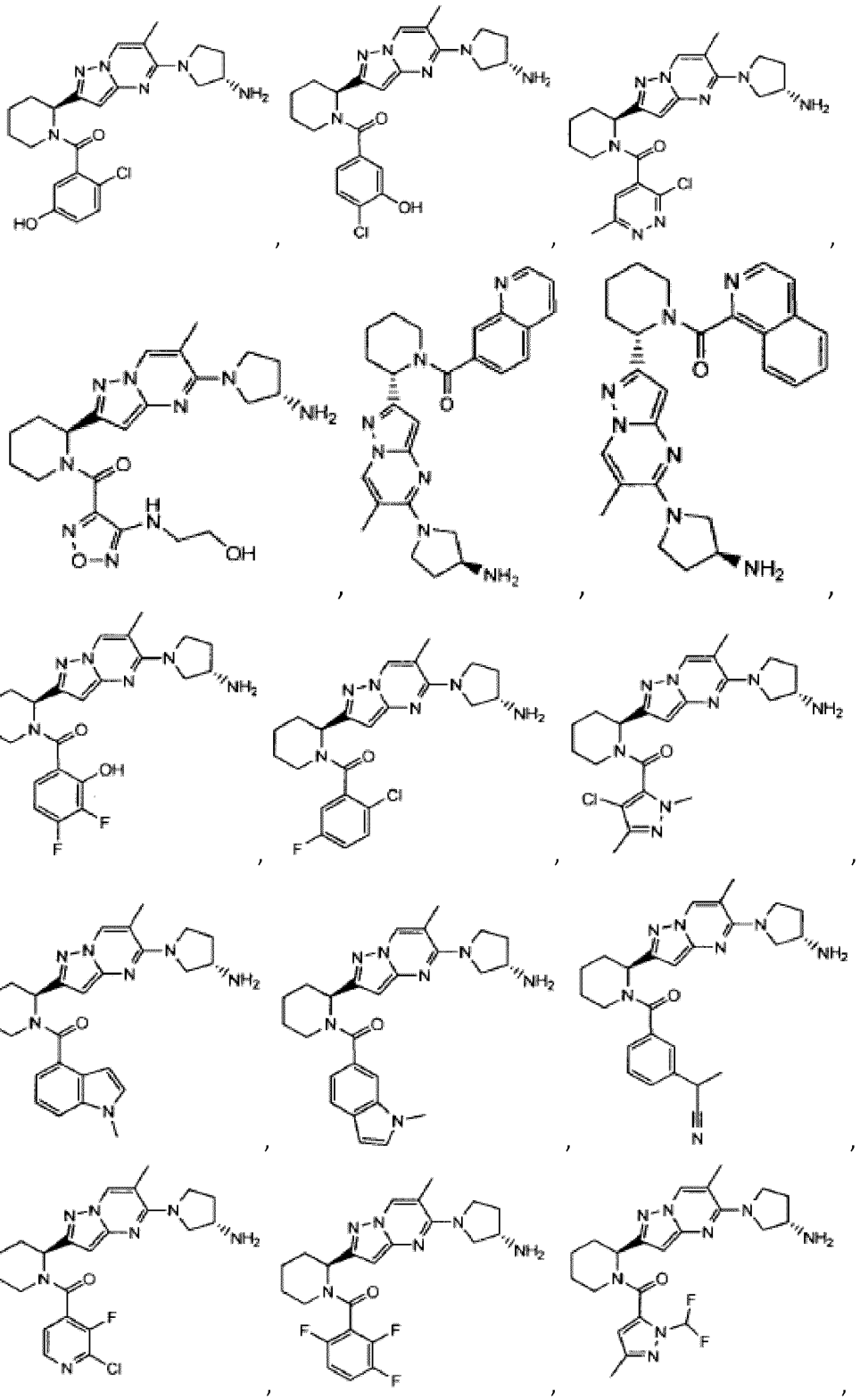

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

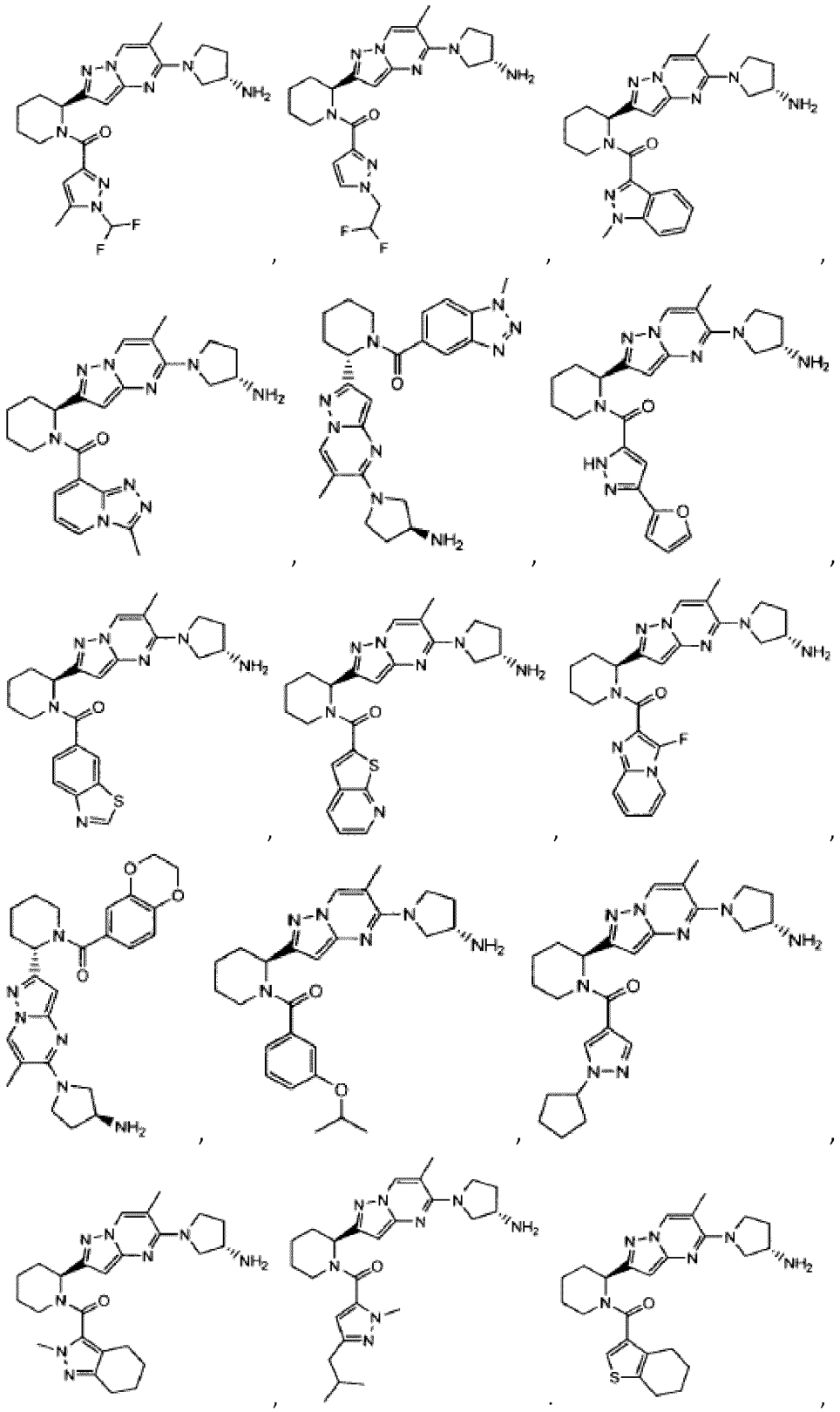


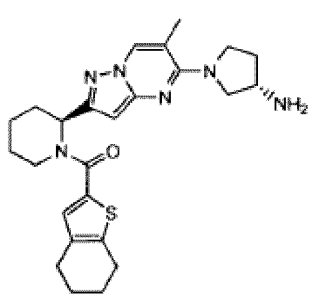
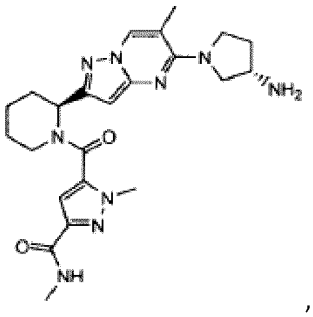
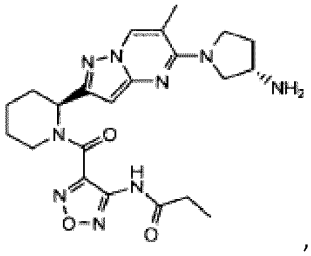
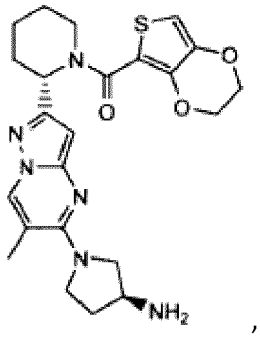
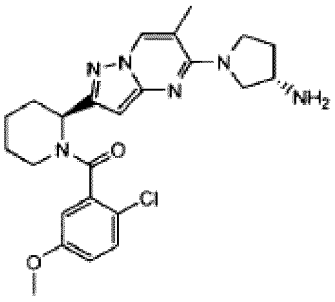
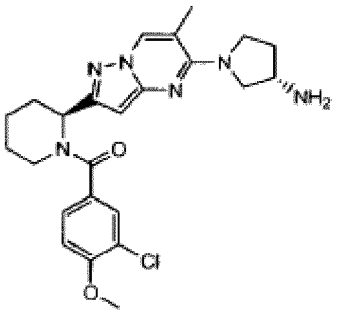
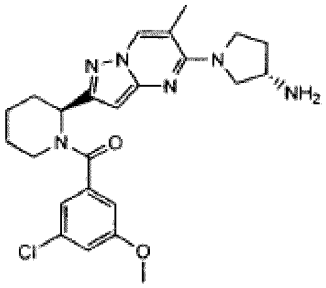
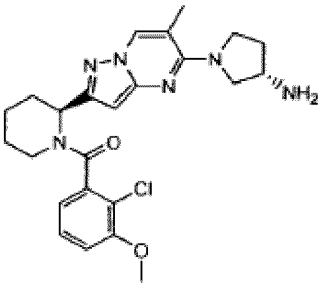
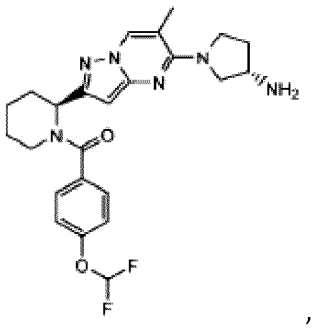
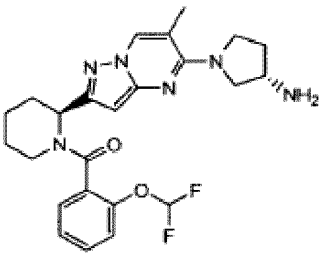
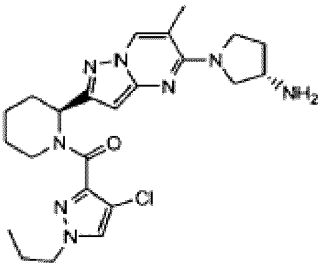
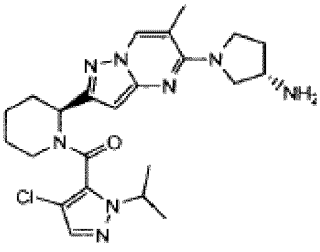
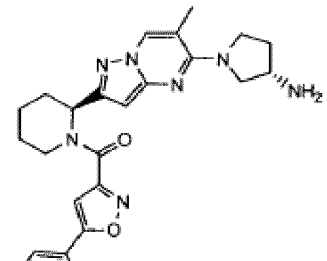
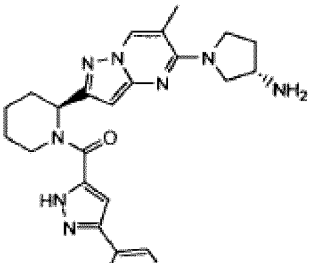
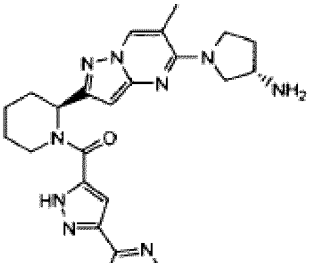








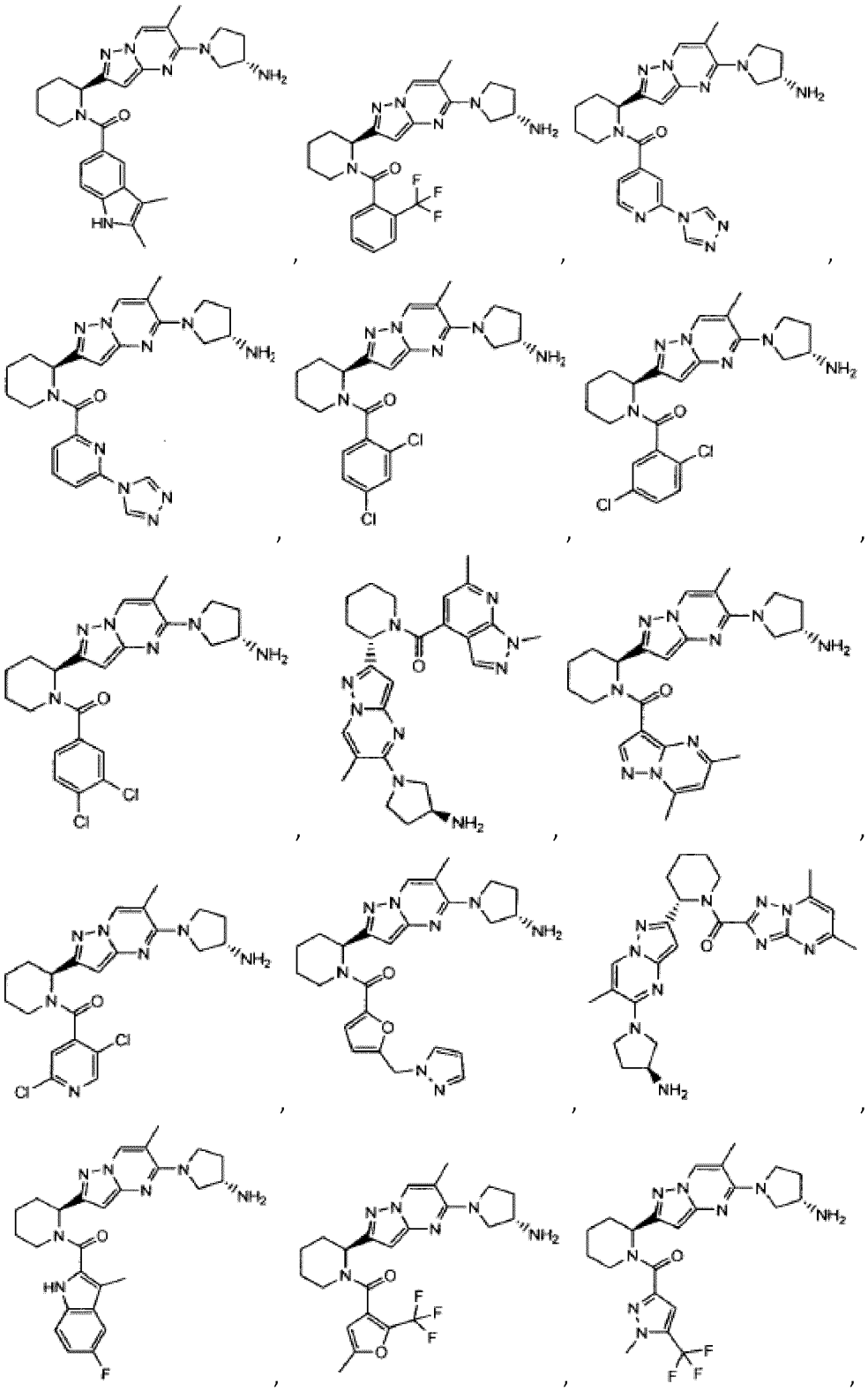


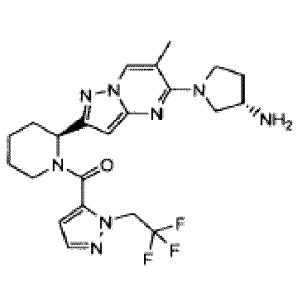
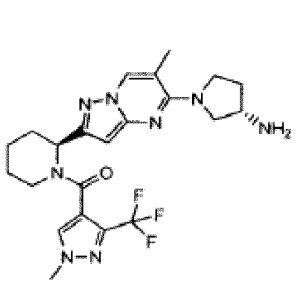
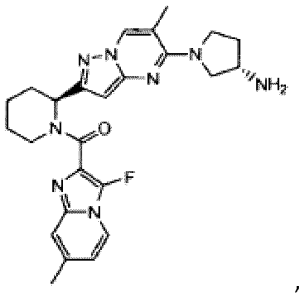
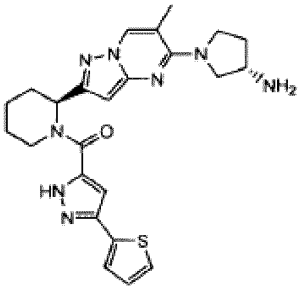
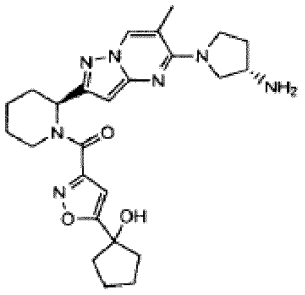
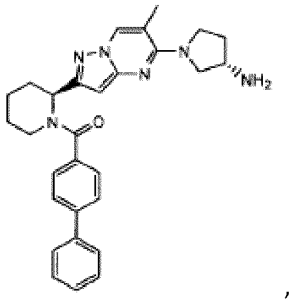
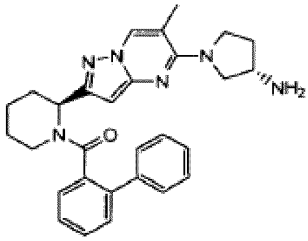
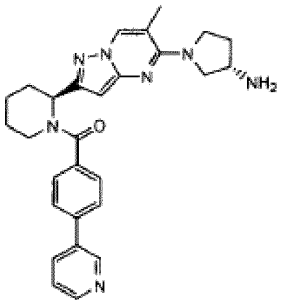
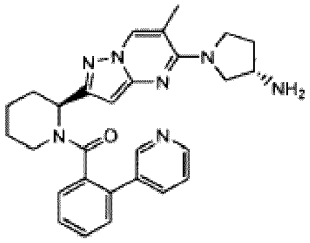
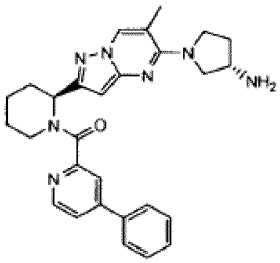
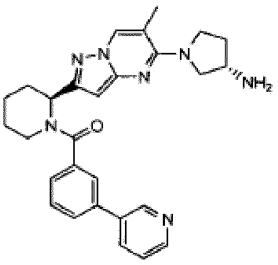
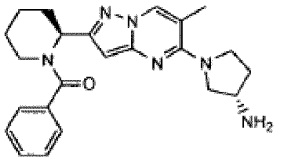

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

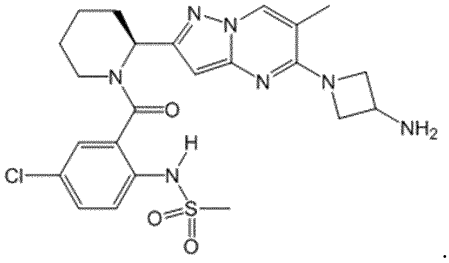
,



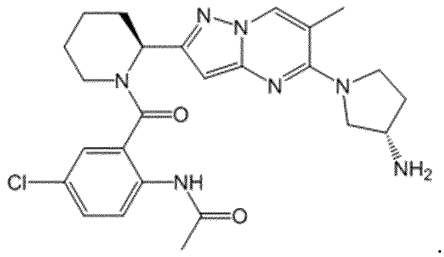

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,
ir

arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba esteris.

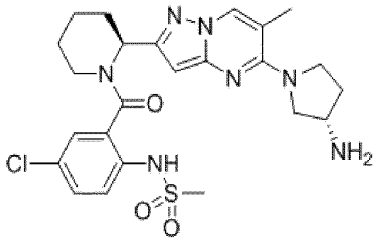
32. Junginys pagal 1 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba esteris, kur junginys turi formulę:


.

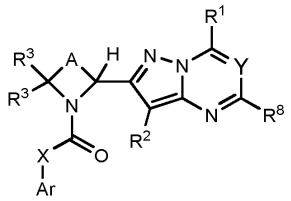
33. Junginys pagal 1 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba esteris, kur junginys turi formulę:



34. Junginys pagal 1 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba esteris, kur junginys turi formulę:



35. Farmacinė kompozicija, apimanti junginį, kurio formulė IX:



Formulė IX

arba farmaciniu požiūriu priimtiną jo druską arba esterį ir farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį, kur:

A yra $-(C(R^4)_2)_n-$, kur bet kuris $C(R^4)_2$, esantis minėtame $-(C(R^4)_2)_n-$, gali būti pasirinktinai pakeistas -O-, -S-, $S(O)_p$-, NH arba NR^a;

kiekvienas p yra 1 arba 2;

n yra 3, 4, 5 arba 6;

Ar yra C_2-C_{20} heterociklilo grupė arba C_6-C_{20} arilo grupė, kur C_2-C_{20} heterociklilo grupė arba C_6-C_{20} arilo grupė yra pasirinktinai pakeistos 1-5 grupėmis R^6,

X yra $-C(R^{13})(R^{14})-$, $-N(CH_2R^{14})-$ arba X nėra;

Y yra N arba CR^7;

kiekvienas R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 arba R^8 nepriklausomai, yra H, okso, OR^{11}, $NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(O)R^{11}$, $NR^{11}C(O)OR^{11}$, $NR^{11}C(O)NR^{11}R^{12}$, N_3, CN, NO_2, SR^{11}, $S(O)_pR^a$, $NR^{11}S(O)_pR^a$, $-C(=O)R^{11}$, $-C(=O)OR^{11}$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)SR^{11}$, $-S(O)_p(OR^{11})$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}S(O)_p(OR^{11})$, $-NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(=NR^{11})NR^{11}R^{12}$, halogenas, ($C_1$-$C_8$)alkilas, ($C_2$-$C_8$)alkenilas, ($C_2$-$C_8$)alkinilas, aril($C_1$-$C_8$)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8) karbociklilalkilas;

du R^4 prie gretimų anglies atomų kartu gali sudaryti dvigubą ryšį tarp dviejų anglies atomų, prie kurių jie yra prijungti, arba gali sudaryti (C_3-C_7)cikloalkilo žiedą, kuriame minėto (C_3-C_7)cikloalkilo žiedo vienas anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas -O-, - S-, $-S(O)_p$-, -NH- arba $-NR^a$- grupe;

keturi R^4 prie gretimų anglies atomų kartu gali sudaryti pasirinktinai pakeistą C_6 arilo žiedą;

du R^4 prie to paties anglies atomo kartu gali sudaryti (C_3-C_7)cikloalkilo žiedą, kuriame minėto (C_3-C_7)cikloalkilo žiedo vienas anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas -O-, -S-, $-S(O)_p$-, -NH- arba $-NR^a$- grupe;

du R^6 prie gretimų anglies atomų kartu gali sudaryti (C_3-C_7)cikloalkilo žiedą, kuriame minėto (C_3-C_7)cikloalkilo žiedo vienas anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas -O-, -S-, $-S(O)_p$-, -NH- arba $-NR^a$- grupe;

bet kuris R^6, gretimas minėto Ar įpareigojančiai karbonilo grupei, kartu su R^3 gali sudaryti ryšį arba $-(C(RS)_2)_m-$ grupę, kurioje m yra 1 arba 2;

bet kuris R^6, gretimas minėto Ar įpareigojančiai karbonilo grupei, kartu su R^2 gali sudaryti ryšį;

kiekvienas R^a, nepriklausomai, yra (C_1-C_8)alkilas, (C_1-C_8)halogenalkilas, (C_2-C_8)alkenilas, (C_2-C_8)alkinilas, aril(C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8)karbociklilalkilas, kur bet kuris (C_1-C_8)alkilas, (C_1-C_8)halogenalkilas, (C_2-C_8)alkenilas arba (C_2-C_8)alkinilas, esantis grupėje R^a, yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau OH, NH_2, CO_2H, C_2-C_{20} heterociklilu, ir kur bet kuris aril(C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8)karbociklilalkilas, esantis grupėje R^a, yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau OH, NH_2, CO_2H, C_2-C_{20} heterociklilu arba (C_1-C_8)alkilu;

kiekvienas R^{11} arba R^{12}, nepriklausomai, yra H, (C_1-C_8)alkilas, (C_2-C_8)alkenilas, (C_2-C_8)alkinilas, aril(C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas, (C_4-C_8)karbociklilalkilas, -C(=O)Ra, -$S(O)_pR^a$ arba aril(C_1-C_8)alkilas; arba R^{11} and R^{12} kartu su azotu, prie kurio jie abu yra prijungti, sudaro 3-7 narių heterociklinį žiedą, kur minėto heterociklinio žiedo bet kuris anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas - O-, -S-, -$S(O)_p$-, -NH-, -NR^a- arba -C(O)-grupe;

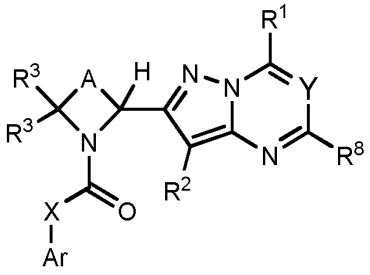
R^{13} yra H arba (C_1-C_8)alkilas;

R^{14} yra H, (C_1-C_8)alkilas, $NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(O)R^{11}$, $NR^{11}C(O)OR^{11}$, $NR^{11}C(O)NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}S(O)_pR^a$, -$NR^{11}S(O)_p(OR^{11})$ arba $NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$; ir kur kiekvienas (C_1-C_8)alkilas, (C_2-C_8)alkenilas, (C_2-C_8)alkinilas, aril(C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8)karbociklilalkilas, esantis kiekviename iš R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^{11} arba R^{12} , nepriklausomai, yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau okso, halogenu, hidroksi, NH_2, CN, N_3, $N(R^a)_2$, NHR^a, SH, SR^a, $S(O)_pR^a$, OR^a, (C_1-C_8)alkil, (C_1-C_8)halogenalkilu, -C(O)Ra, -C(O)H, -C(=O)ORa, -C(=O)OH, -C(=O)$N(R^a)_2$, -C(=O)NHR^a , -C(=O)NH_2, $NHS(O)_pR^a$, $NR^aS(O)_pR^a$, $NHC(O)R^a$, $NR^aC(O)R^a$, $NHC(O)OR^a$, $NR^aC(O)OR^a$, $NR^aC(O)NHR^a$, $NR^aC(O)N(R^a)_2$, $NR^aC(O)NH_2$, $NHC(O)NHR^a$, $NHC(O)N(R^a)_2$, $NHC(O)NH_2$, =NH, =NOH, $=NOR^a$, $NR^aS(O)_pNHR^a$, $NR^aS(O)_pN(R^a)_2$, $NR^aS(O)_pNH_2$, $NHS(O)_pNHR^a$, $NHS(O)_pN(R^a)_2$, $NHS(O)_pNH_2$, -$OC(=O)R^a$, -$OP(O)(OH)_2$ arba R^a.

36. Farmacinė kompozicija, apimanti terapiniu požiūriu efektyvų kiekį junginio pagal bet kurį iš 1-34 punktą arba jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos arba esterio, ir farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį.

37. Farmacinė kompozicija pagal 35 arba 36 punktą, papildomai apimanti bent vieną kitą terapinį agentą, parinktą iš ribavirino, palivizumabo, motavizumabo, RSV-IGIV MEDI-557, A-60444, MDT-637, BMS-433771, ALNRSV0 ir ALX-0171, arba jų mišinių.

38. Junginys, turintis formulę IX:



Formulė IX

arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba esteris, arba jo kompozicija, skirtas naudoti *Pneumovirinae* viruso infekcijos arba respiracinio sincitiumo viruso infekcijos terapiniam arba profilaktiniam gydymui;

kur:

A yra -($C(R^4)_2)_n$-, kur bet kuris $C(R^4)_2$, esantis minėtame -($C(R^4)_2)_n$-, gali būti pasirinktinai pakeistas -O-, -S-, $S(O)_p$-, NH arba NR^a;

kiekvienas p yra 1 arba 2;

n yra 3, 4, 5 arba 6;

Ar yra C_2-C_{20} heterociklilo grupė arba C_6-C_{20} arilo grupė, kur C_2-C_{20} heterociklilo grupė arba C_6-C_{20} arilo grupė yra pasirinktinai pakeistos 1-5 grupėmis R^6,

X yra -$C(R^{13})(R^{14})$-, -$N(CH_2R^{14})$- arba X nėra;

Y yra N arba CR^7;

kiekvienas R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 arba R^8 nepriklausomai, yra H, okso, OR^{11}, $NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(O)R^{11}$, $NR^{11}C(O)OR^{11}$, $NR^{11}C(O)NR^{11}R^{12}$, N_3, CN, NO_2, SR^{11}, $S(O)_pR^a$, $NR^{11}S(O)_pR^a$, -C(=O)R^{11}, -C(=O)OR^{11}, -C(=O)$NR^{11}R^{12}$, -C(=O)SR^{11}, -$S(O)_p(OR^{11})$, -$SO_2NR^{11}R^{12}$, -$NR^{11}S(O)_p(OR^{11})$, -$NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(=NR^{11})NR^{11}R^{12}$, halogenas, ($C_1$-$C_8$)alkilas, ($C_2$-$C_8$)alkenilas, ($C_2$-$C_8$)alkinilas, aril($C_1$-$C_8$)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8)karbociklilalkilas;

du R^4 prie gretimų anglies atomų kartu gali sudaryti dvigubą ryšį tarp dviejų anglies atomų, prie kurių jie yra prijungti, arba gali sudaryti (C_3-C_7)cikloalkilo žiedą, kuriame minėto (C_3-C_7)cikloalkilo žiedo vienas anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas -O-, - S-, -$S(O)_p$-, -NH- arba -NR^a- grupe;

keturi R^4 prie gretimų anglies atomų kartu gali sudaryti pasirinktinai pakeistą C_6 arilo žiedą;

du R^4 prie to paties anglies atomo kartu gali sudaryti (C_3-C_7)cikloalkilo žiedą, kuriame minėto (C_3-C_7)cikloalkilo žiedo vienas anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas -O-, -S-, -$S(O)_p$-, -NH- arba -NR^a- grupe;

du R^6 prie gretimų anglies atomų kartu gali sudaryti (C_3-C_7)cikloalkilo žiedą, kuriame minėto (C_3-C_7)cikloalkilo žiedo vienas anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas -O-, -S-, -$S(O)_p$-, -NH- arba -NR^a- grupe;

bet kuris R^6, gretimas minėto Ar įpareigojančiai karbonilo grupei, kartu su R^3 gali sudaryti ryšį arba -$(C(RS)_2)_m$- grupę, kurioje m yra 1 arba 2;

bet kuris R^6, gretimas minėto Ar įpareigojančiai karbonilo grupei, kartu su R^2 gali sudaryti ryšį;

kiekvienas R^a, nepriklausomai, yra (C_1-C_8)alkilas, (C_1-C_8)halogenalkilas, (C_2-C_8)alkenilas, (C_2-C_8)alkinilas, aril(C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8)karbociklilalkilas, kur bet kuris (C_1-C_8)alkilas, (C_1-C_8)halogenalkilas, (C_2-C_8)alkenilas arba (C_2-C_8)alkinilas, esantis grupėje R^a, yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau OH, NH_2, CO_2H, C_2-C_{20} heterociklilu, ir kur bet kuris aril(C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8)karbociklilalkilas, esantis grupėje R^a, yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau OH, NH_2, CO_2H, C_2-C_{20} heterociklilu arba (C_1-C_8)alkilu;

kiekvienas R^{11} arba R^{12}, nepriklausomai, yra H, (C_1-C_8)alkilas, (C_2-C_8)alkenilas, (C_2-C_8)alkinilas, aril(C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas, (C_4-C_8)karbociklilalkilas, -C(=O)Ra, -$S(O)_pR^a$ arba aril(C_1-C_8)alkilas; arba R^{11} and R^{12} kartu su azotu, prie kurio jie abu yra prijungti, sudaro 3-7 narių heterociklinį žiedą, kur minėto heterociklinio žiedo bet kuris anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas - O-, -S-, -$S(O)_p$-, -NH-, -NR^a- arba -C(O)- grupe;

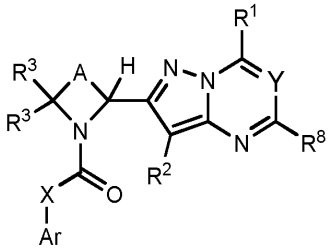
R^{13} yra H arba (C_1-C_8)alkilas;

R^{14} yra H, (C_1-C_8)alkilas, $NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(O)R^{11}$, $NR^{11}C(O)OR^{11}$, $NR^{11}C(O)NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}S(O)_pR^a$, -$NR^{11}S(O)_p(OR^{11})$ arba $NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$; ir kur kiekvienas (C_1-C_8)alkilas, (C_2-C_8)alkenilas, (C_2-C_8)alkinilas, aril(C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8)karbociklilalkilas, esantis kiekviename iš R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^{11} arba R^{12} , nepriklausomai, yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau okso, halogenu, hidroksi, NH_2, CN, N_3, $N(R^a)_2$, NHR^a, SH, SR^a, $S(O)_pR^a$, OR^a, (C_1-C_8)alkil, (C_1-C_8)halogenalkilu, -C(O)Ra, -C(O)H, -C(=O)ORa, -C(=O)OH, -$C(=O)N(R^a)_2$, -$C(=O)NHR^a$, -$C(=O)NH_2$, $NHS(O)_pR^a$, $NR^aS(O)_pR^a$, $NHC(O)R^a$, $NR^aC(O)R^a$, $NHC(O)OR^a$, $NR^aC(O)OR^a$, $NR^aC(O)NHR^a$, $NR^aC(O)N(R^a)_2$, $NR^aC(O)NH_2$, $NHC(O)NHR^a$, $NHC(O)N(R^a)_2$, NHC(O)NH_2, =NH, =NOH, $=NOR^a$, $NR^aS(O)_pNHR^a$, $NR^aS(O)_pN(R^a)_2$, $NR^aS(O)_pNH_2$, $NHS(O)_pNHR^a$, $NHS(O)_pN(R^a)_2$, NHS(O)$_pNH_2$, -OC(=O)R^a, -OP(O)$(OH)_2$ arba R^a.

39. Junginys pagal bet kurį iš 1-34 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba esteris, arba jo kompozicija, skirtas naudoti *Pneumovirinae* viruso infekcijos arba respiracinio sincitiumo viruso infekcijos terapiniam arba profilaktiniam gydymui.

40. Junginys arba kompozicija, skirti naudoti pagal 38 arba 39 punktą, papildomai apimantys įvedimą terapiniu požiūriu efektyvaus kiekio bent vieno kito terapinio agento arba jo kompozicijos, parinkto iš ribavirino, palivizumabo, motavizumabo, RSV-IGIV MEDI-557, A-60444, MDT-637, BMS-433771, ALNRSV0 ir ALX-0171, arba jų mišinių.

41. Junginys, turintis formulę IX:



Formulė IX

arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba esteris, arba jo kompozicija, skirtas naudoti medicininėje terapijoje, kur:

A yra -$(C(R^4)_2)_n$-, kur bet kuris $C(R^4)_2$, esantis minėtame -$(C(R^4)_2)_n$-, gali būti pasirinktinai pakeistas -O-, -S-, $S(O)_p$-, NH arba NR^a;

kiekvienas p yra 1 arba 2;

n yra 3, 4, 5 arba 6;

Ar yra C_2-C_{20} heterociklilo grupė arba C_6-C_{20} arilo grupė, kur C_2-C_{20} heterociklilo grupė arba C_6-C_{20} arilo grupė yra pasirinktinai pakeistos 1-5 grupėmis R^6,

X yra -C(R^{13})(R^{14})-, -N(CH_2R^{14})- arba X nėra;

Y yra N arba CR^7;

kiekvienas R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 arba R^8 nepriklausomai, yra H, okso, OR^{11}, $NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(O)R^{11}$, $NR^{11}C(O)OR^{11}$, $NR^{11}C(O)NR^{11}R^{12}$, N_3, CN, NO_2, SR^{11}, $S(O)_pR^a$, $NR^{11}S(O)_pR^a$, -C(=O)R^{11}, -C(=O)OR^{11}, -C(=O)$NR^{11}R^{12}$, -C(=O)SR^{11}, -$S(O)_p(OR^{11})$, -$SO_2NR^{11}R^{12}$, -$NR^{11}S(O)_p(OR^{11})$, -$NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(=NR^{11})NR^{11}R^{12}$, halogenas, ($C_1$-$C_8$)alkilas, ($C_2$-$C_8$)alkenilas, ($C_2$-$C_8$)alkinilas, aril($C_1$-$C_8$)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8) karbociklilalkilas;

du R^4 prie gretimų anglies atomų kartu gali sudaryti dvigubą ryšį tarp dviejų anglies atomų, prie kurių jie yra prijungti, arba gali sudaryti (C_3-C_7)cikloalkilo žiedą, kuriame minėto (C_3-C_7)cikloalkilo žiedo vienas anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas -O-, - S-, -$S(O)_p$-, -NH- arba -NR^a- grupe;

keturi R^4 prie gretimų anglies atomų kartu gali sudaryti pasirinktinai pakeistą C_6 arilo žiedą;

du R^4 prie to paties anglies atomo kartu gali sudaryti (C_3-C_7)cikloalkilo žiedą, kuriame minėto (C_3-C_7)cikloalkilo žiedo vienas anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas -O-, -S-, -$S(O)_p$-, -NH- arba -NR^a- grupe;

du R^6 prie gretimų anglies atomų kartu gali sudaryti (C_3-C_7)cikloalkilo žiedą, kuriame minėto (C_3-C_7)cikloalkilo žiedo vienas anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas -O-, -S-, -$S(O)_p$-, -NH- arba -NR^a- grupe;

bet kuris R^6, gretimas minėto Ar įpareigojančiai karbonilo grupei, kartu su R^3 gali sudaryti ryšį arba -$(C(RS)_2)_m$- grupę, kurioje m yra 1 arba 2;

bet kuris R^6, gretimas minėto Ar įpareigojančiai karbonilo grupei, kartu su R^2 gali sudaryti ryšį;

kiekvienas R^a, nepriklausomai, yra (C_1-C_8)alkilas, (C_1-C_8)halogenalkilas, (C_2-C_8)alkenilas, (C_2-C_8)alkinilas, aril(C_1-C_8) alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8)karbociklilalkilas, kur bet kuris (C_1-C_8)alkilas, (C_1-C_8)halogenalkilas, (C_2-C_8)alkenilas arba (C_2-C_8)alkinilas, esantis grupėje R^a, yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau OH, NH_2, CO_2H, C_2-C_{20} heterociklilu, ir kur bet kuris aril(C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8)karbociklilalkilas, esantis grupėje R^a, yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau OH, NH_2, CO_2H, C_2-C_{20} heterociklilu arba (C_1-C_8)alkilu;

kiekvienas R^{11} arba R^{12}, nepriklausomai, yra H, (C_1-C_8)alkilas, (C_2-C_8)alkenilas, (C_2-C_8)alkinilas, aril(C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas, (C_4-C_8)karbociklilalkilas, -C(=O)Ra, -$S(O)_pR^a$ arba aril(C_1-C_8) alkilas; arba R^{11} and R^{12} kartu su azotu, prie kurio jie abu yra prijungti, sudaro 3-7 narių heterociklinį žiedą, kur minėto heterociklinio žiedo bet kuris anglies atomas gali būti pasirinktinai pakeistas - O-, -S-, -$S(O)_p$-, -NH-, -NR^a- arba -C(O)- grupe;

R^{13} yra H arba (C_1-C_8)alkilas;

R^{14} yra H, (C_1-C_8)alkilas, $NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}C(O)R^{11}$, $NR^{11}C(O)OR^{11}$, $NR^{11}C(O)NR^{11}R^{12}$, $NR^{11}S(O)_pR^a$, -$NR^{11}S(O)_p(OR^{11})$ arba $NR^{11}SO_pNR^{11}R^{12}$; ir kur kiekvienas (C_1-C_8)alkilas, (C_2-C_8)alkenilas, (C_2-C_8)alkinilas, aril(C_1-C_8)alkilas, C_6-C_{20} arilas, C_2-C_{20} heterociklilas, (C_3-C_7)cikloalkilas arba (C_4-C_8)karbociklilalkilas, esantis kiekviename iš R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^{11} arba R^{12}, nepriklausomai, yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau okso, halogenu, hidroksi, NH_2, CN, N_3, $N(R^a)_2$, NHR^a, SH, SR^a, $S(O)_pR^a$, OR^a, (C_1-C_8)alkil, (C_1-C_8)halogenalkilu, -C(O)Ra, -C(O)H, -C(=O)ORa, -C(=O)OH, -C(=O)$N(R^a)_2$, -C(=O)NHR^a , -C(=O)NH_2, $NHS(O)_pR^a$, $NR^aS(O)_pR^a$, $NHC(O)R^a$, $NR^aC(O)R^a$, $NHC(O)OR^a$, $NR^aC(O)OR^a$, $NR^aC(O)NHR^a$, $NR^aC(O)N(R^a)_2$, $NR^aC(O)NH_2$, $NHC(O)NHR^a$, $NHC(O)N(R^a)_2$, $NHC(O)NH_2$, =NH, =NOH, $=NOR^a$, $NR^aS(O)_pNHR^a$, $NR^aS(O)_pN(R^a)_2$, $NR^aS(O)_pNH_2$, $NHS(O)_pNHR^a$, $NHS(O)_pN(R^a)_2$, $NHS(O)_pNH_2$, -$OC(=O)R^a$, -OP(O)$(OH)_2$ arba R^a.

42. Junginys pagal bet kurį iš 1-34 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba esteris, arba jo kompozicija, skirtas naudoti medicininėje terapijoje.

43. Junginys arba kompozicija, skirti naudoti pagal 41 arba 42 punktą, papildomai apimantys įvedimą terapiniu požiūriu efektyvaus kiekio bent vieno kito terapinio agento arba jo kompozicijos, parinkto iš grupės, susidedančios iš ribavirino, palivizumabo, motavizumabo, RSV-IGIV, MEDI-557, A-60444, MDT-637, BMS-433771, ALNRSV0 ir ALX-0171, arba jų mišinių.

---

(51) Int.Cl. ***C07H 17/08*** (2006.01)
A61K 31/7048 (2006.01)
A61P 31/04 (2006.01)

(11) **2678349**

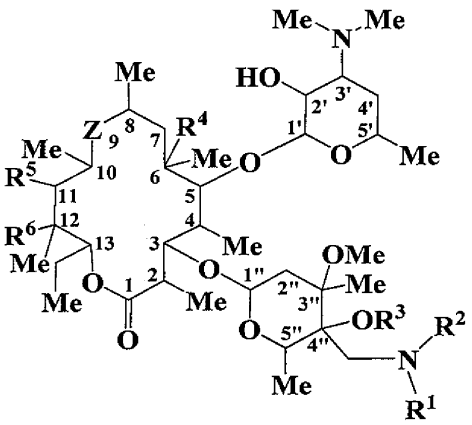
(96) 12749570.3

(96) 2012-02-20

(97) 2014-01-01

(97) 2016-01-13
(86) PCT/JP2012/054677
(86) 2012-02-20
(87) WO 2012/115256
(87) 2012-08-30
(30) 2011034578, 2011-02-21, JP
(72) SUGIMOTO, Tomohiro, JP
SASAMOTO, Naoki, JP
KUROSAKA, Jun, JP
HAYASHI, Masato, JP
YAMAMOTO, Kanako, JP
KASHIMURA, Masato, JP
USHIKI, Yasunobu, JP
OGITA, Haruhisa, JP
MIURA, Tomoaki, JP
KANEMOTO, Kenichi, JP
KUMURA, Kou, JP
YOSHIDA, Satoshi, JP
TAMURA, Keiji, JP
SHITARA, Eiki, JP
(73) Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., Tokyo 170-8633, JP
(74) Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) C-4“ padėtyje pakeisto makrolido darinys
Apibrėžties punktai: 23, brėžiniai: 0.
(57) 1. Junginys, vaizduojamas formule (I):

[Formulė 1]



(I)

kur formulėje

Me reiškia metilo grupę,

R^1 reiškia C_{1-6} alkilo grupę (C_{1-6} alkilo grupė gali būti pakeista vienu arba dviem pakaitais, parinktais iš hidroksi grupės, C_{1-6} alkoksi grupės, amino grupės, C_{1-6} alkilamino grupės ir grupės, vaizduojamos formule $-NR^{78}COR^{79}$, arba formule $-NR^{80}SO_2R^{81}$, R^{78} ir R^{80}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą arba C_{1-6} alkilo grupę, ir R^{79} ir R^{81}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia C_{1-6} alkilo grupę), arba C_{1-6} alkilsulfonilo grupę,

R^2 reiškia 4-8-narių sočią heterociklinę grupę (soti heterociklinė grupė gali būti pakeista vienu arba dviem pakaitais, parinktais iš C_{7-12} arilalkilo grupės ir C_{1-6} alkilo grupės), C_{1-6} alkanoilo grupę (C_1-6 alkanoilo grupė gali būti pakeista amino grupe arba C_{1-6} alkilamino grupe), arba C_{1-6} alkil grupę, kuri gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš pakaitų grupės 1, arba R^1 ir R^2 kartu su azoto atomu, prie kurio jie yra prijungti, gali sudaryti 4- to 8-narių sočią azotą turinčią heterociklinę grupę (soti azotą turinti heterociklinė grupė gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš hidroksi grupės, amino grupės, C_{1-6} alkilamino grupės ir C_{1-6} alkilo grupės (C_{1-6} alkilo grupė gali būti pakeista amino grupe arba C_{1-6} alkilamino grupe)), pakaitų grupė 1 yra grupė, susidedanti iš C_{1-6} alkilsulfonilo grupės, C_{1-6} alkoksi grupės, C_{3-6} cikloalkilo grupės, hidroksi grupės, fenilo grupės (fenilo grupė gali būti pakeista 1-3 C_{1-6} alkoksi grupėmis), 4-8-narių sočios heterociklinės grupės (soti heterociklinė grupė gali būti pakeista 1-3 C_{1-6}

alkilo grupėmis), ir grupės, vaizduojamos formule -CONR^{7}R^{8}, formule -SO$_2$NR^{9}R^{10}, formule -NR^{11}COR^{12}, formule -NR^{13}CO$_2$R^{14}, formule -NR^{15}SO$_2$R^{16}, arba formule -NR^{17}R^{18},

R^{7}, R^{8}, R^{9}, R^{10}, R^{11}, R^{13}, R^{14}, ir R^{15}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą arba C_{1-6} alkilo grupę,

R^{12} reiškia fenilo grupę (fenilo grupė gali būti pakeista 1-3 C_{1-6} alkoksi grupėmis),

R^{16} reiškia C_{1-6} alkoksi grupę arba fenilo grupę (fenilo grupė gali būti pakeista 1-3 C_{1-6} alkoksi grupėmis),

R^{17} ir R^{18}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą, C_{1-6} alkilo grupę (C_{1-6} alkilo grupė gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš grupės, C_{1-6} alkoksi grupės ir C_{3-6} cikloalkilo grupės), C_{2-6} alkenilo grupės, C_{3-6} cikloalkilo grupės, C_{1-6} alkanoilo grupės, C_{7-12} arilalkilo grupės (C_{7-12} arilalkilo grupė gali būti pakeista 1-3 C_{1-6} alkoksi grupėmis), arba heteroarilalkilo grupės (heteroarilalkilo grupė gali būti pakeista 1-3 C_{1-6} alkoksi grupėmis), arba R^{17} ir R^{18} kartu su azoto atomu, prie kurio jie yra prijungti, sudaro 4-8-narių sotų azotą turinčią heterociklinę grupę, kuri gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš pakaitų grupės 2, arba 6-narių iš dalies neprisotintą azotą turinčią heterociklinę grupę, kuri gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš pakaitų grupės 2, pakaitų grupė 2 yra grupė, susidedanti iš hidroksi grupės, C_{1-6} alkoksi grupės, okso grupės, C_{1-6} alkoksiimino grupės, amino grupės, C_{1-6} alkilamino grupės, grupės, vaizduojamos formule -CONR^{19}R^{20} (R^{19} ir R^{20}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą arba C_{1-6} alkilo grupę), C_{1-6} halogenalkilo grupės ir C_{1-6} alkilo grupės (C_{1-6} alkilo grupė gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš hidroksi grupės, C_{1-6} alkoksi grupės, amino grupės ir C_{1-6} alkilamino grupės),

R^{3} reiškia vandenilio atomą arba R^{3} ir R^{1} kartu gali sudaryti karbonilo grupę,

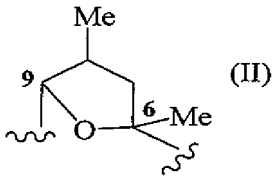
R^{4} reiškia hidroksi grupę, C_{1-6} alkilo grupę arba grupę, vaizduojamą formule OCONR^{21}R^{22} (R^{21} ir R^{22}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą, C_{1-6} alkilo grupę arba C_{2-6} alkenilo grupę, pakeistą viena heteroarilo grupe),

Z reiškia grupę, vaizduojamą formule CHR^{23} (R^{23} reiškia hidroksi grupę arba amino grupę), formule C(=O) arba formule C(=N-OR^{24}),

R^{24} reiškia vandenilio atomą, C_{1-6} alkilo grupę (C_{1-6} alkilo grupė gali būti pakeista C_{1-6} alkoksi grupe, amino grupe arba C_{1-6} alkilamino grupe), arba 4- to 8-narių sočią heterociklinę grupę, arba

R^{4} ir Z kartu su anglies atomais, prie kurių jie yra prijungti gali sudaryti ciklinę struktūrą, vaizduojamą formule (II):

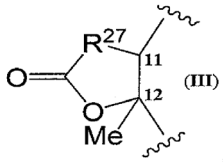
[Formulė 2]



(II)

R^{5} ir R^{6} kartu su anglies atomais, prie kurių jie yra prijungti, reiškia ciklinę struktūrą, vaizduojamą formule (III):

[Formulė 3]



(III)

R^{27} reiškia deguonies atomą arba grupę, vaizduojamą formule CHR^{28} arba formule NR^{29},

R^{28} reiškia vandenilio atomą, ciano grupę arba C_{1-6} alkilsulfanilo grupę (C_{1-6} alkilsulfanilo grupė gali būti pakeista heteroarilo grupe, kuri gali būti pakeista viena amino grupe),

R^{29} reiškia vandenilio atomą, hidroksi grupę, C_{1-6} alkoksi grupę (C_{1-6} alkoksi grupė gali būti pakeista fenilo grupe), 4- to 8-narių sočią heterociklinę grupę (soti heterociklinė grupė gali būti pakeista C_{1-6} alkilsulfonilo grupe arba difenilmetilo grupe), grupę, vaizduojamą formule -NR^{30}R^{31}, formule -NR^{32}CSNR^{33}R^{34}, formule -NR^{32}CO$_2$R^{35}, formule -NR^{32}COR^{36}, formule - NR^{32}SO$_2$R^{37}, formule -NR^{32}CONR^{38}R^{39}, formule -NR^{32}SO$_2$NR^{40}R^{41} arba formule -N=C-NR^{42}R^{43}, arba C_{1-6} alkilo grupę, kuri gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš pakaitų grupės 3,

R^{30} ir R^{31}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą arba C_{1-6} alkilo grupę (C_{1-6} alkilo grupė gali būti pakeista C_{1-6} alkilsulfonilo grupe, fenilo grupe arba heteroarilo grupe),

R^{32}, R^{33}, R^{34}, R^{37}, R^{40}, R^{41}, R^{42}, ir R^{43}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą arba C_{1-6} alkilo grupę,

R^{35} reiškia vandenilio atomą, C_{1-6} alkilo grupę arba C_{7-12} arilalkilo grupę,

R^{36} reiškia vandenilio atomą, C_{1-6} alkilo grupę (C_{1-6} alkilo grupė gali būti pakeista C_{1-6} alkilsulfonilo grupe), arba C_{7-12} arilalkilo grupę,

R^{38} ir R^{39}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą, C_{1-6} alkilo grupę (C_{1-6} alkilo grupė gali būti pakeista C_{3-6} cikloalkilo grupe), C_{2-6} alkenilo grupę, C_{7-12} arilalkilo grupę (C_{7-12} arilalkilo grupė gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš halogeno atomo, C_{1-6} alkilo grupės ir C_{1-6} alkoksi grupės), arba heteroarilalkilo grupę,

pakaitų grupė 3 yra grupė, susidedanti iš hidroksi grupės, C_{1-6} alkoksi grupės, C_{3-6} cikloalkilo grupės, C_{1-6} alkilsulfanilo grupės, C_{1-6} alkilsulfinilo grupės, C_{1-5} alkilsulfonilo grupės, fenilo grupės, fenoksi grupės, benziloksi grupės, fenilsulfanilo grupės, fenilsulfonilo grupės, ciano grupės, C_{7-12} arilalkilo grupės, 4-8-narių sočios heterociklinės grupės (soti heterociklinė grupė gali būti pakeista C_{1-6} alkilsulfonilo grupe arba difenilmetilo grupe), heteroarilo grupės (heteroarilo grupė gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš C_{1-6} alkilo grupės, C_{7-12} arilalkilo grupės, fenilo grupės ir heteroarilo grupės), ir grupės, vaizduojamos formule - $NR^{44}CO_2R^{45}$, formule -$OSO_2NR^{46}R^{47}$, formule -$NR^{49}SO_2NR^{50}R^{51}$, formule -$CONR^{52}SO_2NR^{53}R^{54}$, formule -$OCONR^{55}R^{56}$, formule -$NR^{57}COR^{58}$, formule -$CONR^{59}R^{80}$, formule -$NR^{61}CONR^{62}R^{63}$, formule -$OCOR^{64}$, formule -$SO_2NR^{65}R^{66}$, formule -$NR^{67}SO_2R^{68}$, formule -$NR^{69}R^{70}$, arba formule -$CONR^{71}SO_2R^{72}$,

R^{44} - R^{57}, R^{61}, R^{67}, R^{71} ir R^{72}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą arba C_{1-6} alkilo grupę,

R^{58} reiškia C_{1-6} alkilo grupę, C_{1-6} halogenalkilo grupę arba fenilo grupę,

R^{59} ir R^{60}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą, C_{1-6} alkilo grupę, fenilo grupę, C_{7-12} arilalkilo grupę arba heteroarilalkilo grupę,

R^{62} ir R^{63}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą arba C_{1-6} alkilo grupę (C_{1-6} alkilo grupė gali būti pakeista amino grupe arba C_{1-6} alkilamino grupe),

R^{64} reiškia C_{1-6} alkilo grupę arba fenilo grupę,

R^{65} ir R^{56}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą, C_{1-6} alkilo grupę arba fenilo grupę,

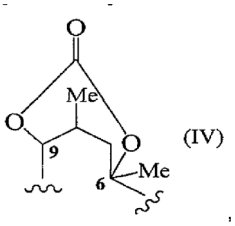
R^{68} reiškia C_{1-6} alkilo grupę, C_{1-6} halogenalkilo grupę, C_{3-6} cikloalkilo grupę, fenilo grupę (fenilo grupė gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš C_{1-6} alkilo grupės, C_{1-6} alkilsulfonilo grupės, C_{1-6} alkoksi grupės, ciano grupės ir karboksi grupės), arba heteroarilo grupę, kuri gali būti pakeista 1-3 C_{1-6} alkilo grupėmis,

R^{69} ir R^{70}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą, C_{1-6} alkilo grupę, fenilo grupę, heteroarilo grupę, kuri gali būti pakeista viena ciano grupe, C_{7-12} arilalkilo grupę, arba heteroarilalkilo grupę, arba

R^{69} ir R^{70} kartu su azoto atomu, prie kurio jos yra prijungtos, gali sudaryti 4-8-narių sočią azotą turinčią heterociklinę grupę (soti azotą turinti heterociklinė grupė gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš C_{1-6} alkilo grupės ir okso grupės),

kai R^{27} yra deguonies atomas, R^4 ir gali kartu su anglies atomais, prie kurių jie yra prijungti, reikšti ciklinę struktūrą, vaizduojamą formule (IV):

[Formulė 4]



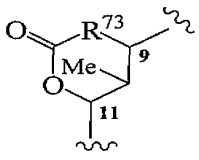
(IV)

,

arba

R^5 ir Z kartu gali reikšti ciklinę struktūrą, vaizduojamą formule (V);

[Formulė 5]



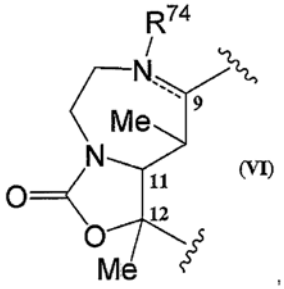
(V)

,

R^{73} reiškia deguonies atomą arba grupę, vaizduojamą formule NH, arba

R^5, R^6 ir Z kartu gali reikšti ciklinę struktūrą, vaizduojamą formule (VI):

[Formulė 6]

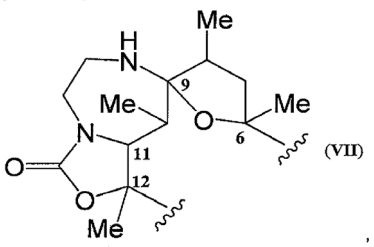


kur dvigubas ryšys su punktyrine linija reiškia viengubą ryšį arba dvigubą ryšį, ir

R^{74} egzistuoja tiktai tada, kai dvigubas ryšys su punktyrine linija reiškia viengubą ryšį, ir jis reiškia vandenilio atomą, arba

R^5, R^6, Z ir R^4 kartu gali reikšti ciklinę struktūrą, vaizduojamą formule (VII):

[Formulė 7]



arba jo druska arba hidratas, arba solvatas.

2. Junginys pagal 1 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^1 yra C_{1-6} alkilo grupė arba C_{1-6} alkilsulfonilo grupė,

R^2 yra 4-8-narių soti heterociklinė grupė (soti heterociklinė grupė gali būti pakeista vienu arba dviem pakaitais, parinktais iš C_{7-12} arilalkilo grupės ir C_{1-6} alkilo grupės), C_{1-6} alkanoilo grupė (C_{1-6} alkanoilo grupė gali būti pakeista amino grupe arba C_{1-6} alkilamino grupe), arba C_{1-6} alkilo grupė, kuri gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš pakaitų grupės 1,

arba R^1 ir R^2 kartu su azoto atomu, prie kurio jie yra prijungti, gali sudaryti 4-8-narių sočią azotą turinčią heterociklinę grupę (soti azotą turinti heterociklinė grupė gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš hidroksi grupės, amino grupės, C_{1-6} alkilamino grupės ir C_{1-6} alkilo grupės (C_{1-6} alkilo grupė gali būti pakeista amino grupe arba C_{1-6} alkilamino grupe)), ir

R^{38} ir R^{39}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą, C_{1-6} alkilo grupę (C_{1-6} alkilo grupė gali būti pakeista C_{3-6} cikloalkilo grupe), C_{7-12} arilalkilo grupę (C_{7-12} arilalkilo grupė gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš halogeno atomo, C_{1-6} alkilo grupės ir C_{1-6} alkoksi grupės) arba heteroarilalkilo grupę.

3. Junginys pagal 1 arba 2 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^2 yra C_{1-6} alkilo grupė, pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš pakaitų grupės 1.

4. Junginys pagal 1 arba 2 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^2 yra C_{1-6} alkilo grupė, pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš pakaitų grupės 4,ir pakaitų grupė 4 yra grupė, susidedanti iš hidroksi grupės ir grupės, vaizduojamos formule $-NR^{17}R^{18}$.

5. Junginys pagal 4 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^{17} ir R^{18}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą arba C_{1-6} alkilo grupę (C_{1-6} alkilo grupė gali būti pakeista C_{3-6} cikloalkilo grupe).

6. Junginys pagal 1 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^{27} yra grupė, vaizduojama formule NR^{29}.

7. Junginys pagal 6 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^{29} yra vandenilio atomas, grupė, vaizduojama formule $-NR^{30}R^{31}$, formule $-NR^{32}CO_2R^{35}$, formule $-NR^{32}SO_2R^{37}$, formule $-NR^{32}CONR^{38}R^{39}$, arba formule $-NR^{32}SO_2NR^{40}R^{41}$, arba C_{1-6} alkilo grupė, pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš pakaitų grupės 3.

8. Junginys pagal 6 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^{29} yra C_{1-6} alkilo grupė, pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš pakaitų grupės 5, ir pakaitų grupė 5 yra grupė, susidedanti iš hidroksi grupės, C_{1-6} alkilsulfonilo grupės, 4-8-narių sočios heterociklinės grupės (soti heterociklinė grupė gali būti pakeista C_{1-6} alkilsulfonilo grupe), ir grupės, vaizduojamos formule $-OSO_2NR^{46}R^{47}$, formule $-NR^{49}SO_2NR^{50}R^{51}$, formule $-CONR^{59}R^{60}$, formule $-SO_2NR^{65}R^{66}$, formule $-NR^{67}SO_2R^{68}$, arba formule $-NR^{69}R^{70}$.

9. Junginys pagal 6 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^{29} yra C_{1-6} alkilo grupė, pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš pakaitų grupės 6, ir pakaitų grupė 6 yra grupė, susidedanti iš C_{1-6} alkilsulfonilo grupės ir grupės, vaizduojamos formule $-OSO_2NR^{46}R^{47}$, formule $-SO_2NR^{65}R^{66}$, arba formule $-NR^{67}SO_2R^{68}$.

10. Junginys pagal 6 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^{29} yra C_{1-6} alkilo grupė, pakeista C_{1-6} alkilsulfonilo grupe.

11. Junginys pagal bet kurį iš 1-10 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^1 yra C_{1-6} alkilo grupė.

12. Junginys pagal bet kurį iš 1-11 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^4 yra hidroksi grupė arba C_{1-6} alkoksi grupė.

13. Junginys pagal bet kurį iš 1-11 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^4 yra metoksi grupė.

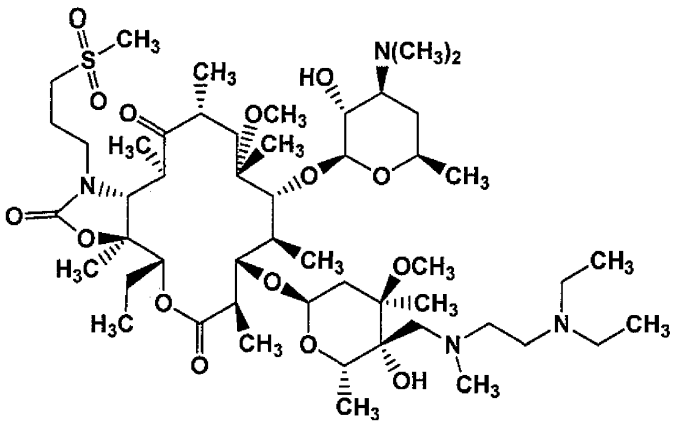
14. Junginys pagal bet kurį iš 1-13 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^3 yra vandenilio atomas.

15. Junginys pagal bet kurį iš 1-14 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur Z yra grupė vaizduojama formule C(=O), arba grupė, vaizduojama formule $C(=N\text{-}OR^{24})$.

16. Junginys pagal bet kurį iš 1-14 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur Z yra grupė, vaizduojama formule C(=O).

17. Junginys pagal 1 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^1 yra C_{1-6} alkilo grupė ir kur R^2 yra C_{1-6} alkilo grupė, pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš pakaitų grupės 4, ir pakaitų grupė 4 yra grupė, susidedanti iš hidroksi grupės ir grupės, vaizduojamos formule $-NR^{17}R^{18}$, ir kur R^{17} ir R^{18}, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, reiškia vandenilio atomą arba C_{1-6} alkilo grupę (C_{1-6} alkilo grupė gali būti pakeista C_{3-6} cikloalkilo grupe), ir kur R^{27} yra grupė, vaizduojama formule NR^{29}, ir R^{29} yra C_{1-6} alkilo grupė, pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš pakaitų grupės 5, ir pakaitų grupė 5 yra grupė, susidedanti iš hidroksi grupės, C_{1-6} alkilsulfonilo grupės, 4-8-narių sočios heterociklinės grupės (soti heterociklinė grupė gali būti pakeista C_{1-6} alkilsulfonilo grupe), ir grupės, vaizduojamos formule $-OSO_2NR^{46}R^{47}$, formule $-NR^{49}SO_2NR^{50}R^{51}$, formule $-CONR^{59}R^{60}$, formule $-SO_2NR^{65}R^{66}$, formule $-NR^{67}SO_2R^{68}$ arba formule $-NR^{69}R^{70}$.

18. Junginys pagal 1 punktą, vaizduojamas šia formule, arba jo druska arba hidratas, arba solvatas.

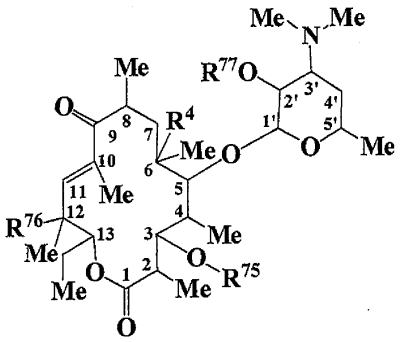


19. Vaistas, turintis medžiagą, parinktą iš grupės, susidedančios iš junginio pagal bet kurį iš 1-18 punktą, jo druskos arba hidrato, arba solvato, kaip aktyvaus ingrediento.

20. Vaistas pagal 19 punktą, kuris naudojamas infekcinės ligos profilaktikai ir (arba) gydymui.

21. Junginys, vaizduojamas formule (VIII):

[Formulė 8):

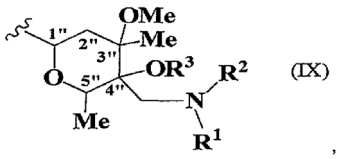


(VIII)

kur formulėje

R^{75} reiškia grupę, vaizduojamą formule (IX):

[Formulė 9]

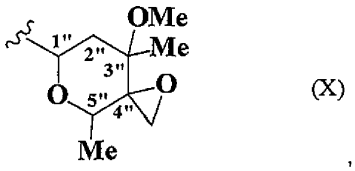


(IX)

,

arba grupę, vaizduojamą formule (X):

[Formulė 10]



(X)

,

R^{76} reiškia hidroksi grupę arba imidazolilkarboniloksi grupę,

R^{77} reiškia vandenilio atomą arba hidroksi grupę blokuojančią grupę, ir

R^1, R^2, R^3 ir R^4 turi tokias pat reikšmes, kaip apibrėžta 1 punkte,

arba jo druska arba hidratas, arba solvatas.

22. Junginys pagal 21 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^1 yra C_{1-6} alkilo grupė arba C_{1-6} alkilsulfonilo grupė, ir R^2 yra 4-8-narių soti heterociklinė grupė (soti heterociklinė grupė gali būti pakeista vienu arba dviem pakaitais, parinktais iš C_{7-12} arilalkilo grupės ir C_{1-6} alkilo grupės), C_{1-6} alkanoilo grupė (C_{1-6} alkanoilo grupė gali būti pakeista amino grupe arba C_{1-6} alkilamino grupe), arba C_{1-6} alkilo grupė, kuri gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš pakaitų grupės 1, arba R^1 ir R^2 kartu su azoto atomu, prie kurio jie yra prijungti, gali sudaryti 4-8-narių sočią azotą turinčią heterociklinę grupę (soti azotą turinti heterociklinė grupė gali būti pakeista 1-3 pakaitais, parinktais iš hidroksi grupės, amino grupės, a C_{1-6} alkilamino grupės ir C_{1-6} alkilo grupės (C_{1-6} alkilo grupė gali būti pakeista amino grupe arba C_{1-6} alkilamino grupe)).

23. Junginys pagal 21 arba 22 punktą arba jo druska arba hidratas, arba solvatas, kur R^{77} yra trimetilsililo grupė, trietilsililo grupė, t-butildimetilsililo grupė, acetilo grupė, propionilo grupė, benzoilo grupė, benziloksikarbonilo grupė arba t-butiloksikarbonilo grupė.

(51) Int.Cl. ***C07K 16/12*** (2006.01)
C12N 15/13 (2006.01)
A61K 39/40 (2006.01)
A61P 31/04 (2006.01)

(11) **2395018**

(96) 11170742.8

(96) 2007-06-05

(97) 2011-12-14

(97) 2016-01-27

(30) 811477 P, 2006-06-06, US
06124231, 2006-11-16, EP
07103584, 2007-03-06, EP

(72) Throsby, Mark, NL
Geuijen, Cecilia A.W., NL
De Kruif, Cornelis Adriaan, NL

(73) Crucell Holland B.V., 2333 CN Leiden, NL

(74) Liudmila GERASIMOVIČ, 9, IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius, LT

(54) Žmogaus molekulės, kurios jungiasi prie stafilokokų ir pasižymi stafilokokus žudančiu aktyvumu ir jų panaudojimas
Apibrėžties punktai: 10, brėžiniai: 0.

(57) 1. Žmogaus monokloninis antikūnas, kuris specifiškai jungiasi prie stafilokokų ir pasižymi opsoniniu žudančiu fagocitus aktyvumu prieš bent dvi skirtingas *Staphylococcus* rūšis ir prieš bent tris skirtingas *Staphylococcus aureus* atmainas, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtas antikūnas yra antikūnas, turintis sunkiąją grandinę, apimančią sekos SEQ ID NO. 155 variabilią sritį ir lengvąją grandinę, apimančią sekos SEQ ID NO. 215 variabilią sritį.

2. Žmogaus monokloninis antikūnas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis pasižymi opsoniniu žudančiu fagocitus aktyvumu, kai *Staphylococcus* rūšys yra logaritminėje augimo fazėje ir statinėje fazėje.

3. Žmogaus monokloninis antikūnas pagal 1 arba 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad *Staphylococcus* rūšys yra pasirinktos iš grupės, susidedančios iš *S. aureus, S. auricularis, S. capitis, S. caprae, S. caseolyticus, S. chromogenes, S. cohnii, S. epidermidis, S. haemolyticus, S. hominis, S. hyicus, S. intermedium, S. lentus, S. lugdunensis, S. saprophyticus, S. schleiferi, S. sciuri, S. simulans, S. warneri* ir *S. xylosus*.

4. Imunokonjugatas, apimantis žmogaus monokloninį antikūną pagal bet kurį vieną iš 1-3 punktų, kur imunokonjugatas papildomai apima bent vieną markerio fragmentą.

5. Nukleorūgšties molekulė, koduojanti žmogaus monokloninį antikūną pagal bet kurį vieną iš 1-3 punktų.

6. Vektorius, apimantis nukleorūgšties molekulę pagal 5 punktą.

7. Ląstelė šeimininkė, apimanti vektorių pagal 6 punktą.

8. Žmogaus monokloninio antikūno pagal bet kurį vieną iš 1-3 punktų gamybos būdas, kur būdas apima stadijas, kuriose:
a) kultivuoja ląstelę šeimininkę pagal 7 punktą sąlygomis, palankiomis ekspresuoti žmogaus monokloninį antikūną ir, nebūtinai,
b) išskiria ekspresuotą žmogaus monokloninį antikūną.

9. Farmacinė kompozicija, apimanti žmogaus monokloninį antikūną pagal bet kurį vieną iš 1-3 punktų, kur farmacinė kompozicija papildomai apima bent vieną farmaciniu požiūriu priimtiną ekscipientą.

10. Farmacinė kompozicija pagal 9 punktą, papildomai apimanti bent vieną kitą terapinį agentą.

(51) Int.Cl. ***C07K 16/30*** (2006.01)
A61K 39/395 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
(11) **2215121**
(96) 08855189.0
(96) 2008-11-19
(97) 2010-08-11
(97) 2016-02-10
(86) PCT/EP2008/009756
(86) 2008-11-19
(87) WO 2009/068204
(87) 2009-06-04
(30) 4378 P, 2007-11-26, US
(72) KAHNERT, Antje, DE
LIGHT, David, US
SCHNEIDER, Doug, US
PARRY, Renate, US
SATOZAWA, Noboru, JP
HEITNER HANSEN, Tara, Renee, DK
STEIDL, Stefan, DE
SCHUBERT, Ulrike, DE
(73) Bayer Intellectual Property GmbH, 40789 Monheim, DE
(74) Jelena GERASIMOVIČ, 52, Ij „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius, LT
(54) Antikūnai prieš mezoteliną ir jų panaudojimas
Apibrėžties punktai: 12, brėžiniai: 0.

(57) 1. Išskirtas žmogaus antikūnas arba jo funkcinis fragmentas, apimantis antigeną surišančią sritį, kuri yra specifinė mezotelinui SEQ ID NO: 370, kur minėtas antikūnas arba jo funkcinis fragmentas atpažįsta mezotelino epitopą, kuris nėra maskuojamas vėžio antigeno 125 (CA 125), ir kur minėtas antikūnas arba jo funkcinis fragmentas absorbuojasi į mezoteliną ekspresuojančias ląsteles ir turi antigeną surišančią sritį, kur antikūną surišanti sritis apima HCDR 1, HCDR 2, HCDR 3, LCDR 1, LCDR 2 ir LCDR 3, kur:
a) HCDR1 yra seka SEQ ID NO: 5,
b) HCDR2 yra seka SEQ ID NO: 39,
c) HCDR3 yra seka SEQ ID NO: 71,
d) LCDR1 yra seka SEQ ID NO: 103,
e) LCDR2 yra seka SEQ ID NO: 133 ir
f) LCDR3 yra seka SEQ ID NO: 169.

2. Antikūnas pagal 1 punktą, kuris apima variabilią sunkiąją grandinę, kurios aminorūgščių seka SEQ ID NO 212.

3. Antikūnas pagal 1 punktą, kuris apima variabilią lengvąją grandinę, kurios aminorūgščių seka MF-T VL pagal 4 lentelę.

4. Antikūnas pagal bet kurį iš 1-3 punktų, kuris yra IgG.

5. Antikūno pagal bet kurį iš 1-3 punktų išskirtas funkcinis fragmentas, kuris yra Fab arba scFv antikūno fragmentas.

6. Išskirta nukleorūgščių seka, kuri koduoja žmogaus antikūno arba jo funkcinio fragmento pagal bet kurį iš 1-5 punktų antigeną surišančią sritį.

7. Vektorius, apimantis nukleorūgščių seką pagal 6 punktą.

8. Išskirta ląstelė, apimanti vektorių pagal 7 punktą.

9. Išskirta ląstelė pagal 9 punktą, kur minėta ląstelė yra bakterinė arba žinduolio ląstelė.

10. Farmacinė kompozicija, apimanti antikūną arba funkcinį fragmentą, pagal bet kurį iš 1-5 punktų ir farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį arba ekscipientą.

11. Antikūnas arba fragmentas pagal bet kurį iš 1-5 punktų, skirtas naudoti kaip vaistas.

12. Žmogaus antikūnas pagal bet kurį iš 1-5 punktų, kur žmogaus antikūnas yra sintetinis žmogaus antikūnas.

---

(51) Int.Cl. ***C12N 5/10*** (2006.01)
C12N 15/81 (2006.01)
C12P 7/10 (2006.01)
C12R 1/645 (2006.01)
C12N 9/92 (2006.01)
C12P 19/24 (2006.01)
(11) **2313495**
(96) 09772164.1
(96) 2009-07-01
(97) 2011-04-27
(97) 2015-12-02
(86) PCT/EP2009/004762
(86) 2009-07-01
(87) WO 2010/000464
(87) 2010-01-07
(30) 102008031350, 2008-07-02, DE
(72) BRAT, Dawid, DE
BOLES, Eckhard, DE
KELLER, Marco, DE
ROTHER, Beate, DE
(73) Lesaffre et Compagnie, 75001 Paris, FR
(74) Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Prokariotų ksilozės izomerazė, skirta ksilozę fermentuojančių mielių konstravimui
Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 0.
(57) 1. Nukleorūgšties molekulės, apimančios nukleorūgšties seką, kuri koduoja prokariotų kslilozės izomerazę (XI), ir kuri yra bent 95 % identiška, geriau, 99 % identiška nukleorūgšties sekai, atitinkančiai SEQ ID Nr. 2, arba kuri yra bent 95 % identiška, geriau, 99 % identiška nukleorūgšties sekai, atitinkančiai SEQ ID Nr. 3, panaudojimas ląstelės transformavimui, rekombinantinei raiškai ir ksilozės izomerazės gamybai, ir (arba) ksilozės konversijai į ksilulozę, vykdomai ląstelės, kur ksilozės izomerazė (XI) yra iš *Clostridium phytofermentans* ir apima aminorūgščių seką, kuri yra bent 95 % identiška, geriau, 99 % identiška aminorūgščių sekai, atitinkančiai SEQ ID Nr. 1.

2. Panaudojimas pagal 1 punktą
- ksilozę turinčios biologinės medžiagos konversijai ir (arba) metabolizmui,
- chemikalų biologiniu pagrindu gamybai,
- biobutanolio ir (arba) bioetanolio gamybai.

3. Panaudojimas pagal 1 arba 2 punktą, kur nukleorūgšties seka SEQ ID Nr. 3, kuri koduoja prokariotų ksilozės izomerazę (XI), apima nukleorūgšties seką, kuri yra kodonu optimizuota panaudojimui ląstelėje šeimininkėje.

4. Panaudojimas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur nukleorūgšties molekulė yra nukleorūgšties raiškos konstruktas, kuris apima promotoriaus ir nutraukimo sekas, kur promotorius yra funkciškai surištas su nukleorūgšties seka, kuri koduoja ksilozės izomerazę (XI), kur, geriau, nukleorūgšties raiškos konstruktas taip pat apima 5’ ir (arba) 3’ atpažinimo sekas ir (arba) atrankos žymenis.

5. Panaudojimas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur ląstelė yra mielių ląstelė arba siūlinio grybo ląstelė, kur, geriau, mielių ląstelė yra narys genties, parinktos iš grupės, susidedančios iš *Saccharomyces, Kluyveromyces, Candida, Pichia, Schizosaccharomyces, Hansenula, Kloeckera, Schwanniomyces, Arxula* and *Yarrowia,* ir, geriau, narys rūšies, parinktos iš grupės, susidedančios iš *S. cerevisiae, S. bulderi, S. barnetti, S. exiguus, S. uvarum, S. diastaticus,*

K. lactis, K. marxianus ir *K. fragilis,* kur ypač geriau, siūlinio grybo ląstelė yra narys genties, parinktos iš grupės, susidedančios iš *Aspergillus, Trichoderma, Humicola, Acremonium, Fusarium* ir *Penicillium.*

6. Ląstelė, transformuota nukleorūgšties raiškos konstruktu, apimančiu:

(a) nukleorūgšties seką, kuri koduoja prokariotų ksilozės izomerazę (XI), kur ksilozės izomerazė (XI) yra iš *Clostridium phytofermentans* ir apima aminorūgščių seką, kuri yra bent 95 % identiška, geriau, 99 % identiška aminorūgščių sekai, atitinkančiai SEQ ID Nr. 1;

(b) promotorių, kuris yra funkciškai surištas su nukleorūgšties seka, kas padaro įmanoma ksilozės izomerazės (XI) raišką ląstelėje, kur nukleorūgšties raiškos konstrukto raiška suteikia ląstelei gebėjimą tiesiogiai izomerizuoti ksilozę į ksilulozę;

kur ląstelė yra eukariotinė ląstelė, ir kur ląstelė yra transformuota nukleorūgšties molekule pagal 1-5 punktą.

7. Ląstelė pagal 6 punktą, kur ląstelė yra mielių ląstelė arba siūlinio grybo ląstelė, kur, geriau, mielių ląstelė yra narys genties, parinktos iš grupės, susidedančios iš *Saccharomyces, Kluyveromyces, Candida, Pichia, Schizosaccharomyces, Hansenula, Kloeckera, Schwanniomyces, Arxula* ir *Yarrowia* ir geriau, narys rūšies, parinktos iš grupės, susidedančios iš *S. cerevisiae, S. bulderi, S. barnetti, S. exiguus, S. uvarum, S. diastaticus, K. lactis, K. marxianus ir K. fragilis,* ir kur, geriau, siūlinio grybo ląstelė yra narys genties, parinktos iš grupės, susidedančios iš *Aspergillus, Trichoderma, Humicola, Acremonium, Fusarium* ir *Penicillium.*

8. Ląstelė pagal bet kurį iš 6-7 punktą, kuri yra laikinai arba pastoviai transformuota nukleorūgšties raiškos konstruktu arba nukleorūgšties molekule, apibrėžtais 1-5 punktuose.

9. Ląstelė pagal bet kurį iš 6-8 punktą, kuri dar vykdo vieno arba daugiau fermentų raišką, kas suteikia ląstelei gebėjimą gaminti papildomus metabolizmo produktus, kur papildomi metabolizmo produktai, geriau, yra parinkti iš grupės biologinių chemikalų pagrindu, tokių kaip pieno rūgštis, acto rūgštis, gintaro rūgštis, obuolių rūgštis, 1-butanolis, izobutanolis, 2-butanolis, kiti alkoholiai, aminorūgštys, 1,3-propandiolis, etilenas, glicerolis, β-laktamo antibiotikai arba cefalosporinas, alkanai, terpenai, izoprenoidai arba antimaliarinio aktyvaus ingrediento artemizinino pirmtako molekulė amorfadienas.

10. Ląstelės pagal bet kurį iš 6-8 punktą panaudojimas ksilozę turinčios biologinės medžiagos konversijai ir metabolizmui, ypač fermentacijai, ir (arba) bioetanolio gamybai.

11. Ląstelės pagal bet kurį iš 6-9 punktą panaudojimas ksilozę turinčios biologinės medžiagos konversijai ir metabolizmui, ypač fermentacijai, ir (arba) metabolizmo produkto gamybai, kur metabolizmo produktas, geriau, yra parinktas iš grupės chemikalų biologiniu pagrindu, tokių kaip pieno rūgštis, acto rūgštis, gintaro rūgštis, obuolių rūgštis, 1-butanolis, izobutanolis, 2-butanolis, kiti alkoholiai, aminorūgštys, 1,3-propandiolis, etilenas, glicerolis, β-laktamo antibiotikai arba cefalosporinas, alkanai, terpenai, izoprenoidai arba antimaliarinio aktyvaus ingrediento artemizinino pirmtako molekulė amorfadienas.

12. Bioetanolio gamybos būdas, apimantis šias pakopas:

(a) terpės, turinčios ksilozės šaltinį, reakcija su ląstelėmis pagal vieną iš 6-8 punktą, kurios konvertuoja ksilozę į etanolį,

(b) pasirinktinai, etanolio gavimas, kur terpė, geriau, turi papildomą anglies šaltinį, ypač gliukozę.

13. Būdas pagal 12 punktą, kur bioetanolio gamyba vyksta greičiu bent 0,03 g etanolio gramui sausos mielių masės per valandą.

14. Būdas pagal bet kurį iš 12-13 punktą, kur etanolio išeiga yra bent 0,3 g etanolio gramui ksilozės.

15. Metabolizmo produkto gamybos būdas, apimantis šias pakopas:

(a) terpės, turinčios ksilozės šaltinį, reakcija su ląstelėmis pagal 9 punktą, kurios konvertuoja ksilozę, gaunant metabolizmo produktą,

(b) pasirinktinai, metabolizmo produkto gavimas, kur metabolizmo produktas, geriau, yra parinktas iš chemikalų biologiniu pagrindu, tokių kaip pieno rūgštis, acto rūgštis, gintaro rūgštis, obuolių rūgštis, 1-butanolis, izobutanolis, 2-butanolis, kiti alkoholiai, aminorūgštys, 1,3-propandiolis, etilenas, glicerolis, β-laktamo antibiotikai arba cefalosporinas, alkanai, terpenai, izoprenoidai arba antimaliarinio aktyvaus ingrediento artemizinino pirmtako molekulė amorfadienas, kur terpė, geriau, turi papildomą anglies šaltinį, ypač gliukozę.

(51) Int.Cl. ***C12N 15/09*** (2006.01)
A61K 39/395 (2006.01)
C12N 15/13 (2006.01)
C07K 16/00 (2006.01)

(11) **2158315**

(96) 08757278.0

(96) 2008-06-25

(97) 2010-03-03

(97) 2016-03-23

(86) PCT/CH2008/000285

(86) 2008-06-25

(87) WO 2009/000099

(87) 2008-12-31

(30) 937112 P, 2007-06-25, US
69056, 2008-03-12, US

(72) URECH, David, CH
BORRAS, Leonardo, CH

(73) ESBATech, an Alcon Biomedical Research Unit LLC, 8952 Schlieren, CH

(74) Irena Milda SRĖBALIENĖ, 24, Patentinių paslaugų centras, UAB, J. Basanavičiaus g. 11/1, LT-03108 Vilnius, LT

(54) Antikūnų modifikavimo būdai ir modifikuoti antikūnai su pagerintomis funkcinėmis savybėmis

Apibrėžties punktai: 24, brėžiniai: 17.

(57) 1. Imunorišiklio konstravimo būdas, kur imunorišiklis apima: (i) sunkiosios grandinės kintamąją sritį arba jos fragmentą, kur sunkiosios grandinės kintamoji sritis apima V_H struktūros aminorūgštis ir/arba (ii) lengvosios grandinės kintamąją sritį arba jos fragmentą, kur lengvosios grandinės kintamoji sritis apima V_L struktūros aminorūgštis, kur būdas apima:

A) vienos arba daugiau iš V_H struktūros aminorūgščių, V_L struktūros aminorūgščių arba V_H ir V_L struktūrų aminorūgščių padėčių pasirinkimą mutavimui; ir

B) mutavimui parinktų vienos arba daugiau aminorūgščių padėčių mutavimą,

a) kur, jeigu viena arba daugiau mutavimui parinktų sunkiosios grandinės aminorūgščių padėčių yra iš žmogaus VH3 šeimos sunkiosios grandinės kintamosios srities, mutavimas apima vieną arba daugiau pakaitų, parinktų iš grupės, susidedančios iš:

(i) glutamino (Q) 1 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(ii) glutamino (Q) 6 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iii) treonino (T) arba alanino (A) 7 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iv) alanino (A), valino (V) arba fenilalanino (F) 89 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (78 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą); ir

(v) arginino (R), glutamino (Q), izoleucino (I), leucino (L), metionino (M) arba fenilalanino (F) 103 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (89 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą);

b) kur, jeigu viena arba daugiau mutavimui parinktų sunkiosios grandinės

aminorūgščių padėčių yra iš žmogaus VH1a šeimos sunkiosios grandinės kintamosios srities, mutavimas apima vieną arba daugiau pakaitų, parinktų iš grupės, susidedančios iš:

(i) glutamo rūgšties (E) 1 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(ii) glutamo rūgšties (E) 6 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iii) leucino (L) 12 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (11 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(iv) metionino (M) 13 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (12 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą):

(v) glutamo rūgšties (E) arba glutamino (Q) 14 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (13 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(vi) leucino (L) 19 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (18 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(vii) izoleucino (I) 21 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (20 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(viii) fenilalanino (F), serino (S), histidino (H) arba asparto rūgšties (D) 90 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (79 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(ix) asparto rūgšties (D) arba glutamino (Q) 92 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (81 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(x) glicino (G), asparagino (N) arba treonino (T) 95 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (82b aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą); ir

(xi) treonino (T), alanino (A), prolino (P) arba fenilalanino (F) 98 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (84 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą);

c) kur, jeigu viena arba daugiau mutavimui parinktų sunkiosios grandinės aminorūgščių padėčių yra iš žmogaus VH1b šeimos sunkiosios grandinės kintamosios srities, mutavimas apima vieną arba daugiau pakaitų, parinktų iš grupės, susidedančios iš:

(i) glutamo rūgšties (E) 1 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(ii) treonino (T), prolino (P), valino (V) arba asparto rūgšties (D) 10 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (9 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(iii) leucino (L) 12 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (11 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(iv) valino (V), arginino (R), glutamino (Q) arba metionino (M) 13 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (12 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą):

v) glutamo rūgšties (E), arginino (R) arba metionino (M) 14 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (13 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(vi) arginino (R), treonino (T) arba asparagino (N) 20 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (19 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(vii) izoleucino (I), fenilalanino (F) arba leucino (L) 21 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (20 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(viii) lizino (K) 45 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (38 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(ix) treonino (T), prolino (P), valino (V) arba arginino (R) 47 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (40 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(x) lizino (K), histidino (H) arba glutamo rūgšties (E) 50 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (43 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(xi) izoleucino (I) 55 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (48 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą);

(xii) lizino (K) 77 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (66 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą);

(xiii) alanino (A), leucino (L) arba izoleucino (I) 78 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (67 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(xiv) glutamo rūgšties (E), treonino (T) arba alanino (A) 82 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (71 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(xv) treonino (T), serino (S) arba leucino (L) 86 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (75 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(xvi) asparto rūgšties (D), asparagino (N) arba glicino (G) 87 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (76 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą); ir

(xvii) asparagino (N) arba serino (S) 107 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (93 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

d) kur, jeigu viena arba daugiau mutavimui parinktų lengvosios grandinės aminorūgščių padėčių yra iš žmogaus Vκ1 šeimos lengvosios grandinės kintamosios srities, mutavimas apima vieną arba daugiau pakaitų, parinktų iš grupės, susidedančios iš:

(i) glutamo rūgšties (E) arba izoleucino (I) 1 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(ii) valino (V) arba izoleucino (I) 3 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iii) valino (V), leucino (L) arba izoleucino (I) 4 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iv) glutamino (Q) 24 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(v) arginino (R) arba izoleucino (I) 47 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (39 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(vi) arginino (R), glutamo rūgšties (E), treonino (T), metionino (M) arba glutamino (Q) 50 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (42 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(vii) histidino (H), serino (S) arba fenilalanino (F) 57 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (49 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(viii) fenilalanino (F) 91 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (73 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą); ir

(ix) valino (V), serino (S), glicino (G) arba izoleucino (I) 103 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (85 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

e) kur, jeigu viena arba daugiau mutavimui parinktų lengvosios grandinės aminorūgščių padėčių yra iš žmogaus Vκ3 šeimos lengvosios grandinės kintamosios srities, mutavimas apima vieną arba daugiau pakaitų, parinktų iš grupės, susidedančios iš:

(i) treonino (T) 2 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(ii) treonino (T) 3 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iii) izoleucino (I) 10 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iv) tirozino (Y) 12 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(v) serino (S) 18 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(vi) alanino (A) 20 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(vii) metionino (M) 56 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (48 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(viii) valino (V) arba treonino (T) 74 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (58 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(ix) asparagino (N) 94 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (76 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(x) tirozino (Y) arba serino (S) 101 aminorūgšties padėtyje AHo numeravimo sistemą (83 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą); ir

(xi) leucino (L) arba alanino (A) 103 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (85 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą);

f) kur, jeigu viena arba daugiau mutavimui parinktų lengvosios grandinės aminorūgščių padėčių yra iš žmogaus Vλ1 šeimos lengvosios grandinės kintamosios srities, mutavimas apima vieną arba daugiau pakaitų, parinktų iš grupės, susidedančios iš:

(i) leucino (L), serino (S) arba glutamo rūgšties (E) 1 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(ii) alanino (A), prolino (P), izoleucino (I) arba tirozino (Y) 2 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iii) valino (V) arba metionino (M) 4 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iv) glutamo rūgšties (E) 7 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(v) alanino (A) 11 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(vi) treonino (T) arba serino (S) 14 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(vii) histidino (H) 46 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (38 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(viii) treonino (T), serino (S), asparagino (N), glutamino (Q) arba prolino (P) 53 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (45 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(ix) arginino (R) arba glutamino (Q) 82 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (66 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(x) glicino (G), treonino (T) arba asparto rūgšties (D) 92 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (74 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą); ir

(xi) valino (V), treonino (T), histidino (H) arba glutamo rūgšties (E) 103 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (85 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą).

2. Būdas pagal apibrėžties 1 punktą, kur mutavimas papildomai apima vieną arba daugiau sunkiosios grandinės pakaitų, parinktų iš grupės, susidedančios iš:

(i) serino (S) 12 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat;

(ii) serino (S) 103 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (85 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą); ir

(iii) serino (S) arba treonino (T) 144 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (103 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą).

3. Būdas pagal apibrėžties 1 punktą, kur mutavimas papildomai apima šias sunkiosios grandinės pakaitas:

(i) serino (S) 12 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat;

(ii) serino (S) 103 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (85 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą); ir

(iii) serino (S) arba treonino (T) 144 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (103 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą).

4. Būdas pagal bet kurį vieną iš apibrėžties 1-3 punktų, kur imunorišiklis yra scFv antikūnas, pilno ilgio imunoglobulinas, Fab fragmentas, Dab arba nanokūnas.

5. Būdas pagal apibrėžties 1 punktą, kur jeigu viena arba daugiau mutavimui parinktų sunkiosios grandinės aminorūgščių padėčių yra iš VH3 šeimos sunkiosios grandinės kintamosios srities, mutavimas apima vieną arba daugiau pakaitų, parinktų iš grupės, susidedančios iš:

(i) glutamino (Q) 1 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(ii) glutamino (Q) 6 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iii) treonino (T) 7 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iv) valino (V) 89 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (78 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą); ir

(v) leucino (L) 103 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (89 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą).

6. Būdas pagal apibrėžties 1 punktą, kur jeigu viena arba daugiau mutavimui parinktų sunkiosios grandinės aminorūgščių padėčių yra iš VH1a šeimos sunkiosios grandinės kintamosios srities, mutavimas apima vieną arba daugiau pakaitų, parinktų iš grupės, susidedančios iš:

(I) glutamo rūgšties (E) 1 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(ii) glutamo rūgšties (E) 6 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iii) leucino (L) 12 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (11 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(iv) metionino (M) 13 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (12 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą):

(v) glutamo rūgšties (E) 14 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (13 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(vi) leucino (L) 19 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (18 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(vii) izoleucino (I) 21 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (20 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(viii) fenilalanino (F), serino (S), histidino (H) arba asparto rūgšties (D) 90 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (79 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(ix) asparto rūgšties (D) 92 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (81 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(x) glicino (G) 95 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (82b aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą); ir

(xi) fenilalanino (F) 98 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (84 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą);

7. Būdas pagal apibrėžties 1 punktą, kur, jeigu viena arba daugiau mutavimui parinktų sunkiosios grandinės aminorūgščių padėčių yra iš VH1b šeimos sunkiosios grandinės kintamosios srities, mutavimas apima vieną arba daugiau pakaitų, parinktų iš grupės, susidedančios iš:

(i) glutamo rūgšties (E) 1 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(ii) treonino (T) 10 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (9 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(iii) leucino (L) 12 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (11 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(iv) valino (V) 13 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (12 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą):

v) arginino (R) 14 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (13 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(vi) asparagino (N) 20 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (19 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(vii) leucino (L) 21 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (20 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(viii) lizino (K) 45 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (38 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(ix) arginino (R) 47 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (40 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(x) lizino (K) 50 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (43 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(xi) izoleucino (I) 55 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (48 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą);

(xii) lizino (K) 77 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (66 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą);

(xiii) alanino (A) 78 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (67 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(xiv) glutamo rūgšties (E) 82 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (71 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(xv) treonino (T) 86 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (75 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(xvi) asparagino (N) 87 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (76 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą); ir

(xvii) asparagino (N) 107 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (93 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

8. Būdas pagal apibrėžties 1 punktą, kur, jeigu viena arba daugiau mutavimui parinktų lengvosios grandinės aminorūgščių padėčių yra iš Vκ1 šeimos lengvosios grandinės kintamosios srities, mutavimas apima vieną arba daugiau pakaitų, parinktų iš grupės, susidedančios iš:

(i) glutamo rūgšties (E) 1 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(ii) valino (V) 3 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iii) leucino (L) 4 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iv) glutamino (Q) 24 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(v) arginino (R) 47 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (39 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(vi) arginino (R), glutamo rūgšties (E), treonino (T), metionino (M) arba glutamino (Q) 50 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (42 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(vii) serino (S) 57 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (49 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(viii) fenilalanino (F) 91 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (73 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą); ir

(ix) valino (V) 103 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (85 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

9. Būdas pagal apibrėžties 1 punktą, kur, jeigu viena arba daugiau mutavimui parinktų lengvosios grandinės aminorūgščių padėčių yra iš Vκ3 šeimos lengvosios grandinės kintamosios srities, mutavimas apima vieną arba daugiau pakaitų, parinktų iš grupės, susidedančios iš:

(i) treonino (T) 2 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(ii) treonino (T) 3 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iii) izoleucino (I) 10 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iv) tirozino (Y) 12 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(v) serino (S) 18 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(vi) alanino (A) 20 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(vii) metionino (M) 56 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (48 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(viii) treonino (T) 74 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (58 aminorūgšties padėtyje pagal Kabat numeravimo sistemą);

(ix) asparagino (N) 94 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (76 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(x) serino (S) 101 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (83 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą); ir

(xi) alanino (A) 103 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (85 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą);

10. Būdas pagal apibrėžties 1 punktą, kur, jeigu viena arba daugiau mutavimui parinktų lengvosios grandinės aminorūgščių padėčių yra iš Vλ1 šeimos lengvosios grandinės kintamosios srities, mutavimas apima vieną arba daugiau pakaitų, parinktų iš grupės, susidedančios iš:

(i) leucino (L) 1 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(ii) prolino (P) 2 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iii) valino (V) 4 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(iv) serino (S) 7 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(v) alanino (A) 11 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(vi) treonino (T) 14 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat numeravimo sistemą;

(vii) histidino (H) 46 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (38 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(viii) treonino (T), serino (S), asparagino (N), glutamino (Q) arba prolino (P) 53 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (45 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(ix) arginino (R) 82 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (66 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą);

(x) treonino (T) 92 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimo sistemą (74 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimo sistemą); ir

(xi) valino (V) 103 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (85 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą).

11. Būdas pagal bet kurį vieną iš apibrėžties 5-10 punktų, kur mutavimas papildomai apima vieną arba daugiau sunkiosios grandinės pakaitų, parinktų iš grupės, susidedančios iš:

(i) serino (S) 12 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat;

(ii) serino (S) 103 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (85 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą); ir

(iii) serino (S) arba treonino (T) 144 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (103 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą).

12. Būdas pagal bet kurį vieną iš apibrėžties 5-10 punktų, kur mutavimas papildomai apima šias sunkiosios grandinės pakaitas:

(i) serino (S) 12 aminorūgšties padėtyje pagal AHo arba Kabat;

(ii) serino (S) 103 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (amino rūgšties position 85 using Kabat numeravimą); ir

(iii) serino (S) arba treonino (T) 144 aminorūgšties padėtyje pagal AHo numeravimą (103 aminorūgšties padėtis pagal Kabat numeravimą).

13. Būdas pagal bet kurį vieną iš apibrėžties 8-12 punktų, kur imunorišiklis yra scFv antikūnas, pilno ilgio imunoglobulinas, Fab fragmentas, Dab arba nanokūnas.

14. Imunorišiklio konstravimo būdas, kur imunorišiklis apima sunkiosios grandinės CDR1, CDR2 ir CDR3 sekas, kur būdas apima sunkiosios grandinės CDR1, CDR2 ir CDR3 sekų įterpimą į sunkiosios grandinės struktūros karkasą, kur sunkiosios grandinės struktūros karkasas apima aminorūgščių seką, kaip parodyta 9 fig. (SEQ ID NO:1), 10 fig. (SEQ ID NO:2), 11 fig. (SEQ ID NO:3), SEQ ID NO: 7, SEQ ID NO:8 arba SEQ ID NO:9, su išlyga, kad aminorūgščių seka nėra genocitų linijos tipinė seka.

15. Būdas pagal apibrėžties 14 punktą, kur sunkiosios grandinės struktūros karkasas apima aminorūgščių seką, kaip parodyta 9 fig. (SEQ ID NO: 1).

16. Būdas pagal apibrėžties 14 punktą, kur sunkiosios grandinės struktūros karkasas apima aminorūgščių seką, kaip parodyta 10 fig. (SEQ ID NO:2).

17. Būdas pagal apibrėžties 14 punktą, kur sunkiosios grandinės struktūros karkasas apima aminorūgščių seką, kaip parodyta 11 fig. (SEQ ID NO:3).

18. Imunorišiklio konstravimo būdas, kur imunorišiklis apima lengvosios grandinės CDR1, CDR2 ir CDR3 sekas, kur būdas apima lengvosios
grandinės CDR1, CDR2 ir CDR3 sekų įterpimą į lengvosios grandinės struktūros karkasą, kur lengvosios grandinės struktūros karkasas apima aminorūgščių seką, kaip parodyta 12 fig. (SEQ ID NO:4), 13 fig. (SEQ ID NO:5), 14 fig. (SEQ ID NO:6), SEQ ID NO: 10, SEQ ID NO: 11 arba SEQ ID NO: 12, su išlyga, kad aminorūgščių seka nėra genocitų linijos tipinė seka.

19. Būdas pagal apibrėžties 18 punktą, kur lengvosios grandinės struktūros karkasas apima aminorūgščių seką, kaip parodyta 12 fig. (SEQ ID NO:4).

20. Būdas pagal apibrėžties 18 punktą, kur lengvosios grandinės struktūros karkasas apima aminorūgščių seką, kaip parodyta 13 fig. (SEQ ID NO:5).

21. Būdas pagal apibrėžties 18 punktą, kur lengvosios grandinės struktūros karkasas apima aminorūgščių seką, kaip parodyta 14 fig. (SEQ ID NO:6).

22. Būdas pagal bet kurį vieną iš apibrėžties 18-21 punktų, kur imunorišiklis yra scFv antikūnas.

23. Išskirtas sunkiosios grandinės struktūros karkasas, apimantis aminorūgščių seką, kaip parodyta 9 fig. (SEQ ID NO: 1), 10 fig. (SEQ ID NO:2) arba 11 fig. (SEQ ID NO:3), su išlyga, kad aminorūgščių seka nėra genocitų linijos tipinė seka.

24. Išskirtas lengvosios grandinės struktūros karkasas, apimantis aminorūgščių seką, kaip parodyta 12 fig. (SEQ ID NO:4), 13 fig. (SEQ ID NO:5) arba 14 fig. (SEQ ID NO:6), su išlyga, kad aminorūgščių seka nėra genocitų linijos tipinė seka.

---

(51) Int.Cl. ***C12N 15/113*** (2006.01)
A61K 31/7125 (2006.01)
C12N 15/11 (2006.01)
(11) **2612917**
(96) 11821996.3
(96) 2011-08-31
(97) 2013-07-10
(97) 2016-02-24
(86) PCT/JP2011/070318
(86) 2011-08-31
(87) WO 2012/029986
(87) 2012-03-08
(30) 2010196032, 2010-09-01, JP
(72) WATANABE, Naoki, JP
SATOU, Youhei, JP
TAKEDA, Shin`ichi, JP
NAGATA, Tetsuya, JP
(73) Nippon Shinyaku Co., Ltd., Kyoto-shi Kyoto 601-8550, JP
National Center of Neurology and Psychiatry, Kodaira-shi Tokyo 187-8551, JP
(74) Aušra PAKĖNIENĖ, 50, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Antiprasminė nukleorūgštis
Apibrėžties punktai: 11, brėžiniai: 0.

(57) 1. Antiprasminis oligomeras, kuris sukelia 53-čio egzono peršokimą žmogaus distrofino gene, susidedantis iš nukleotidų sekos, komplementarios bet kuriai iš sekų, susidedančių iš 53-čio egzono 5‘ galo 32-56 arba 36-56 nukleotidų žmogaus distrofino gene.

2. Antiprasminis oligomeras pagal 1 punktą, kuris yra oligonukleotidas.

3. Antiprasminis oligomeras pagal 2 punktą, kur cukraus fragmentas ir/arba mažiausiai vieno nukleotido, kuris sudaro oligonukleotidą, fosfatą surišanti sritis yra modifikuota.

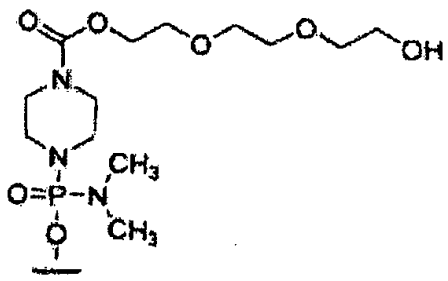
4. Antiprasminis oligomeras pagal 3 punktą, kur mažiausiai vieno nukleotido, kuris sudaro oligonukleotidą, cukraus fragmentas yra ribozė, kurioje 2‘-OH grupė yra pakeista bet kokia, parinkta iš grupės, susidedančios iš OR, R, R‘OR, SH, SR, NH_2, NHR, NR_2, N_3, CN, F, Cl, Br ir J (kur R yra alkilas arba arilas ir R‘ yra alkilenas).

5. Antiprasminis oligomeras pagal 3 arba 4 punktą, kur bent vieno nukleotido, sudarančio oligonukleotidą, fosfatą surišanti sritis yra bet kokia, parinkta iš grupės, susidedančios iš fosforo tioato ryšio, iš fosforo ditioato ryšio, alkilfosfonato ryšio, fosforamidato ryšio ir boranofosfato ryšio.

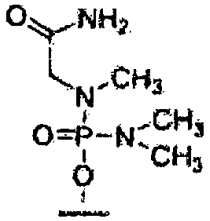
6. Antiprasminis oligomeras pagal 1 punktą, kuris yra morfolino oligomeras.

7. Antiprasminis oligomeras pagal 1 punktą, kuris yra fosforo diamidato morfolino oligomeras.

8. Antiprasminis oligomeras pagal 6 arba 7 punktą, kurio 5‘ galas yra viena iš grupių, kurių cheminės formulės (1)-(3) žemiau:



(1)



(2)



(3)

9. Antiprasminis oligomeras pagal bet kurį iš 1-8 punktų, susidedantis iš nukleotidų sekos, parodytos SEQ ID Nr. 11 arba 35.

10. Farmacinė kompozicija, apimanti kaip aktyvų ingredientą antiprasnminį oligomerą pagal bet kurį iš 1-9 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską arba hidratą, skirta panaudoti raumenų distrofijos gydyme.

11. Farmacinė kompozicija, skirta panaudoti pagal 10 punktą, kuri yra skiriama Diušeno raumenų distrofijos gydymui.

---

(51) Int.Cl. ***C12N 15/70*** (2006.01)
C12N 15/73 (2006.01)
C12N 1/21 (2006.01)
C12P 21/02 (2006.01)

(11) **2695943**
(96) 13191424.4
(96) 2007-02-01
(97) 2014-02-12
(97) 2016-01-20
(30) 0602173, 2006-02-03, GB

(72) Hodgson, Ian, GB
Lennon, Christopher, GB
Kara, Bhupendra, GB
(73) FUJIFILM DIOSYNTH BIOTECHNOLOGIES UK LIMITED, Billingham TS23 1LH, GB
(74) Liudmila GERASIMOVIČ, 9, IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius, LT
(54) Raiškos sistema
Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 0.
(57) 1. Baltymo raiškos sistema, apimanti:
a) λpL promotorių; ir
b) neturinčią defektų palindrominę operatoriaus seką.

2. Vektorius, apimantis:
a) λpL promotorių; ir
b) neturinčią defektų palindrominę operatoriaus seką.

3. Vektorius pagal 2 punktą, papildomai apimantis baltymo raiškos kasetę.

4. Vektorius pagal bet kurį 2 arba 3 punktą, kur vektorius yra plazmidė, optimaliai autonomiškai besireplikuojanti plazmidė.

5. Ląstelė šeimininkė, transformuota vektoriumi pagal bet kurį vieną iš 2-4 punktų.

6. Rekombinantinio baltymo gamybos būdas, kuriame ekspresuoja raiškos sistemą, apimančią:
a) λpL promotorių; ir
b) neturinčią defektų palindrominę operatoriaus seką; ir
c) rekombinantinio baltymo raiškos kasetę.

7. Raiškos sistema, vektorius, ląstelė šeimininkė arba būdas pagal bet kurį vieną iš 1-6 punktų, kur sistemos operatorius yra lac, gal, deo arba gln.

8. Raiškos sistema, vektorius, ląstelė šeimininkė arba būdas pagal bet kurį vieną iš 1-7 punktų, kur yra naudojama pavienė neturinti defektų palindrominė operatoriaus seka, optimaliai, esanti pasroviui nuo promotoriaus.

9. Raiškos sistema, vektorius, ląstelė šeimininkė arba būdas pagal bet kurį vieną iš 1-8 punktų, kur yra naudojama pavienė neturinti defektų palindrominė operatoriaus seka.

10. Raiškos sistema, vektorius, ląstelė šeimininkė arba būdas pagal bet kurį vieną iš 1-9 punktų, kur operatoriaus seka yra GGAATTGTGAGCGCTCACAATTCC (sekos SEQ ID No. 3 nukleobazės nuo 51 iki 74) arba AATTGTGAGCGCTCACAATT (sekos SEQ ID No. 3 nukleobazės nuo 53 iki 72).

11. Raiškos sistema, vektorius, ląstelė šeimininkė arba būdas pagal bet kurį vieną iš 1-10 punktų, kur operatorius persidengia su transkripcijos pradžios tašku.

12. Baltymo gamybos būdas, kuriame:
a) kultivuoja ląstelę šeimininkę, transformuotą vektoriumi pagal 3 punktą; ir
b) išskiria baltymą.

13. Būdas pagal 12 punktą, kur ląstelė šeimininkė yra *E. coli*.

14. Būdas pagal bet kurį 12 arba 13 punktą, kur vektorius yra vektorius pagal bet kurį vieną iš 7 -11 punktų.

15. Būdas pagal bet kurį 12 arba 14 punktą, kur operatorius persidengia su transkripcijos pradžios tašku.

(51) Int.Cl. ***C12P 19/02*** (2006.01)
C12P 5/02 (2006.01)
C12P 7/04 (2006.01)
C12N 1/20 (2006.01)

(11) **2647717**

(96) 13168384.9

(96) 2009-04-28

(97) 2013-10-09

(97) 2016-04-06

(30) 49407 P, 2008-04-30, US
417840, 2009-04-03, US

(72) Medoff, Marshall, US
Masterman, Craig Thomas, US

(73) Xyleco, Inc., Wakefield, MA 01880-6248, US

(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT

(54) Biomasės apdorojimas

Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 0.

(57) 1. Būdas, apimantis:

mažos molekulinės masės cukraus fermentavimą, naudojant fermentavimo mikroorganizmą, naudojant oksiduotą pluoštinė biomasę, į produktą, kitokį negu cukrus, ir kur būdas apima oksiduotos pluoštinės biomasės gavimą, naudojant jonizuojančią spinduliuotę oksiduojančioje aplinkoje, apdorojimą ultragarsu oksiduojančioje aplinkoje arba oksidacine pirolize prieš maišymą su mažos molekulinės masės cukrumi.

2. Būdas pagal 1 punktą, kur biomasė yra nukreipiama jonizuojančios spinduliuotės poveikiui ir vėsinama arba gesinama.

3. Būdas pagal 1 punktą, kur pluoštinė biomasė yra jonizuojama jonizuojančia spinduliuote.

4. Būdas pagal 3 punktą, kur bendra spinduliuotės dozė yra tarp 1,0 Mrad ir 6,0 Mrad arba yra mažiausiai 5 Mrad, pavyzdžiui, kur spinduliuotė pateikia nuo 10 Mrad iki 150 Mrad spinduliuotės dozę.

5. Būdas pagal 1 punktą, kur pluoštinė masė apima karboksilatą arba karboksirūgščių grupes, skirtas mikroorganizmų prijungimui, ir kur grupės yra įvedamos jonizuojančios spinduliuotės gesinimu.

6. Būdas pagal 1 punktą, kur produktas yra organinė rūgštis, tokia kaip organinė rūgštis, parinkta iš grupės, susidedančios iš sviesto rūgšties, pieno rūgšties, acto rūgšties, propiono rūgšties ir gintaro rūgšties, geriau kur organinė rūgštis yra sviesto rūgštis ir kur organinė rūgštis yra pieno rūgštis.

7. Būdas pagal 1 punktą, kur produktas yra alkoholis, toks kaip metanolis, etanolis, propanolis, izopropanolis arba butanolis.

8. Būdas pagal 1 punktą, kur mokroorganizmas yra bakterija arba kur pluoštinė biomasė yra oksiduota švitinimu jonizuojančia spinduliuote.

9. Būdas pagal 8 punktą, kur švitinimas yra vykdomas, naudojant dalelių srautą.

10. Būdas pagal 1 punktą, kur pluoštinė biomasė apima celiuliozinę arba lignoceliuliozinę medžiagą arba kur pluošinė biomasė yra parinkta iš grupės, susidedančios iš popieriaus, popieriaus produktų, popieriaus atliekų, medžio, medžienos drožlių plokštės, pjuvenų, žemės ūkio atliekų, nutekamojo vandens, siloso, žolės, ryžių luobelių, išspaudų, džiuto, kanapių, linų, bambuko, sizalio, abakos, šiaudų, kukurūzų burbuolių, kukurūzų pašarų, sorų, mėlyiedės liucernos, šieno, kokoso plaukelių, medvilnės, jūros dumblių, dumblių ir jų mišinių.

11. Būdas pagal 1 punktą, kur biomasė yra gaunama iš biomasės žaliavos ir turi vidinių skaidulų ir kuri yra supjaustoma iki dydžio, kai yra atidengiamos jos vidinės skaidulos.

12. Būdas pagal 1 punktą, kur pluošinė biomasė turi didesnį negu 70% porėtumą arba papildomai apima biomesės medžiagos sigrąžinimą po fermentacijos ir pakartotinį medžiagos panaudojimą.

13. Būdas pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, papildomai apimantis biomasės paruošimą fiziškai, pvz., supjautant arba biomasės apimties sumažinimą, malant akmens girnomis, mechaniniu suardymu arba suplėšymu, smulkinimu smaigais arba oro trinties smulkinimu.

14. Būdas pagal 1 punktą, kur švitinimas yra vykdomas oksidavimo aplinkoje, kur aplinka yra oro arba deguonies antklodė.

15. Būdas pagal 1 punktą, kur biomasė apima pluoštus, kurios susijungia su derva, siekiant sudaryti kompozitą.

---

(51) Int.Cl. ***C12Q 1/68*** (2006.01)
C12N 9/22 (2006.01)
(11) **2456886**
(96) 10735050.6
(96) 2010-07-21
(97) 2012-05-30
(97) 2015-12-23
(86) PCT/GB2010/001384
(86) 2010-07-21
(87) WO 2011/010094
(87) 2011-01-27
(30) 0912637, 2009-07-21, GB
235177 P, 2009-08-19, US
(72) ELDE, Morten, NO
LANES, Olav, NO
GJELLESVIK, Dag, Rune, NO
(73) Biotec Pharmacon ASA, 9008 Tromsö, NO
(74) Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Nukleorūgšties užteršimo pašalinimas atvirkštinės transkripcijos ir amplifikacijos reakcijose
Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 0.

(57) 1. DNazė arba jos fermentiniu požiūriu aktyvus fragmentas, kur minėta DNazė turi SEQ ID Nr. 1 seką arba seką, kuri yra bent 60 % identiška su ja, bet kur prolino liekana SEQ ID Nr. 1 237 padėtyje, arba ekvivalentinė prolino kitose sekose, yra modifikuota, pašalinta arba pakeista, kur minėta DNazė arba jos fermentiniu požiūriu aktyvus fragmentas yra

(i) mažiausiai 95 % negrįžtamai inaktyvuota kaitinant 50 °C temperatūroje 5 minutes buferyje, susidedančiame iš 25 mM Tris/HCl, pH 8,5, 5 mM $MgCl_2$ ir 1 mM DTT; ir

(ii) iš esmės specifiška dvigrandei DNR.

2. DNazė arba jos fermentiniu požiūriu aktyvus fragmentas pagal 1 punktą, kur minėta DNazė turi SEQ ID Nr. 5 seką arba seką, kuri yra bent 60 % identiška su ja, bet kur prolino liekana SEQ ID Nr. 5 214 padėtyje, arba ekvivalentinė prolino kitose sekose, yra modifikuota, pašalinta arba pakeista, kur minėta DNazė arba jos fermentiniu požiūriu aktyvus fragmentas yra

(i) mažiausiai 95 % negrįžtamai inaktyvuota kaitinant 50 °C temperatūroje 5 minutes buferyje, susidedančiame iš 25 mM Tris/HCl, pH 8,5, 5 mM $MgCl_2$ ir 1 mM DTT; ir

(ii) iš esmės specifiška dvigrandei DNR.

3. DNazė arba jos fragmentas pagal 1 arba 2 punktą, kur DNazė turi seką DNazės, kuri yra gauta iš tipo Arthropodoa rūšies, geriau iš potipio, parinkto iš Crustacea, Hexpoda, Chelicerata arba Miriapoda rūšies, bet kur prolino liekana ekvivalentiška SEQ ID Nr. 1 327 padėties prolinui yra modifikuota, pašalinta arba pakeista.

4. DNazė arba jos fragmentas pagal 3 punktą, kur DNazė turi seką DNazės, kuri yra gauta iš rūšies, parinktos iš

Pandalus borealis, *Paralithodes camtschaticus* (karališkas krabas), *Marspenus japonicus* (japoninė krevetė) arba *Penaeus japonicus,* geriau *Pandalus borealis,* bet kur prolino liekana ekvivalentiška SEQ ID Nr. 1 327 padėties prolinui yra modifikuota, pašalinta arba pakeista.

5. DNazė arba jos fragmentas pagal bet kurį iš 1-4 punktų, kur DNazė turi seką SEQ ID Nr. 3 arba SEQ ID Nr. 7.

6. Nukleorūgšties užteršimo pašalinimo būdas iš

(i) atvirkštinės transkripcijos reakcijos, arba

(ii) karšto paleidimo PGR, kur minėta reakcija yra barjeras karšto paleidimo PGR struktūrai ir/arba yra susijusi su karšto paleidimo PGR polimeraze,

kur būdas apima DNazės arba jos fragmento pagal bet kurį iš 1-5 punktų panaudojimą.

7. Būdas pagal 6 punktą, kur atvirkštinės transkripcijos reakcijos mišinys, karšto paleidimo PGR struktūra, karšto paleidimo PGR mišinys arba bet kuris iš jos individualių komponentų kontaktuoja su DNaze arba jos fragmentu esant sąlygoms, kurios leidžia suskaldyti bet kurią užteršiančią dvigrandę DNR, ir po to reakcijos mišinys yra kaitinamas, siekiant inaktyvuoti DNazę arba jos fragmentą, geriau kur atvirkštinės transkripcijos reakcijos mišinys yra pilnas mišinys ir yra kaitinamas atvirkštinės transkripcijos fermento darbinėje temperatūroje, siekiant inaktyvuoti DNazę arba jos fragmentą.

8. Taikinio nukleorūgšties atvirkštinės transkripcijos *in vitro* būdas, kur minėtas būdas turi atvirkštinės transkripcijos reakcijos mišinio apdorojimo DNaze arba jos fragmentu pagal bet kurį iš 1-5 punktų pakopą prieš tikrąją atvirkštinės transkripcijos reakcijos pradžią, geriau kur atvirkštinės transkripcijos reakcijos mišinys yra pilnas mišinys ir yra kaitinamas atvirkštinės transkripcijos fermento darbinėje temperatūroje, siekiant inaktyvuoti DNazę arba jos fragmentą.

9. Būdas pagal bet kurį iš 6-8 punktų, kur minėta atvirkštinės transkripcijos reakcija seka po nukleorūgšties amplifikacijos reakcijos, geriau kur minėta nukleorūgšties amplifikacijos reakcija yra PGR, LCR, SDA, 3SR arba LAMP.

10. Būdas pagal 9 punktą, kur atvirkštinės transkripcijos reakcija ir amplifikacijos reakcija yra atliekamos viename reakcijos inde.

11. Karšto paleidimo PGR būdas, kur minėta reakcija yra karšto paleidimo PGR struktūros barjeras ir/arba apima karšto paleidimo DNR polimerazę, kur minėtas būdas turi karšto paleidimo PGR struktūros/mišinio arba karšto paleidimo DNR polimerazės apdorojimo DNaze arba jos fragmentu pagal bet kurį iš 1-5 punktų pakopą prieš pradedant karšto paleidimo PGR.

12. Nukleorūgšties molekulė, koduojanti DNazę arba jos fragmentą pagal bet kurį iš 1-5 punktų, geriau kur minėta nukleorūgšties molekulė apima SEQ ID Nr. 4 arba SEQ ID Nr. 8 nukleotidų seką.

13. DNazės arba jos fragmento pagal bet kurį iš 1-5 punktų išskyrimo ir gryninimo būdas, apimantis minėtos DNazės arba jos fragmento raišką tinkamoje ląstelėje šeimininkėje ir vėliau DNazės arba jos fragmento atskyrimą iš minėtų ląstelių šeimininkių ir/arba terpės, kurioje ląstelės buvo kultivuotos.

14. Rinkinys arba kompozicija, skirtas atlikimui būdo pagal bet kurį iš 6-11 punktų, kur minėtas rinkinys arba kompozicija apima DNazę arba jos fragmentą pagal bet kurį iš 1-5 punktų ir/arba nukleorūgštį pagal 12 punktą; ir pasirinktinai vieną arba keletą iš šių

(i) nukleotido trifosfatą;

(ii) oligonukleotido pradmenį;

(iii) atvirkštinės transkripcijos fermentą;

(iv) DNR polimerazes;

(v) DNR ligazę; ir

(vi) restrikcijos fermentą.

(51) Int.Cl. ***C25D 5/10*** (2006.01)
C25D 5/36 (2006.01)
C25D 5/50 (2006.01)
C25D 7/06 (2006.01)
B32B 15/01 (2006.01)
C25D 5/48 (2006.01)

(11) **2808426**

(96) 14160952.9

(96) 2014-03-20

(97) 2014-12-03

(97) 2016-03-16

(30) 102013105392, 2013-05-27, DE

(72) Oberhoffer, Helmut, Dr., DE
Liebscher, Benjamin, DE
Szesni, Anika, DE
Sauer, Reiner, Dr., DE
Friedrich, Karl-Ernst, DE

(73) ThyssenKrupp Rasselstein GmbH, 56626 Andernach, DE

(74) Vitalija BANAITIENĖ, 55, UAB TARPINĖ, A.P.Kavoliuko g. 24-152, LT-04328 Vilnius, LT

(54) Plieno lakšto dengimo metalo danga būdas

Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 1.

(57) 1. Plieno lakšto dengimo metalo danga būdas, apimantis toliau nurodytus etapus:

- pirmos plonos metalo dangos uždėjimas kaip pirminis dengimas metalu, kur pirminio dengimo metalo dangos storis yra daugiausia 200 mg/m^2,
- pirminio dengimo metalo dangos lydymas metalo dangą apšvitinant elektromagnetine spinduliuote arba elektronine spinduliuote, kur pirminio dengimo metalo danga yra išlydoma visiškai per visą storį ir taip bent iš esmės visiškai paverčiama į lydinio sluoksnį, sudarytą iš plieno lakšto geležies atomų ir metalo dangos metalo atomų,
- bent vienos papildomos metalo dangos uždėjimas ant lydinio sluoksnio, gauto lydant.

2. Būdas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad po lydymo etapo išlydyta pirminio dengimo metalo danga yra atšaldoma iki temperatūros, žemesnės negu metalo dangos lydymosi temperatūra.

3. Būdas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad apšvitinimo laikas, kada pirminio dengimo metalo danga yra aššvitinama elektromagnetine spinduliuote arba elektronine spinduliuote, yra daugiausia 10 ms, geriau tarp 10 ns ir 1 ms.

4. Būdas pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad pirminio dengimo metalo dangos storis yra tarp 50 mg/m^2 ir 200 mg/m^2, geriau 100 mg/m^2.

5. Būdas pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad elektromagnetinės spinduliuotės , spinduliuojamos tam, kad išlydytų pirminio dengimo metalo dangą, energijos tankis yra tarp 0,03 J/cm^2 ir 3 J/cm^2, geriau tarp 0,1 ir 2 J/cm^2.

6. Būdas pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad po papildomo metalo dangos uždėjimo ant pirminio dengimo metalo dangos, padengtas plieno lakštas yra kaitinamas indukciniu būdu iki temperatūros, didesnės negu metalo dango lydymosi temperatūra tam, kad išlydytų visiškai visą metalo dangą.

7. Būdas pagal 6 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad po papildomo metalo dangos uždėjimo ant pirminio dengimo metalo dangos, padengtas plieno lakštas yra kaitinamas iki temperatūros tarp 232°C ir 300°C, geriau tarp 240°C ir 260°C.

8. Būdas pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad pirminio dengimo metalo danga yra dedama ant plieno lakšto iš abiejų jo pusių galvaniniu metalo dangos nusodinimo būdu ir tuo, kad pirminio dengimo metalo dangos lydymas yra vykdomas tik vienoje pusėje.

9. Būdas pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad pirminio dengimo lydymas yra vykdomas

spinduliuojant kryptinį spindulių pluoštą į pirminio dengimo metalo dangos paviršių, kur spindulių pluoštas yra spinduliuojamas nepertraukiamai arba impulsais, geriau maksimalia 1 ms impulso trukme.

10. Būdas pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad metalo dangos sluoksnio medžiaga susideda iš alavo, cinko ar nikelio, kur pirminio dengimo metalo danga ir papildoma metalo danga yra iš tos pačios dangos sluoksnio medžiagos.

11. Būdas pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad papildomo(-ų) metalo dangos(-ų) storis yra tarp 0,5 g/m^2 ir 12 g/m^2.

12. Būdas pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad pirminio dengimo metalo danga ir papildoma metalo danga kiekvienu atveju yra aliuminio danga ir tuo, kad pirminio dengimo aliuminio danga yra kaitinama iki temperatūros tarp 250°C ir 500°C, geriau tarp 300°C ir 400°C, kad būtų išlydyta prieš pirminio dengimo lydytos aliuminio dangos padengimą bent vienu papildomu aliuminio dangos sluoksniu.

13. Plieno juostos(1) galvaninio padengimo metalo danga įrenginys su daugybe dengimo vonelių (2), kurios išdėstytos viena po kitos ir pro kurias juostos judėjimo kryptimi (v) yra kreipiama plieno juosta (1) tam, kad uždėtų metalo dangą galvaninio nusodinimo būdu, kur juostos judėjimo kryptimi priekinėje dengimo vonelėje ar vonelėse (2a, 2b) pirmiausia pirminė plona metalo danga yra uždedama kaip pirminis dengimas ir ant jos dedamas papildomas metalo dangos sluoksnis toliau esančiose dengimo vonelėse (2c, 2d, 2e,...), b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad juostos judėjimo kryptimi priekinėje dengimo vonelėje ar vonelėse (2a, 2b) pirmiausia pirminė plona metalo danga yra uždedama kaip pirminis dengimas danga, kurios sluoksnio storis yra daugiausia 200 mg/m^2, o elektromagnetinės spinduliuotės arba elektroninės spinduliuotės spinduliavimo šaltinis (3) yra išdėstytas juostos judėjmo kryptimi už priekinės padengimo vonelės ar vonelių (2a, 2b) tam, kad lydytų pirminio dengimo metalo dangą, apšvitinant elektromagnetine spinduliuote, ypač lazerio pluoštu arba elektronų pluoštu.

14. Plieno lakštas, aprūpintas metalo danga, ir pagamintas būdu pagal bet kurį iš 1-12 punktų, kur ribiniame sluoksnyje tarp plieno lakšto paviršiaus ir metalo dangos yra suformuotas plonas lydinio sluoksnis, sudarytas iš plieno lakšto geležies atomų ir dangos medžiagos metalo atomų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad lydinio sluoksnio storis yra daugiausia 200 mg/m2 ir metalo dangoje laisvo neišlydyto metalo dalis yra bent 50%, geriau tarp 80 % ir 99 %.

---

(51) Int.Cl. ***D21F 11/00*** (2006.01)
B31F 1/12 (2006.01)
(11) **2610051**
(96) 13001373.3
(96) 2006-03-21
(97) 2013-07-03
(97) 2016-03-16
(30) 108375, 2005-04-18, US
(72) Super, Guy H., US
Edwards, Steven L., US
McCullough, Stephen J., US
Murray, Frank C., US
(73) Georgia-Pacific Consumer Products LP, Atlanta GA 30303, US
(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Medžiaginio krepinimo sugeriantysis celiuliozinis lakštas
Apibrėžties punktai: 13, brėžiniai: 20.

(57) 1. Medžiaginio krepinimo sugeriantysis celiuliozinis lakštas (10), sudarytas iš daugybės tarpusavyje sujungtų skirtingo vietinio pagrindo svorio sričių ir pagamintas naudojant procesą, apimantį šiuos etapus:

(a) popieriaus gamybos žaliavos kompaktišką nusausinimą tam, kad būtų suformuotas besiformuojantis tinklas (74), turintis popieriaus gamybos pluošto atsitiktinį pasiskirstymą;

(b) nusausinto tinklo (74), turinčio pluošto atsitiktinį pasiskirstymą, klojimą ant pernešančio perdavimo paviršiaus (94), judančio perdavimo paviršiaus greičiu;

(c) tinklo (74) medžiaginį krepinimą nuo pernešančio perdavimo paviršiaus (94) maždaug 30–60 proc. tankiu, naudojant reljefinę krepinimo juostą (48), krepinimo etapas vyksta esant slėgiui juostinio krepinimo gnybte (106), apibrėžtame tarp perdavimo paviršiaus (94) ir krepinimo medžiagos (48), kur krepinimo medžiaga (48) juda medžiaginio krepinimo greičiu, kuris yra mažesnis už perdavimo paviršiaus greitį ir medžiagos raštas, gnybto

parametrai, greičio pokytis ir tinklo tankumas yra parinkti tokie, kad tinklas (74) yra krepinamas nuo perdavimo paviršiaus (94) bei perskirstomas ant krepinimo medžiagos taip, kad būtų suformuotas krepintas tinklas su tampriu tinkleliu, turintis daugybę tarpusavyje sujungtų skirtingo vietinio pagrindo svorio sričių, apimančių bent:

(i) daugybę pluoštu praturtintų didelio vietinio pagrindo svorio sričių (12), tarpusavyje sujungtų

(ii) daugybe mažesnio vietinio pagrindo svorio jungiamųjų sričių (14);

(d) krepinto tinklo klojimą ant džiovinimo cilindro (110);

(e) krepinto tinklo džiovinimą ant džiovinimo cilindro (110) išdžiovintam tinklui suformuoti;

(f) išdžiovinto tinklo nuėmimą nuo džiovinimo cilindro, kur etapai (d), (e) ir (f) vykdomi taip, kad iš esmės būtų išsaugotas tamprusis tinklelis;

b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad

lakšto paruošimo procesas papildomai apima:

(g) išdžiovinto tinklo ištempimą sugeriančiajam celiuliozinia lakštui suformuoti, kur džiovinimo etape pluoštu praturtintos sritys (12) yra ištempiamos medžiagos judėjimo mašinoje kryptimi (MD).

2. Medžiaginio krepinimo sugeriantysis celiuliozinis lakštas pagal 1 punktą, kur, prieš ištempiant lakštą (74), pluoštu praturtintų sričių (12) nukreipimo poslinkis yra statmenas medžiagos judėjimo mašinoje krypčiai (CD).

3. Medžiaginio krepinimo sugeriantysis celiuliozinis lakštas pagal vieną iš pirmesnių punktų, kur pluoštu praturtintos sritys (12) turi daugybę išplėstų mikroklosčių.

4. Medžiaginio krepinimo sugeriantysis celiuliozinis lakštas pagal vieną iš pirmesnių punktų, kur lakšto sugeriamoji geba yra maždaug nuo 6 g/g iki 9 g/g.

5. Medžiaginio krepinimo sugeriantysis celiuliozinis lakštas pagal vieną iš pirmesnių punktų, kur lakšto storis yra nuo 1,27 mm / 8 lakštams (50 mil / 8 lakštams) iki 2,92 mm / 8 lakštams (115 mil / 8 lakštams).

6. Medžiaginio krepinimo sugeriantysis celiuliozinis lakštas pagal vieną iš pirmesnių punktų, kur lakšto tempimo medžiagos judėjimo mašinoje kryptimi ir skersine medžiagos judėjimui kryptimi (MD/CD) santykis yra mažiau nei maždaug vienetas.

7. Medžiaginio krepinimo sugeriantysis celiuliozinis lakštas pagal vieną iš pirmesnių punktų, kur lakšto ištempimas skersine medžiagos judėjimui mašinoje kryptimi (CD) yra nuo maždaug penkių iki maždaug penkiolikos procentų.

8. Medžiaginio krepinimo sugeriantysis celiuliozinis lakštas pagal vieną iš pirmesnių punktų, kur lakšto sugeriamoji geba yra nuo maždaug 6 g/g iki 9 g/g, storis – nuo 1,27 mm / 8 lakštams (50 mil / 8 lakštams) iki 2,92 mm / 8 lakštams (115 mil / 8 lakštams), lakšto tempimo medžiagos judėjimo mašinoje kryptimi ir skersine medžiagos judėjimui kryptimi (MD/CD) santykis – mažiau nei maždaug vienetas, o lakšto ištempimas skersine medžiagos judėjimui mašinoje kryptimi (CD) – nuo maždaug penkių iki maždaug penkiolikos procentų.

9. Medžiaginio krepinimo sugeriantysis celiuliozinis lakštas pagal vieną iš pirmesnių punktų, kur tempimo etape gerokai padidinamas išdžiovinto tinklo tuštumų tūris.

10. Medžiaginio krepinimo sugeriantysis celiuliozinis lakštas pagal vieną iš pirmesnių punktų, kur tempimo etape padidinamas bent dvidešimties procentų išdžiovinto tinklo tuštumų tūris.

11. Medžiaginio krepinimo sugeriantysis celiuliozinis lakštas pagal vieną iš punktų nuo1 iki 9, kur tempimo etape padidinamas bent trisdešimties procentų išdžiovinto tinklo tuštumų tūris.

12. Medžiaginio krepinimo sugeriantysis celiuliozinis lakštas pagal vieną iš punktų nuo1 iki 9, kur tempimo etape padidinamas bent keturiasdešimties procentų išdžiovinto tinklo tuštumų tūris.

13. Medžiaginio krepinimo sugeriantysis celiuliozinis lakštas pagal vieną iš pirmesnių punktų, kur tempimo etape sumažinamas išdžiovinto tinklo lateralumas.

(51) Int.Cl. ***E01B 25/28*** (2006.01)
(11) **2191070**
(96) 08848482.9
(96) 2008-08-22
(97) 2010-06-02
(97) 2016-01-27
(86) PCT/FR2008/001205
(86) 2008-08-22
(87) WO 2009/060134
(87) 2009-05-14
(30) 0706047, 2007-08-29, FR
(72) ANDRE, Jean-Luc, FR
KLOTZ, Martin, FR
(73) NewTL, 67120 Ernolsheim sur Bruche, FR
(74) dr. Juozas LAPIENIS, 45, UAB „MSP Europe“, Šeimyniškių g. 21-92, LT-09236 Vilnius, LT
(54) Surenkamas bėgių kelio modulis, skirtas automatiškai valdomai miesto transporto priemonei su pneumatinėmis padangomis

Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 12.

(57) 1. Bėgių kelio modulis (1), surenkamas gamykloje, kuris skirtas prijungti iš eilės vieną paskui kito, kad būtų sudarytas bėgių kelias, skirtas automatiškai valdomoms miesto transporto priemonėms su pneumatinėmis padangomis, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis apima:

- vientisą betono monobloko laikančiąją struktūrą (2), apimančią du šoninius gulekšnius (4), kurių viršutinis paviršius (5) paprastai plokščias, tinkantis kaip judėjimo paviršius miesto transporto priemonei su pneumatinėmis padangomis, ir jungiančias skersines sijas (8), sujungiančias šoninius gulekšnius (4) ir išlaikančias juos iš esmės lygiagrečius, kur šoninių gulekšnių (4) apatinis paviršius (6) ir jungiančiųjų sijų (8) apatinis paviršius (39) yra atramos į gruntą paviršiai:
- kreipiamojo bėgio dalį (3), pritvirtintą prie laikančiosios struktūros (2), skirtą miesto transporto priemonės judėjimui nukreipti.

2. Bėgių kelio modulis (1) pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis iš esmės yra tiesus, išlenktas, arba, apskritai, yra trapecijos formos.

3. Bėgių kelio modulis (1) pagal bet kurį iš ankstesniųjų punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad laikančioji struktūra (2) yra pagaminta pilnai arba dalinai iš gelžbetonio.

4. Bėgių kelio modulis (1) pagal bet kurį iš ankstesniųjų punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad šoninių gulekšnių (4) skerspjūvis yra iš esmės stačiakampis, arba paprastai turi išgaubtą viršutinį paviršių (5) arba viršutinis paviršius (5) turi pritvirtinimo briaunas.

5. Bėgių kelio modulis (1) pagal bet kurį iš ankstesniųjų punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kreipiamojo bėgio dalis (3) yra išdėstyta iš esmės centrinėje padėtyje.

6. Bėgių kelio modulis (1) pagal bet kurį iš ankstesniųjų punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kreipiamojo bėgio atkarpa (3) yra pritvirtinta prie laikančiosios struktūros (2) ant kiekvienos iš jungiančiųjų skersinių sijų (8) panaudojant tvirtinimo detales (18).

7. Bėgių kelio modulis (1) pagal bet kurį iš ankstesniųjų punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad ant kiekvienos iš skersinių sijų (8) kreipiamojo bėgio atkarpa (3) yra įsprausta tarp dviejų tvirtinimo detalių (18), pritvirtintų prie atitinkamų skersinių sijų (8).

8. Bėgių kelio modulis (1) pagal bet kurį iš 1-6 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad laikančioji struktūra (2) apima vidurinįjį gulekšnį (23), išdėstytą tarp dviejų šoninių gulekšnių (4), ir ant kurio yra pritvirtinta kreipiamojo bėgio atkarpa (3).

9. Bėgių kelio modulis (1) pagal bet kurį iš ankstesniųjų punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kreipiamojo bėgio atkarpa (3) yra įstatyta į papildomą tam tikros formos kanalą (25), suformuotą viduriniajame gulekšnyje (23).

10. Bėgių kelio modulis (1) pagal bet kurį iš ankstesniųjų punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kreipiamojo bėgio

atkarpos (3) skerspjūvis iš esmės yra I-formos su galvute (9), tarnaujančia kaip riedėjimo paviršius transporto priemonės kreipiamajam voleliui arba voleliams, ir atramine apačia (10), sujungtas pailgintu siauru kakleliu (11).

11. Bėgių kelio modulis (1) pagal bet kurį iš ankstesniųjų punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kreipiamojo bėgio atkarpos (3) apatinė dalis yra padengta dangos medžiaga (13), sudarančią dangą (14), kuri tęsiasi į viršų per bent vieną šoninė iškyšą (15), kur tarp iškyšos ir bėgio (3) galvutės (9) susidaro šoninis kreipimasis griovelis (16).

12. Bėgių kelio modulis (1) pagal bet kurį iš ankstesniųjų punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kreipiamojo bėgio atkarpų (3) galai (29) ir jų šoniniai gulekšniai (4) turi išilginį poslinkį.

13. Bėgių kelio modulio (1) pagal bet kurį iš ankstesniųjų punktų klojimo būdas, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kreipiamojo bėgio (3) padėtis yra nustatoma po to, kai yra nustatyta laikančiosios struktūros (2) padėtis.

14. Bėgių kelio modulio (1) pagal bet kurį iš ankstesniųjų punktų klojimo būdas, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis yra dedamas ant nedidelio papildomo sluoksnio tiesiog ant gatvės viršaus arba ant egzistuojančio žemės paviršiaus arba gali būti įrengiamas tranšėjoje (32), kurios pagrindas (34) paprastai gali būti paruoštas ir supluktas.

15. Kelias, skirtas automatiškai nukreipiamoms miesto kelių transporto priemonėms su pneumatinėmis padangomis, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis yra sudarytas iš eilės surenkamų bėgių kelio modulių (1) pagal bet kurį iš ankstesniųjų punktų.

---

(51) Int.Cl. ***E04H 17/14*** (2006.01)
A01K 3/00 (2006.01)

(11) **2896768**

(96) 14161952.8

(96) 2014-03-27

(97) 2015-07-22

(97) 2016-03-23

(30) 2013113, 2014-01-15, LT

(72) Tamošaitis, Romualdas, LT

(73) Dr. R. Tamošaičio nepriklausomas ekspertų biuras, 10231 Vilnius, LT

(74) Virgina Adolfina DRAUGELIENĖ, 8, UAB TARPINĖ, A.P.Kavoliuko g. 24-152, LT-04328 Vilnius, LT

(54) Plastikinių vamzdžių tvora

Apibrėžties punktai: 1, brėžiniai: 1.

(57) 1. Plastikinių vamzdžių tvora, apimanti bent du plastikinius tuščiavidurius vertikalius stulpus (3), tarp kurių yra išdėstytas ir prie jų pritvirtintas tvoros blokas, kur tvoros blokas apima bent du horizontalius plastikinius vamzdžius (1), sujungtus su vertikaliais plastikiniais vamzdžiais (2), tvoros blokas pritvirtintas prie plastikinių tuščiavidurių vertikalių stulpų (3) prakišant horizontalių vamzdžių (1) galus per skyles, padarytas numatytame aukštyje minėtuose vertikaliuose stulpuose (3), b e s i s k i r i a n t i tuo, kad perkištų horizontalių vamzdžių (1) galai turi viduje įlydytus metalinius tinklelius, o minėtų perkištų horizontalių vamzdžių (1) galai pritvirtinti prie tuščiavidurių vertikalių stulpų (3) jų viduje persmeigiant minėtus įkištus horizontalių vamzdžių (1) galus kaiščiais (4) sudarant stabilų išardomą sujungimą, ir tuo, kad minėto tvoros bloko horizontalūs vamzdžiai (1) turi skersines skyles, skirtas pro jas perkišti vertikalius plastikinius vamzdžius (2), kur minėtų skersinių skylių diametras ir forma horizontaliuose vamzdžiuose (1) taip pat ir vertikalių vamzdžių (2), perkištų per minėtas skyles, diametras ir forma atitinkamai yra iš anksto parinkti ir suformuoti taip, kad užtikrintų stabilų išardomą sujungimą.

---

(51) Int.Cl. ***E05B 17/20*** (2006.01)

(11) **2401456**

(96) 10746516.3

(96) 2010-02-26

(97) 2012-01-04

(97) 2016-02-17

(86) PCT/SE2010/050225

(86) 2010-02-26

(87) WO 2010/098721

(87) 2010-09-02

(30) 0900265, 2009-02-27, SE

(72) HIRVI, Jorma, SE
FÄLT, Mathias, SE

(73) ASSA AB, 631 05 Eskilstuna, SE

(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT

(54) Užrakinimo įrenginys
Apibrėžties punktai: 11, brėžiniai: 7.

(57) 1. Užrakinimo įrenginys, apimantis
- užrakto mechanizmą,
- užrakto atramą (1, 101, 201, 301, 401), turinčią bent vieną skląsčio kiaurymę (9, 109, 209, 309, 409) ir
- bent vieną skląstį (10, 110, 210, 310, 410), kuris yra mechaniškai sujungtas su užrakto mechanizmu ir yra judrus tarp atitrauktos pozicijos užrakto mechanizmo kryptimi ir pozicijos, nusitęsiančios per skląsčio kiaurymę, ir kuris turi blokavimo iškyšas (14, 15, 114, 115, 214, 215, 314, 315, 414, 415), patalpintas viduje užrakto atramos ir atsikišusias šonine kryptimi judėjimo krypties atžvilgiu, ir priekinė skląsčio dalis (11, 111, 211, 311, 411) patalpinta blokavimo išsikišimo priekyje ir nutįsusioje pozicijoje įdėta į skląsčio kiaurymę su tarpu į užrakto atramą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad dengiantis elementas (42, 43, 242, 243, 342, 343), kuris yra užfiksuotas santykyje su užrakto atrama (1, 101, 201, 301, 401) ir driekiasi lygiagrečiai su skląsčio (10, 110, 210, 310, 410) judėjimo kryptimi, kurio dengiantis elementas turi pirmąjį griovelį, kuris, kai skląstis yra ištiestoje pozicijoje, yra patalpintas šoniniu būdu blokavimo iškyšų (14, 15, 114, 115, 214, 215, 314, 315, 414, 415) išorėje ir yra atviras skląsčio kryptimi.

2. Užrakinimo įrenginys pagal 1 punktą, kuriame pirmasis griovelis yra tęstinis plyšys (51, 52, 153, 154, 251, 252, 453, 454).

3. Užrakinimo įrenginys pagal 1 arba 2 punktą, apimantis plokštę (31, 32, 231, 232, 331, 332), patalpintą dangos elemento (42, 43, 242, 243, 342, 343) išorėje, numatytą su pirmuoju tęstiniu plyšiu (51, 52, 153, 154, 251, 252, 453, 454), kur plokštė išsidėsto iš esmės lygiagrečiai su dangos elementu.

4. Užrakinimo įrenginys pagal 3 punktą, kuriame plokštė (31, 32, 231, 232) remiasi priešais dengiančiojo elemento (42, 43, 242, 243) išorinę pusę.

5. Užrakinimo įrenginys pagal 3 punktą, kuriame plokštė (331, 332) yra patalpinta tam tikru atstumu nuo dengiančiojo elemento (341, 342) išorinės pusės taip, kad tarpas (361, 362), kuriame pasirodo kiaurymė (351, 352), yra suformuotas tarp dengiančiojo elemento ir plokštės.

6. Užrakinimo įrenginys pagal bet kurį vieną 3 - 5 punktą, kuriame pirmasis griovelis yra pirmasis tęstinis plyšys (51, 52) ir antrasis griovelis yra patalpintas plokštėje (31, 32), už pirmojo plyšio.

7. Užrakinimo įrenginys pagal bet kurį vieną 1 – 6 punktą, kuriame dengiantysis elementas (42, 43, 242, 243, 342, 343) apima juostą (4, 204, 304), fiksuotą prie užrakto atramos (1, 201, 301), iš esmės L – formos arba U – formos skerspjūvio.

8. Užrakinimo įrenginys pagal bet kurį vieną 1 – 6 punktą, kuriame dengiantysis elementas apima dangos plokštę, sudarančią užrakto korpuso šoninę sienelę (131, 132, 431, 432), kuri yra pritvirtinta prie užrakto atramos (101, 301).

9. Užrakinimo įrenginys pagal bet kurį vieną 1 – 8 punktą, kuriame blokavimo išsikišimas (214, 215, 314, 315, 414, 415) patalpintas ant skląsčio (210, 310, 410) turi įpjovimą (220, 221, 320, 321, 420, 421), kuris yra atviras kryptimi į priekinę skląsčio dalį (211, 311, 411).

10. Užrakinimo įrenginys pagal bet kurį vieną 1 – 8 punktą, apimantis blokavimo elementą, kuris yra patalpintas taip, kad būtų ribojamai perstumiamas plokštumoje, esančioje ne lygiagrečiai su skląsčio (410) judėjimo kryptimi. tarp užrakinimo atramos (401) ir blokavimo iškyšos (414, 415).

11. Užrakinimo įrenginys pagal 10 punktą, kuriame blokavimo elementas apima blokavimo plokštę (470), turinčią kiaurymę (473), kuri apsupa skląstį (410).

(51) Int.Cl. ***E05B 25/00*** (2006.01)
(11) **2453084**
(96) 11008975.2
(96) 2011-11-11
(97) 2012-05-16
(97) 2016-01-06
(30) 20100843, 2010-11-16, CZ
(72) Dvorak, Lubos, CZ
Pivnicka, Milan, CZ
(73) Tokoz A.S., 59102 Zdar nad Sazavou, CZ
(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
(54) Cilindrinis užraktas, veikiantis su besisukančiu raktu
Apibrėžties punktai: 4, brėžiniai: 11.
(57) 1. Cilindrinis užraktas, veikiantis su besisukančiu raktu, minėtas užraktas apimantis bazinį korpusą (1), numatytą su cilindrine gręžtine kiauryme (2), kuriame žiedinių plokščių rinkinys, sudarantis bent gaudykles (4), išdėstytas išilgai ašies, minėtos gaudyklės (4) yra užrakintos prieš nenumatytą sukimąsi ir pritaikytos susikabinimui su pasukamo rakto strypu, su bent vienu reversiniu mechanizmu (29), taip pat su valdymo priemone gaudyklių (4) išlyginimui pozicijoje, įgalinančioje pašalinti besisukantį raktą iš užrakto, kuriame daugybė gretimų pleištų (3) yra sukonstruoti ašine kryptimi cilindrinėje gręžtinėje angoje (2), tarpuoti pleištai (3) yra užrakinti prieš santykinį judėjimą, ir skersinis plyšys (47) reversinio mechanizmo (29) įvedimui yra numatytas kiekvieno iš tarpuotų pleištų (3) perimetro plote, kuriame bent gaudyklės (4) yra individualiai laisvai besisukančiai visiškai patalpintos į tarpuotus pleištus (3), kurie yra pritaikyti susijungti su bent vienu reversiniu mechanizmu (29), su priemonėmis, skirtomis užrakinti gaudykles (4) prieš nenumatytą sukimąsi ir su priemonėmis, skirtomis jas išlygiuoti į poziciją, įgalinančią pašalinti besisukantį raktą ir praeiti rakto kojelei, paskutinis tarpuotas pleištas (3) šliejasi prie galinio elemento (35), b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad labirinto anga (48) porai grąžinimo strypų (13) yra sukonstruotas priešais skersinį plyšį (47) ir išilgai kiekvieno tarpuoto pleišto (3) vienpusio lanko (70) vidinio apskritiminio paviršiaus (44), minėta anga (48) yra numatyta su dviem priešingomis kreipiančiosiomis briaunomis (49, 50) ir su atramine briauna (51, 52) ties abiem galais, briaunos (51, 52) pereina į atraminius griovelius (53, 54), kryptimi link tarpuoto pleišto (3) vienašalio lanko (70) vidinio apskritiminio paviršiaus (44).

2. Cilindrinis užraktas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kiekvienas tarpuotas pleištas (3) apima apskritiminę plokštę (69) numatytą su išoriniu kontaktiniu paviršiumi (43) ir vidiniu paviršiumi (42) taip pat su pertraukiamai vienpusiu lanku (70), nustatytu priešakiniu kontaktiniu paviršiumi (41), kuriame atstumas tarp priešakinio kontaktinio paviršiaus (41) ir vidinio paviršiaus (42) nusidriekia per attinkamos gaudyklės (4) storį, ir vienpusis lankas (70) yra numatytas su vidiniu apskritu paviršiumi (44) gaudyklei (4) laikyti jos funkcinėje pozicijoje, ir su išoriniu apskritiminiu paviršiumi (45) tarpuotam pleištui (3) paremti viduje bazinio korpuso (1) gręžtinės angos (2), tuo tarpu ašinė kiaurinė gręžtinė anga (46) besisukančio rakto įstatymui yra numatyta žiedinėje plokštėje (69).

3. Cilindrinis užraktas pagal 1 arba 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad bent viena atraminė iškyša (55) nusidriekia nuo kiekvieno tarpuoto pleišto (3) vienpusio lanko (70) priešakinio kontaktinio paviršiaus (41) ir forminis griovelis (56), besidriekiantis iš dalies žiedinėje plokštėje (69) yra numatytas vienpusiame lanke (70) už atraminės iškyšos (55).

4. Cilindrinis užraktas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad apribojantis elementas (35) yra suformuotas per cilindrinį korpusą, numatytą su aklina arba kiaurine ašine anga (59) besisukančio rakto strypo galinės dalies įstatymui ir su bent viena susijungimo iškyša *(57)* ir forminiu grioveliu (58), esančiu ant jo priešakinės pusės, apribojančio elemento periferinė sritis dar yra numatyta su neribojamu modeliu (60) susijungimui su grąžinimo strypų (13) pora, neribojamas modelis (60), numatytas priešakiniu atraminiu paviršiumi (61) ir apatiniu paviršiumi (62), kuris atitinka kreipiantįjį kraštą (49), esantį ant tarpuoto pleišto (3) proksimaliai centrinei linijai , ir kuris yra apribotas su galiniais grioveliais (63, 64), tuo tarpu - priešingoje pozicijoje neribojamo modelio (60) atžvilgiu – ribojančio elemento periferinė sritis dar yra numatyta su išilginiu plyšiu (65) suderintu su tarpuoto pleišto (3) skersiniu plyšiu (47) ir su skersiniu grioveliu (67) susijungiančiu su sulaikančiu užraktu (37).

---

(51) Int.Cl. ***E05D 11/06*** (2006.01)
E05F 1/12 (2006.01)
E05F 3/20 (2006.01)
E05F 3/12 (2006.01)
(11) **2785940**
(96) 13792484.1

(96) 2013-10-04
(97) 2014-10-08
(97) 2016-02-17
(86) PCT/IB2013/059121
(86) 2013-10-04
(87) WO 2014/054029
(87) 2014-04-10
(30) VI20120249, 2012-10-04, IT
VI20120250, 2012-10-04, IT
(72) BACCHETTI, Luciano, IT
(73) In & Tec S.r.l., 25128 Brescia, IT
(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Durų, langinių ir pan. vyrių mechanizmas
Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 50.

(57) 1. Vyrių mechanizmas uždaromojo elemento (D), pvz., durų, langinių ir pan. sukamajam judėjimui ir (arba) valdymui užtikrinti uždarymo ir (arba) atidarymo metu, pritvirtintas prie nejudamosios atraminės konstrukcijos (S), pvz., sienos arba rėmo, apimantis:

- fiksuotąjį elementą (10) tvirtinamą prie nejudamosios atraminės konstrukcijos (S);

- judamąjį elementą (11), tvirtinamą prie uždaromojo elemento (D), kur vienas minėtas fiksuotasis elementas (10) arba judamasis elementas (11) apima pirmąją vamzdinę apkabą (12), kur yra darbinė kamera (20), apibrėžianti išilginę ašį (X), o kitas minėtas fiksuotasis elementas (10) arba judamasis elementas (11) apima antrąją vamzdinę apkabą (13), kur pastaroji apkaba ir minėta pirmoji vamzdinė apkaba (12) yra uždėtos viena ant kitos, kad sukiotųsi aplink minėtą išilginę ašį (X) tarp atidarymo ir uždarymo padėties;

- atramą (50), įtaisytą išilgai minėtos ašies (X) minėtos kameros (20) išorėje, kur minėta atrama (50) ir minėta antroji vamzdinė apkaba (13) yra standžiai sujungtos ir minėta atrama (50) apima vamzdinę pagrindinę dalį (52);

- stūmoklinį elementą (30), funkciškai sujungtą su minėta atrama (50) ir įstatytą į minėtą darbinę kamerą (20) slankioti išilgai minėtos ašies (X) tarp galinės eigos padėties, esančios arčiausiai minėtos atramos (50) ir atitinkančios judamojo elemento atidarymo arba uždarymo padėtį (11), bei galinės eigos padėties, esančios toliausiai nuo atramos ir atitinkančios likusią judamojo elemento (11) atidarymo arba uždarymo padėtį;

- pailgintąjį cilindrinį elementą (60), besitęsiantį išilgai minėtos ašies (X), kurio pirmojo galo dalis (61) yra įstatyta į minėtą darbinę kamerą (20) ir sujungta su minėtu stūmokliniu elementu (30), o antrojo galo dalis (62), esanti darbinės kameros išorėje (20), slankioja minėtos atramos (50) pagrindinėje vamzdinėje dalyje (52);

- vamzdinę įvorę (80) turinčią porą kreipiamųjų kumštelių išpjovų (81), atskirtų 180° kampu, kur minėta vamzdinė įvorė (80) bendraašiai įtaisyta minėtos atramos (50) vamzdinės pagrindinės dalies (52) išorėje;

- minėta darbinė kamera apima elastines atoveikio priemones (40), veikiančias minėtą stūmoklinį elementą (30) taip, kad šis grįžtų iš minėtos artimosios arba tolimosios galinės eigos padėties į kitą minėtą artimąją arba tolimąją galinės eigos padėtį, kur minėtos elastinės atoveikio priemonės (40) juda išilgai minėtos ašies (X) tarp didžiausio ir mažiausio pailgėjimo padėties;

kur minėta atrama (50) apima bent vieną porą vienodų griovelių (70', 70"), atskirtų 180° laipsnių kampu, kiekvienas iš kurių sudarytas iš bent vienos sraigtinės dalies (71', 71"), apvyniotos aplink minėtą ašį (X); minėti grioveliai (70', 70") susisiekia vienas su kitu, kad butų apibrėžtas pralaidos vykdomasis elementas (72);

kur minėto pailgintojo elemento (60) minėta antroji galinė dalis (62) apima kaištį (73) , įstatytą į minėtą pralaidos vykdomąjį elementą (72) ir į minėtas kreipiamojo kumštelio išpjovas (81), kad slankiotų taip, jog būtų sukabinama tarpusavyje minėta atrama (50), minėtas pailgintasis cilindrinis elementas (60) ir minėta įvorė (80);

kur minėta įvorė (80) ir minėta pirmoji vamzdinė apkaba (12) yra abipusiai sujungtos tam, kad minėtos kumštelio išpjovos (81) nukreiptų minėtos atramos (73), veikiamos minėto pralaidos elemento (72), slinkimą, minėta įvorė (80) ir minėta antroji vamzdinė apkaba (13) yra bendraašiai sujungtos taip, kad viena iš jų apibrėžtų antrosios sukimosi ašį;

b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad elastinės atoveikio priemonės (40) ir minėtas stūmoklinis elementas (30) yra tarpusavyje sujungti taip, kad pirmosios (40) yra didžiausio pailgėjimo padėtyje, pastarajam (30) esant tolimojoje galinės eigos padėtyje, minėtos elastinės atoveikio priemonės (40) yra įtaisytos tarp minėtos atramos (50) cilindrinės dalies (52) bei minėto stūmoklinio elemento (30) ir kad minėta pirmoji vamzdinė apkaba (12) turi galinę dalį (16), funkciškai sujungtą su minėta atrama (50), bent vienas pirmasis antifrikcinis elementas (110) yra įtaisytas tarp minėtos atramos (50) ir minėtos pirmosios vamzdinės apkabos (12) galinės dalies (16) papildomai yra naudojamas trinčiai dėl elastinių atoveikio priemonių (40) poveikio minėtai atramai (50) mažinti.

2. Mechanizmas pagal 1 punktą, kur minėta įvorė (80) ir minėta antroji vamzdinė apkaba (13) yra bendraašiai ir atjungimai sujungti ir kartu slankioja išilgai minėtos ašies (X) taip, kad naudotojas galėtų pakeldamas atjungti uždaromąjį elementą (D) nuo nejudamosios atraminės konstrukcijos (S).

3. Mechanizmas pagal 1 arba 2 punktą, minėtos atramos (50) minėtos vamzdinės dalies (52) vidinis skersmuo (Di') iš esmės sutampa su minėtos pailgintojo cilindrinio elemento (60) skersmeniu (D"') ir išorinis skersmuo (De') yra mažesnis arba iš esmės lygus minėtos įvorės (80) vidiniam skersmeniui (Di"), antrosios vamzdinės apkabos (13) vidinės pusės sienelė (13') yra nukreipta į minėtos įvorės (80) išorinę sienelę (82), kai įvorė yra prijungta prie pirmosios vamzdinės apkabos (12), minėtos pirmosios vamzdinės apkabos (12) galinė dalis (16) turi iš esmės apvalią atšaką (18), kurios išorinis skersmuo (De) yra didesnis arba iš esmės sutampa su minėtos atramos (50) minėtos vamzdinės dalies (52) išoriniu skersmeniu (De'), o vidinis skersmuo (Di) iš esmės sutampa su minėtos atramos (50) vamzdinės dalies (52) vidiniu skersmeniu (Di'), minėta iš esmės apvali atšaka (18) apima pirmąjį galinį paviršių (21), apibrėžiantį minėtos darbinės kameros (20) galinę sienelę, antrąjį galinį paviršių (19'), priešingą minėtam pirmajam galiniam paviršiui (21), nukreiptą į minėtos atramos (50) minėtos vamzdinės dalies (52) apatinę dalį (54) atramai laikyti, vidinį šoninį paviršių (19"), nukreiptą į minėto pailgintojo cilindrinio elemento (60) šoninę sienelę (63) ir išorinį šoninį paviršių (19"'), nukreiptą į minėtos įvorės (80) vidinę šoninę sienelę (83).

4. Mechanizmas pagal 1, 2 arba 3 punktą, papildomai apimantis bent vieną stabdymo sraigtą (90) arti mechanizmo viršutinio arba apatinio galo (2, 3), kur minėtas bent vienas stabdymo sraigtas (90) apima pirmąjį galą (91), galintį atrankiai sąveikauti su minėto pailgintojo cilindrinio elemento (60) minėta antrąja galine dalimi (62), ir antrąjį galą (92), kurį vartotojas gali naudoti iš išorės eigai išilgai minėtos ašies (X) reguliuoti, minėtas bent vienas stabdymo sraigtas (90) yra įstatytas į minėtą atramą (50) ties minėta galine dalimi (51) slankioti išilgai minėtos ašies (X) tarp rimties padėties, esančios toli nuo pailgintojo cilindrinio elemento (60) antrosios galinės dalies galo (62), ir darbinės padėties liesdamasis su juo.

5. Mechanizmas pagal vieną ar daugiau pirmesnių punktų, kur pirmoji ir (arba) antroji vamzdinė apkaba (12, 13) yra pagaminta iš polimerinės medžiagos, minėta atrama (50) ir (arba) minėta įvorė (80) yra pagaminta iš metalo.

6. Mechanizmas pagal vieną ar daugiau pirmesnių punktų, kur minėta įvorė (80) turi centrinę angą (86) ties viršutine dalimi (87), minėta įvorė (80) ir minėta atrama (50) abi yra sukonfigūruotos taip, kad pastarosios (50) galinė dalis (51) praeina per pirmosios (80) centrinę angą (86), minėta atrama (50) yra minėtos įvorės (80) ir įtaisyta tarp minėto bent vieno antifrikcinio elemento (110) minėtos tos pačios įvorės (80) centrinės dalies (87), bent vienas antrasis antifrikcinis elementas (112) yra įtaisytas minėtos įvorės (80) išorėje tarp minėtos jos (80) viršutinės dalies (87) ir minėtos antrosios vamzdinės apkabos (13) taip, kad uždaromasis elementas (D) neapkrautų minėtos atramos (50).

7. Mechanizmas pagal vieną ar daugiau pirmesnių punktų, kur minėta įvorė (80) ir antroji vamzdinė apkaba (13) yra abipusiai erdvėje susietos taip, kad pastaroji (13) lieka erdvėje atskirta nuo minėtos pirmosios vamzdinės apkabos (12).

8. Mechanizmas pagal vieną ar daugiau pirmesnių punktų, kur minėtas fiksuotasis elementas (10) apima minėtą pirmąją vamzdinę apkabą (12), minėtas judamasis elementas (11) apima minėtą antrąją vamzdinę apkabą (13), pastaroji yra uždėta ant minėtos pirmosios vamzdinės apkabos (12), minėta pirmosios vamzdinės apkabos (12) galinė dalis (16) atlieka sukamojo minėtos atramos (50) laikiklio funkciją, minėta įvorė (80) apibrėžia antrosios vamzdinės apkabos (13) sukimosi ašį.

9. Mechanizmas pagal vieną ar daugiau pirmesnių punktų, kur minėta darbinė kamera (20) apima minėtą darbinį skystį, yra bent vienas sandarinamasis elementas (22) minėto darbinio skysčio nuotėkiui iš minėtos darbinės kameros (20) sustabdyti, minėtas stūmoklinis elementas (30) yra pritaikytas minėtai darbinei kamerai (20) padalyti į bent vieną pirmąjį ir antrąjį kintamo tūrio skyrių (23, 24), hidrauliškai susisiekiančius vieną su kitu ir, pageidautina, esančius greta vienas kito, minėtas stūmoklinis elementas (30) apima pralaidos angą (31) skysčių susisiekimui tarp minėto pirmojo ir minėto antrojo kintamojo tūrio skyriaus (23, 24) palaikyti ir užsklandos priemones (32), sąveikaujančias su minėta anga (31) darbiniam skysčiui praleisti tarp minėto pirmojo skyriaus (23) ir minėto antrojo skyriaus (24) uždaromajam elementui (D) atsidarant arba užsidarant ir atgaliniam srautui stabdyti atsidarant arba užsidarant minėtam uždaromajam elementui (D), hidraulinis kontūras (100) yra papildomai įrengtas minėtam darbiniam skysčiui praleisti tarp minėto pirmojo skyriaus (23) ir minėto antrojo skyriaus (24) uždaromajam elementui (D) atsidarant arba užsidarant.

10. Mechanizmas pagal pirmesnį punktą, kur minėtas stūmoklinis elementas (30) yra sandariai įstatytas į minėtą darbinę kamerą (20), minėta pirmoji vamzdinė apkaba (12) bent iš dalies apima minėtą hidraulinį kontūrą (100), pastarasis turi bent vieną pirmąją angą (101) minėtame pirmajame skyriuje (23) ir bent vieną antrąją angą (106) minėtame antrajame skyriuje (24).

11. Mechanizmas pagal vieną ar daugiau pirmesnių punktų, kur minėtas hidraulinis kontūras (100) apima trečiąją angą (102) minėtame antrajame skyriuje (24), minėtas stūmoklinis elementas (30) yra erdvėje susietas su minėto kontūro (100) minėta antrąja ir trečiąja anga (102, 106) taip, kad liktų hidrauliškai atjungtas nuo minėtos trečiosios angos (102)

per visą stūmoklinio elemento (30) eigos ilgį ir kad liktų hidrauliškai sujungtas su minėta antrąja anga (106) pirmojoje minėto eigos ilgio dalyje bei liktų nuo jos hidrauliškai atjungtas antrojoje minėtos eigos ilgio dalyje.

12. Mechanizmas pagal vieną ar daugiau pirmesnių punktų, kur minėtų griovelių (70', 70") sraigtinės dalys (71', 71") yra atitinkamai dešininės ir kairinės, minėtos kumštelių išpjovos (81) apima bent vieną pirmąją dalį (84'), besitęsiančią iš esmės lygiagrečiai minėtai ašiai (X) arba šiek tiek pasvirą jos (X) atžvilgiu ir šis pokrypis yra priešingas minėtos atramos (50) minėtų griovelių (70', 70") pokrypiui, minėtos kumštelių išpjovos (81) papildomai apima bent vieną antrąją dalį (84"), besitęsiančią iš esmės statmenai jai, kur, kaiščiui (73) slenkant išilgai minėtų kumštelių išpjovų (81) bent vienos pirmosios dalies (84'), minėtos elastinės atoveikio priemonės (40) juda tarp didžiausio bei mažiausio pailgėjimo padėties ir kur kaiščiui (73) slenkant išilgai minėtų kumštelių išpjovų (81), bent vienos antrosios dalies (84") minėtos elastinės atoveikio priemonės (40) lieka minėtoje mažiausio pailgėjimo padėtyje.

13. Mechanizmas pagal pirmesnį punktą, kur minėtos elastinės priemonės (40) yra preliminariai įtemptos mechanizmo uždarymo arba atidarymo jėgai padidinti ir (arba) jo dydžiui sumažinti.

14. Mechanizmas pagal 12 arba 13 punktą, kur minėtų kumštelių išpjovų (81) minėta bent viena pirmoji ir bent viena antroji dalis (84', 84") yra abipusiai nuoseklios.

15. Mechanizmas pagal 12, 13 arba 14 punktą, kur bent viena pirmoji dalis (84') tęsiasi iš esmės lygiagrečiai minėtai ašiai (X), kur, kaiščiui (73) slenkant išilgai minėtų kumštelių išpjovų (81) bent vienos pirmosios dalies (84'), minėtas stūmoklinis elementas (30) slenka tarp minėtos pirmosios bei antrosios galinės eigos padėties, likdamas užblokuotas nuo sukimosi ir kur, kaiščiui (73) slenkant išilgai minėtų kumštelių išpjovų (81) bent vienos antrosios dalies (84"), minėtas stūmoklinis elementas (30) sukasi kartu su minėta atrama (50) aplink minėtą ašį (X), likdamas minėtoje pirmojoje arba antrojoje galinėje eigos padėtyje.

---

(51) Int.Cl. ***F21K 99/00*** (2016.01)
F21Y 111/00 (2016.01)

(11) **2553314**

(96) 11713180.5

(96) 2011-03-25

(97) 2013-02-06

(97) 2016-02-24

(86) PCT/EP2011/001510

(86) 2011-03-25

(87) WO 2011/124331

(87) 2011-10-13

(30) 102010013286, 2010-03-29, DE

(72) PEIL, Michael, DE
OSWALD, Florin, DE
MAIWEG, Harald, DE

(73) Heraeus Noblelight GmbH, 63450 Hanau, DE

(74) Stanislava TELEIŠIENĖ, 31, UAB „Brainera", Savanorių pr. 217, LT-02300 Vilnius, LT

(54) Šviesos diodų (LED) lempa tolygiam tuščiavidurių elementų apšvietimui
Apibrėžties punktai: 13, brėžiniai: 12.

(57) 1. Apšvietimo įrenginys (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93'") tolygiam išlenktų, neplokščių arba daugiasienių paviršių apšvietimui, turintis daugybę plokščių, ant plokštės sumontuotų kristalų LED modulių (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81^1-81^8), kurie išdėstyti bent taip, kad poros būtų viena greta kitos, kiekvienas ant plokštės sumontuotų kristalų LED modulis (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81^1-81^8) turi daugybę šviesą spinduliuojančių LED (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72), b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad mažiausiai viena pora iš kiekvieno gretimo ant plokštės sumontuotų kristalų LED modulio (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81^1- 81^8) sumontuota kampu, didesniu kaip 0° jų paviršiaus normalės atžvilgiu, ant plokštės sumontuotų kristalų LED moduliai (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61",71-71", 81^1-81^8) sudaro išilgai besitęsiantį apšvietimo įrenginį (40-40", 45-45", 50-50", 60, 80, 93-93'"), kuris turi netaisyklingos arba taisyklingos daugiakampio formos skerspjūvį bent savo išilgine kryptimi besitęsiančiose dalyse, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad ant plokštės sumontuotų kristalų LED modulio (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81^1-81^8) komplektavimas šviesos diodais (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) kinta priklausomai nuo vietos, ypač jų mažėja arba didėja link sumontuotų ant plokštės kristalų LED modulio (1, 11, 11', 21, 31, 41-41", 46-46", 51-51", 61-61", 71-71", 81^1-81^8) krašto.

2. Apšvietimo įrenginys (40-40», 45-45», 50-50», 60, 80, 93-93'") pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad apšvietimo įrenginio (40-40», 45-45», 50-50», 60, 80, 93-93'") forma yra lanksti.

3. Apšvietimo įrenginys (40-40», 45-45», 50-50», 60, 80, 93-93'") pagal 1 arba 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad ant plokštės sumontuotų kristalų LED modulių (1, 11, 11', 21, 31, 41-41», 46-46», 51-51», 61-61», 71-71», 81^1-81^8) šviesos diodai (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) išdėstyti taip, kad būtų nukreipti į išorę arba į apšvietimo įrenginio (40-40“, 45-45“, 50-50“, 60, 80, 93-93'") tuščiavidurę ertmę.

4. Apšvietimo įrenginys (40-40“, 45-45“, 50-50“, 60, 80, 93-93'") pagal bet kurį iš 1-3 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad mažiausiai du ant plokštės sumontuotų kristalų LED moduliai (1, 11, 11', 21, 31, 41-41“, 46-46“, 51-51“, 61-61“, 71-71“, 81^1-81^8) sujungti su bendrai naudojamu šilumos rinktuvu (65, 82), ypač kuris gali būti prijungtas arba yra prijungtas prie aušinimo ciklo.

5. Apšvietimo įrenginys (40-40“, 45-45“, 50-50“, 60, 80, 93-93'") pagal bet kurį iš 1-4 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad šviesos diodai (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) yra sumontuoti ant plokštėje sumontuotų kristalų LED modulio (1, 11, 11', 21, 31, 41-41“, 46-46“, 51-51“, 61-61“, 71-71“, 81^1-81^8) statmenai ant plokštės sumontuotų kristalų LED modulio (1, 11, 11', 21, 31, 41-41“, 46-46“, 51-51“, 61-61“, 71-71“, 81^1-81^8) kraštui.

6. Apšvietimo įrenginys (40-40“, 45-45“, 50-50“, 60, 80, 93-93'") pagal bet kurį iš 1-5 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad elektros energija į ant plokštės sumontuotų kristalų LED modulio (1, 11, 11“, 21, 31, 41-41“, 46-46“, 51-51“, 61-61“, 71-71“, 81^1-81^8) atskirus šviesos diodus (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) arba šviesos diodų (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) grupes gali būti tiekiama atskirai viena nuo kitos.

7. Apšvietimo įrenginys (40-40“, 45-45“, 50-50“, 60, 80, 93-93'") pagal 6 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad ant plokštės sumontuotų kristalų LED modulio (1, 11, 11“, 21, 31, 41-41“, 46-46“, 51-51“, 61-61“, 71-71“, 81^1-81^8) šviesos diodų (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) grupės, į kurias elektros energija gali būti tiekiama atskirai viena nuo kitos, išdėstytos eilėmis, ant plokštės sumontuotų kristalų LED modulio (1, 11, 11“, 21, 31, 41-41“, 46-46“, 51-51“, 61-61“, 71-71“, 81^1-81^8) pusiniuose paviršiuose (75, 75') arba kvadrantuose (74-74“').

8. Apšvietimo įrenginys (40-40“, 45-45“, 50-50“, 60, 80, 93-93'") pagal bet kurį iš 1-7 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad ant plokštės sumontuotų kristalų LED modulio (1, 11, 11“, 21, 31, 41-41“, 46-46“, 51-51“, 61-61“, 71-71“, 81^1-81^8) šviesos diodai (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) dengti bent dalyse optiškai skaidria arba šviesą išsklaidančia medžiaga (25) arba įlydi į optiškai skaidrią arba šviesai sklaidžią medžiagą (35).

9. Apšvietimo įrenginys (40-40“, 45-45“, 50-50“, 60, 80, 93-93'") pagal 8 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad dengiamosios medžiagos arba liejimo medžiagos įdėklo (36, 36') šoninės sienelės (26, 26') yra optiškai skaidrios ir (arba) jų aukštis tęsiasi virš šviesos diodų (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72) paviršiaus ir neviršija atstumo tarp gretimų šviesos diodų (4, 4', 14, 14', 24, 34, 64, 72).

10. Apšvietimo įrenginys (40-40“, 45-45“, 50-50“, 60, 80, 93-93'") pagal bet kurį iš 1-9 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad ant plokštės sumontuotų kristalų LED modulis (1, 11, 11“, 21, 31, 41-41“, 46-46“, 51-51“, 61-61“, 71-71“, 81^1-81^8) turi mažiausiai vieną vaizdą formuojantį ir (arba) vaizdo neformuojantį pirminį optinį ir (arba) antrinį optinį elementą, ypač mažiausiai vieną optinį elementą iš reflektorių, lęšių ir Fresnelio lęšių grupės.

11. Apšvietimo įrenginys (40-40“, 45-45“, 50-50“, 60, 80, 93-93'") pagal bet kurį iš 1-10 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad ant plokštės sumontuotų kristalų LED modulis (1, 11, 11“, 21, 31, 41-41“, 46-46“, 51-51“, 61-61“, 71-71“, 81^1-81^8) turi mažiausiai vieną jutiklį, ypač mažiausiai vieną jutiklį iš fotojutiklių, temperatūros daviklių, slėgio jutiklių, judesio daviklių, įtampos jutiklių, srovės jutiklių ir magnetinio lauko jutiklių grupės, nustatančios apšvietimo įrenginio (40-40“, 45-45“, 50-50“, 60, 80, 93-93'") veikimo būseną.

12. Apšvietimo blokas (90), turintis kontrolės įtaisą (91), ryšio liniją (92) ir mažiausiai vieną apšvietimo įrenginį (40-40“, 45-45“, 50-50“, 60, 80, 93-93'") pagal bet kurį iš 1-11 punktų.

13. Apšvietimo įrenginio (40-40“, 45-45“, 50-50“, 60, 80, 93-93'") pagal bet kurį iš 1-11 punktų panaudojimas tuščiavidurių ertmių apšvietimui, kurių bent dalis yra išgaubta, ypač džiovinant, kietinant ir (arba) apšviečiant, ypač žarnos dangos, lėtos reakcijos lakus, klijus ir dervas.

(51) Int.Cl. ***F24F 13/22*** (2006.01)
E04B 1/70 (2006.01)

(11) **2823235**

(96) 13718416.4

(96) 2013-03-08

(97) 2015-01-14

(97) 2015-12-30

(86) PCT/NO2013/050048

(86) 2013-03-08

(87) WO 2013/133721

(87) 2013-09-12

(30) 20120286, 2012-03-09, NO

(72) HARILA, Gunnvald, NO

(73) Gunnvald Harila Limited, 9291 Troms, NO

(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT

(54) Ventiliacinis montažas

Apibrėžties punktai: 5, brėžiniai: 14.

(57) 1. Ventiliacinis montažas, skirtas drėgmės pakenkimo prevencijai už drėgnumo barjero (7), ypatingai perėjime tarp grindų (4, 5) ir sienos (0) su plokšte (8) už minėto drėgnumo barjero (7), kur minėtas ventiliacinis montažas apima šiuos požymius:

- tuščiavidurį ištęstinį profiliuotą liejinį (2) montavimui išilgai palangės (10) išilgai drėgnos ūkinės veiklos kambario sienos (0) ties minėtomis grindimis (4, 5),

- kuriame minėtas drėgnumo barjeras (7) dengia bent plačią perėjimo dalį tarp minėtų grindų (4, 5) ir drėgnos ūkinės veiklos kambario sienos (0),

- ventiliacijos movą (15) orui iš profiliuoto liejinio (2) daugiausia ventiliacijos vamzdžiu (14) į ventiliacijos mentę (15) į išėjimo angą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad

- kuriame minėtas profilinis liejinys (2) yra sumontuotas su išilginiu petimi (21), sumontuotu tam, kad paremtų minėtos plokštės (8) apatinę briauną, - kur minėtame profiliniame liejinyje (2) yra sumontuotas su angomis (1) išilginiame ventiliacijos vamzdelyje (22), suformuotas po minėtu išilginiu petimi (21), virš minėtų grindų (4, 5) ir už minėto drėgnumo barjero (7), kuriame minėtos angos (1) turi jų įėjimą iš minėto išilginio ventiliacijos vamzdelio (22).

2. Ventiliacijos montažas pagal 1 punktą, kuriame drėgnumo barjeras (7) apima audinio apdengimą bent daliai minėto perėjimo tarp minėtų grindų (4, 5) ir minėtos higieninės patalpos sienelės (0).

3. Ventiliacijos montažas pagal 1 punktą, kuriame minėtas drėgnumo barjeras (7) yra sumontuotas plačios juostos arba audinio, kuris dengia bent dalį minėto perėjimo tarp minėtų grindų (4, 5) ir higieninės patalpos sienelės (0), išorėje.

4. Ventiliacijos montažas pagal vieną iš ankstesnių punktų, kuriame minėta ventiliacijos mova (15) apima kaminą (151) su prailgintu įėjimu iš prailginto atitinkamo plyšio išilgai minėto profilinio liejinio (2) viršutinės briaunos, ir su išėjimu į ventiliacijos vamzdį (14), kuris yra vamzdiškas.

5. Ventiliacijos montažas pagal vieną iš ankstesnių punktų, kuriame oro padavimo sujungimas (16) apima kaminą (161) su pailgintu išėjimu iš pailginto atitinkamo plyšio išilgai minėto profilinio liejinio (2) antrosios dalies viršutinio krašto ir su įėjimu iš tiekimo angos.

---

(51) Int.Cl. ***F28F 9/02*** (2006.01)
F25J 5/00 (2006.01)
F28D 7/02 (2006.01)

(11) **2818821**

(96) 13003276.6

(96) 2013-06-27

(97) 2014-12-31

(97) 2016-02-03

(72) Hammerdinger, Markus, DE
Kerber, Christiane, Dr., DE
Reithmeier, Helmut, DE
Spreemann, Jürgen, DE
Steinbauer, Manfred, DE
(73) Linde Aktiengesellschaft, 80331 München, DE
(74) Jelena GERASIMOVIČ, 52, IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius, LT

(54) Spiralinis šilumokaitis su padavimu per centrinį vamzdį
Apibrėžties punktai: 11, brėžiniai: 2.

(57) 1. Šilumokaitis, turintis:

- korpusą, besitęsiantį palei išilginę ašį (L) ir supantį šilumokaičio (1) korpusinę ertmę (M),
- vamzdžių komplektą (R), kuris yra išdėstytas korpusinėje ertmėje (M) ir apima daugybę vamzdžių (70), kurie yra susukti spirale apie centrinį vamzdį (10), kuris tęsiasi palei išilginę ašį (L), ir
- bent vieną iki skirstytuvo esantį konteinerį (50), kuris yra įtaisytas korpusinėje ertmėje (M) tam, kad gautų ir degazuotų skysčio-dujų mišinį (F'), kuris yra skirtas tam, kad tiektų paskirstymo priemonėms (60) skystį (F), degazuotą bent viename iki skirstytuvo esančiame konteineryje (50), kur paskirstymo priemonės (60) yra suprojektuotos pripildyti vamzdžių komplektą (R) skysčiu (F),

b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad

šilumokaičio (1) viršutinėje dalyje (2) korpusas (20) apima įleidimą (30), kuris yra iš esmės vienoje linijoje su išilgine ašimi (L), iš esmės turi įleidimo vamzdžio (30) formą, kuri yra hidrauliškai sujungta su centriniu vamzdžiu (10), ir tuo, kad centrinis vamzdis (10) turi bent vieną šoninę angą (100), kuri atsidaro į bent vieną iki skirstytuvo esantį konteinerį (50), tokiu būdu, kad skysčio-dujų mišinys (F') gali būti paduodamas per minėtą įleidimą (30) į centrinį vamzdį (10) ir, per centrinio vamzdžio (10) bent vieną šoninę angą (100), į bent vieną iki skirstytuvo esantį konteinerį (50).

2. Šilumokaitis pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad centrinis vamzdis (10) yra uždarytas galine dalimi (11) ant vamzdžio plokštės (40), kuri numatyta šilumokaičio (1) viršutinėje dalyje (2), ir kuri iš esmės tęsiasi statmenai išilginei ašiai (L).

3. Šilumokaitis pagal 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad korpusas (20) išplatėja nuo vamzdžio plokštės (40) žiedinio lanko krašto (41).

4. Šilumokaitis pagal bet kurį iš 2 ir 3 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad įleidimo vamzdis (30) yra uždarytas galine dalimi (31) ant vamzdžio plokštės (40), vamzdžio plokštės (40) pusėje, kuri yra nukreipta nuo centrinio vamzdžio (10).

5. Šilumokaitis pagal vieną iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad centrinis vamzdis (10) turi cilindrinę sienelę (W), kurioje yra suformuotas bent vienas įleidimas (100).

6. Šilumokaitis pagal 5 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad bent vienas iki skirstytuvo esantis konteineris (50), išplatėja nuo minėtos sienelės (W) ir tęsiasi iš esmės ligi korpuso (20) vidinės pusės (20a).

7. Šilumokaitis pagal vieną iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad bent vienas iki skirstytuvo esantis konteineris (50) turi viršutinę briauną (53) už kurios skysčio-dujų mišinio (F') iš esmės dujinė fazė (G) korpuso ertmėje (M) gali tekėti žemyn, kur bent vieno iki skirstytuvo esančio konteinerio (50) viršutinė briauna (53) yra išdėstyta virš centrinio vamzdžio (10) bent vienos šoninės angos (100) viršutinės briaunos (101).

8. Šilumokaitis pagal vieną iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad bent vienas iki skirstytuvo esantis konteineris (50), skirtas paduoti paskirstymo priemones (60) su degazuotu skysčiu (F), yra hidrauliškai sujungtas su minėtomis paskirstymo priemonėmis (60) per bent vieną išleidimo vamzdį (61).

9. Šilumokaitis pagal vieną iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad bent viename iki skirstytuvo esančiame konteineryje (50) yra įtaisyta išdėstyta virš bent vienos šoninės angos (100), perforuota plokštė (102), kuri tęsiasi iš esmės per visą iki skirstytuvo esančio konteinerio skersinį pjūvį taip, kad skysčio-dujų mišinio (F') dujinė fazė (G) teka aukštyn per minėtą perforuotą plokštę (102) į bent vieną iki skirstytuvo esantį konteinerį (50), kur toji perforuota plokštė (102) yra hidrauliškai sujungta su paskirstymo priemonėmis (60), visų pirma per bent vieną išleidimo vamzdį (62) tokiu būdu, kad skystis (F), kuris tekėjo kartu su dujine faze (G), ir kuris krenta ant perforuotos plokštės (102), gali būti nukreiptas į paskirstymo priemones (60), kur bent vienas perforuotos plokštės (102) išleidimo vamzdis (62) atsidaro į bent vieną iki skirstytuvo esantį konteinerį (50) ir atitinka bent vieno iki skirstytuvo esančio

konteinerio (50) bent vieną pagrindo (52) išleidimo vamzdį (61) tokiu būdu, kad skystis (F) gali tekėti į paskirstymo priemones (60) iš perforuotos plokštės (102) per du išleidimo vamzdžius (61, 62).

10. Šilumokaitis pagal vieną iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad centrinis vamzdis (10) apačioje, žemiau negu bent viena iš angų (100), yra uždarytas pagrindu (12), kuris yra iš esmės išdėstytas palei išilginę ašį (L), bent vieno iki skirstytuvo esančio konteinerio pagrindo (52) aukštyje.

11. Šilumokaitis pagal vieną iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad bent vienas iki skirstytuvo esantis konteineris (50) yra išdėstytas šilumokaičio (1) viršutinėje dalyje (2).

---

(51) Int.Cl. ***G01F 1/69*** (2006.01)
G01F 1/696 (2006.01)
G01F 1/698 (2006.01)
(11) **2299855**
(96) 09776644.8
(96) 2009-05-25
(97) 2011-03-30
(97) 2016-03-16
(86) PCT/EP2009/003668
(86) 2009-05-25
(87) WO 2010/003480
(87) 2010-01-14
(30) 08252328, 2008-07-08, EP
(72) FLICK, Jean-Marc, CH
(73) Philip Morris Products S.A., 2000 Neuchātel, CH
(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
(54) Srauto daviklio sistema

Apibrėžties punktai: 13, brėžiniai: 7.

(57) 1. Srauto daviklio sistema (101), skirta fluidų srautui, nurodančiam dūmus, pajusti aerozolio generavimo sistemoje, daviklio sistema yra sumontuota veikti pirmuoju režimu, kuriame nesitikima jokių dūmų arba neaptinkama jokių dūmų, ir antruoju režimu, kuriame dūmų tikimasi arba dūmai aptinkami, ir apimanti:

sensorinę grandinę (103), apimančią sensorinį rezistorių (R_s) ir įtampos išvestį, sensorinis rezistorius (R_s) sumontuotas tam, kad aptiktų nurodantį dūmus fluidų srautą pagal varžos kaitą, sensorinė grandinė (103) yra sumontuota taip, kad sensorinio rezistoriaus (R_s) varžos kaita lemtų įtampos išvesties pokyčius; ir

signalų generatorių (109, 111), sumontuotą pulsiniam paleidimo signalui S_1 į sensorinę grandinę (103) perduoti, kad būtų valdoma sensorinė grandinė (103) – sensorinė grandinė (103) valdoma signalu $S_{1,}$ kai pulsinis paleidimo signalas S_1 stiprus, ir nevaldoma, kai pulsinis paleidimo signalas S_1 silpnas; pulsinis paleidimo signalas S_1 yra pirmo dažnio f_1 pirmajame režime ir antro dažnio f_2, didesnio už pirmą dažnį f_1, antrajame režime ir signalo generatorius konfigūruotas taip, kad perjungtų iš pirmojo režimo į antrąjį režimą, kai tikimasi aptikti dūmų arba jie aptinkami sensorine grandine (103).

2. Srauto daviklio sistema pagal 1 punktą, dar apimanti srovės šaltinį (105), sumontuotą tiekti iš anksto nustatytos reikšmės srovę per sensorinę grandinę (103), kurioje pulsinis paleidimo signalas S_1 yra perduodamas į srovės šaltinį (105).

3. Srauto daviklio sistema pagal 1 arba 2 punktą, dar apimanti diferencinį stiprintuvą (107), sumontuotą sensorinės grandinės (103) įtampos išvesčiai sustiprinti.

4. Srauto daviklio sistema pagal 3 punktą, kurioje diferencinio stiprintuvo išvestis yra proporcinga sensorinės grandinės (103) įtampos išvesčiai sensorinės grandinės (103) įtampos išvesties reikšmių diapazone, ir kuri suveikia, kai sensorinės grandinės (103) įtampos išvestis yra mažesnė už arba didesnė už diapazoną.

5. Srauto daviklio sistema pagal bet kurį ankstesnį punktą dar apima priemonę, skirtą daviklio sistemos jautrumui reguliuoti, priemonė, skirta daviklio sistemos jautrumui reguliuoti apima vieną arba kelis iš šių įrenginių:

kintamasis rezistorius sensorinėje grandinėje;

savireguliacinė kompensacinė grandinė ir

signalo generatorius, skirtas pulsiniam kalibravimo signalui S_C perduoti į sensorinę grandinę (103).

6. Srauto daviklio sistema pagal bet kurį ankstesnį punktą, kurioje sensorinė grandinė (103) apima Vitstono tiltelį (303), turintį pirmąją atramą ir antrąją atramą, ir kurioje įtampos išvestis yra skirtumas tarp įtampos per pirmąjį kontaktą ir įtampos per antrąjį kontaktą.

7. Aerozolio generavimo sistema aerozolį formuojančiam substratui gauti, susidedanti iš srauto daviklio sistemos (101) fluidų srautui pajusti aerozolio generavimo sistemoje, nurodančioje dūmus; srauto daviklio sistema atitinka bet kurį ankstesnį punktą.

8. Aerozolio generavimo sistema pagal 7 punktą, dar apimanti:

bent vieną kaitinimo elementą substratui kaitinti tam, kad formuotųsi aerozolis;

kurioje srauto daviklio sistema yra sumontuota kaitinimo elementui aktyvinti, kai srauto daviklio sistema (101) pajunta fluidų srautą, nurodantį dūmus.

9. Būdas valdyti srauto daviklio sistemą (101), kad pajustų fluidų srautą, nurodantį dūmus aerozolio generavimo sistemoje, daviklio sistema (101) yra sumontuota veikti pirmuoju režimu, kuriame nesitikima jokių dūmų arba neaptinkama jokių dūmų, ir antruoju režimu, kuriame tikimasi dūmų arba dūmai aptinkami; būdas apima šiuos veiksmus:

pulsinio paleidimo signalo S_1 perdavimą į sensorinę grandinę (103) tam, kad valdytų sensorinę grandinę (103) – sensorinė grandinė (103) valdoma signalu $S_{1,}$ kai pulsinis paleidimo signalas S_1 stiprus, ir nevaldoma, kai pulsinis paleidimo signalas S_1 silpnas; sensorinė grandinė (103) apima sensorinį rezistorių (R_s) ir įtampos išvestį, sensorinis rezistorius (R_s) yra sumontuotas tam, kad pajustų nurodantį dūmus fluidų srautą pagal sensorinio rezistoriaus (R_s) varžos kaitą, sensorinė grandinė (103) sumontuota taip, kad varžos pasikeitimas sensoriniame rezistoriuje lemtų įtampos išvesties pokyčius; ir

sensorinės sistemos (101) perjungimą tarp pirmojo ir antrojo režimų, kur pulsinis paleidimo signalas S_1 yra pirmo dažnio f_1 pirmajame režime ir antro dažnio f_2, didesnio už pirmą dažnį f_1, antrajame režime, kai tikimasi dūmų arba jie aptinkami per sensorinę grandinę.

10. Būdas pagal 9 punktą, pagal kurį sensorinės sistemos (101) perjungimo veiksmas tarp pirmojo ir antrojo veikimo režimų apima sensorinės sistemos perjungimą iš pirmojo režimo, kai pulsinis paleidimo signalas S_1 yra pirmo dažnio $f_{1,}$ į antrąjį režimą, kur pulsinis paleidimo signalas S_1 yra antro dažnio f_2, kai tikimasi dūmų, besiremiant vartotojo įpročiais.

11. Būdas pagal 9 arba 10 punktą, dar apimantis signalo S_2 perdavimo į kitus komponentus aerozolio generavimo sistemoje veiksmą; signalas S_2 yra stiprus, kai sensorinės grandinės (103) įtampos išvestis nurodo, kad aptikta dūmų, ir signalas S_2 yra silpnas, kai sensorinės grandinės (103) įtampos išvestis nurodo, kad dūmų neaptikta.

12. Būdas pagal bet kurį iš 9–11 punktų, dar apimantis daviklio sistemos jautrumo reguliavimo veiksmą, susidedantis iš vieno arba kelių toliau nurodytų veiksmų:

kintamojo rezistoriaus varžos sensorinėje grandinėje periodinis valdymas;

savireguliacinės kompensacinės grandinės įrengimas ir

pulsinio kalibravimo signalo S_C perdavimas į sensorinę grandinę (103).

13. Būdas pagal bet kurį iš 9–12 punktų, dar apimantis aerozolio tiekimo vartotojui veiksmą priklausomai nuo dūmų, kuriuos aptiko sensorinė grandinė (103), charakteristikų.

---

(51) Int.Cl. ***G01N 33/574*** (2006.01)
B01L 3/00 (2006.01)
G01N 15/02 (2006.01)
C12Q 1/24 (2006.01)
G01N 33/49 (2006.01)
C12N 5/09 (2006.01)

(11) **2790020**

(96) 14159725.2

(96) 2014-03-14

(97) 2014-10-15

(97) 2016-03-09

(30) 201361794468 P, 2013-03-15, US
201314077811, 2013-11-12, US
(72) Hvichia, Georgi, US
(73) ANGLE North America, Inc., Philadelphia, PA 19104-5504, US
(74) Liucija JANICKAITĖ, 29, Inpatra UAB, Šeškinės g. 59-53, LT-07162 Vilnius, LT
(54) Dalelių atskyrimo būdai, naudojant įrenginį su skiriančiu pagal dydį elementu, turinčiu pailgą priekinį kraštą
Apibrėžties punktai: 27, brėžiniai: 8.

(57) 1. Įrenginys, skirtas atskirti didesnes ir mažesnes daleles, įrenginys sudarytas iš:
korpuso (2) ir
dangčio (4), kurie apibrėžia tuštumą (50) tarp savęs, tuštuma (50), talpina atskyrimo elementą (1), kuris atskiria tuštumos (50) įleidimo sritį (52) ir išleidimo sritį (58), atskyrimo elementas (1) kartu su tuštumos (50) paviršiumi apibrėžia kanalą, kuris sklandžiai sujungia įleidimo ir išleidimo sritis per atskyrimo dalį,
kanalas turi
bendrą plotį atskyrimo dalyje
ir aukštį, apibrėžtą atstumu tarp atskyrimo elemento (1) ir tuštumos (50) paviršiaus,
bent vienas korpusas (2), dangtis (4) ir atskyrimo elementas (1), vykdantis viduje patalpintą atskyrimo etapą ir turintį priekinį kraštą, besitęsiantį išilgai skiriančiosios kanalo dalies, kuria kanalas padalintas į einančią dalį priekinio krašto įleidimo pusėje ir lakštinę išeinančiąją dalį priekinio krašto išleidimo pusėje,
einančioji dalis yra pakankamo aukščio, kad palengvintų praėjimą per jį tiek didesnių, tiek ir mažesnių dalelių,
išeinančiosios dalies aukštis yra pakankamai didelis, kad palengvintų praėjimą per jį mažesnių dalelių, ir pakankamai mažas, kad sulaikytų didesnių dalelių praėjimą per jį, ir priekinio krašto ilgis yra ne mažiau kaip 20 kartų didesnis kaip bendras kanalo plotis atskyrimo srityje,
kur kanalo einančioji dalis regione tarp įleidimo srities (52) ir atskyrimo elemento (1) yra lakštinė,
ir kur priekinis kraštas turi banguotą formą,
kur dalelės gali būti atskirtos, praleidžiant jas per kanalą, ir dalelių regeneracija remiasi jų gebėjimu pereiti atskyrimo etapą.

2. Įrenginys pagal 1 punktą, kur išeinančios dalies aukštis sulaiko praėjimą per jį cirkuliuojančių naviko ląstelių ir palengvina žmogaus raudonųjų kraujo ląstelių praėjimą per jį.

3. Įrenginys pagal 2 punktą, kur cirkuliuojančios naviko ląstelės yra išskirtos iš standžiojo naviko, pavyzdžiui, kiaušidžių, prostatos arba krūties vėžio auglio.

4. Įrenginys pagal bet kurį iš 1-3 punktų, kur išeinančios dalies aukštis sulaiko praėjimą bent vienos iš: žmogaus embriono ląstelių; žmogaus embriono į kamienines panašių ląstelių; cirkuliuojančių endotelio ląstelių ir kardialinės kilmės išplėstų cirkuliuojančių endotelio ląstelių; ir palengvina žmogaus raudonųjų kraujo kūnelių praėjimą.

5. Įrenginys pagal bet kurį iš 1-4 punktų, kur bent vienas iš korpuso (2), dangčio (4) ir atskyrimo elemento (1) turi jame išdėstytą ir per visą kanalą atskyrimo laiptelio įleidimo pusėje besitęsiantį fokusavimo laiptelį, kanalas fokusavimo laiptelio įleidimo pusėje turi didesnį aukštį kaip jo išleidimo pusėje; pasirinktinai, kur fokusavimo laiptelis tęsiasi statmenai kanalui.

6. Įrenginys pagal bet kurį iš 1-5 punktų, kur bent vienas iš korpuso (2), dangčio (4) ir atskyrimo elemento (1) turi daugybę atskyrimo laiptelių, išdėstytų paeiliui atskyrimo dalyje, kiekvienas atskyrimo laiptelis:
a) turi priekinį kraštą, kuris tęsiasi per skiriamąją dalį ir yra ilgesnis kaip visas kanalo plotis skiriamojoje dalyje; ir
b) dalina kanalą į įleidimo dalį ir lakštinę išleidimo dalį lyginant su atskyrimo laiptelio priekiniu kraštu, kanalo aukštis išleidimo dalyje iškart už atskyrimo laiptelio yra mažesnis kaip kanalo aukštis įleidimo dalyje prieš pat atskyrimo laiptelį.

7. Įrenginys pagal bet kurį iš 1-6 punktų, kur priekinis kraštas turi serpentino formą.

8. Įrenginys pagal bet kurį iš 1-7 punktų, kur atskyrimo laiptelis turi įleidimo paviršių savo įleidimo pusėje, kuris yra statmenas laiptelio daliai, kuri apibrėžia išleidimo dalį.

9. Įrenginys pagal bet kurį iš 1-8 punktų, kur atskyrimo elementas (1) yra vientisas su bent vienu arba korpusu, arba dangčiu.

10. Įrenginys pagal bet kurį iš 1-9 punktų, papildomai turintis atramą kanalo aukščiui išlaikyti, atrama išdėstyta kanale tęsiasi tarp atskyrimo elemento ir tuštumos paviršiaus.

11. Įrenginys pagal bet kurį iš 1-10 punktų, kur įrenginio dydis maždaug lygus įprastam mikroskopo objektiniam stikleliui.

12. Didesnių ir mažesnių dalelių atskyrimo būdas, apimantis didesnių ir mažesnių dalelių skysčio suspensijos pateikimą ties įleidimo anga įrenginio pagal bet kurį iš 1-11 punktų, sukelia skysčio tekėjimą kanalu ir dalelių atskyrimą, paremtą jų gebėjimu skersai pereiti atskyrimo laiptelį ir, pasirinktinai, sugrąžinimą taip atskirtų didesnių dalelių, kurios negali praeiti į išleidimo sritį (58).

13. Būdas pagal 12 punktą, kur būdas papildomai apima skysčio grįžtamąją cirkuliaciją iš išleidimo srities įleidimo įrenginio kryptimi, kad grąžintų didesnes daleles.

14. Būdas pagal 12 arba 13 punktą, kur skystis yra kraujo mėginys.

15. Būdas pagal bet kurį iš 12-14 punktų, kur didesnės dalelės yra cirkuliuojančios navikinės ląstelės (CTCs), o mažesnės dalelės yra kraujo ląstelės.

16. Būdas pagal bet kurį iš 12-14 punktų, kur didesnės dalelės yra vaisiaus ląstelės, o mažesnės dalelės yra kraujo ląstelės.

17. Būdas pagal bet kurį iš 12-14 punktų, kur didesnės dalelės yra cirkuliuojančios endotelio ląstelės, o mažesnės dalelės yra kraujo ląstelės.

18. Būdas pagal 17 punktą, kur cirkuliuojančios endotelio ląstelės yra kardialinės kilmės išsiplėtusios cirkuliuojančios endotelio ląstelės.

19. Būdas pagal bet kurį iš 15-17 punktų, kur kraujo ląstelės yra raudonųjų kraujo kūnelių ląstelės.

20. Būdas kenčiančio nuo naviko subjekto naviko gydymo efektyvumui įvertinti, šis būdas apima cirkuliuojančių navikinių ląstelių (CTCs), gautų iš subjekto kraujo mėginių prieš gydymą ir po jo, izoliavimą, naudojant būdą pagal 15 arba 19 punktą, kai priklausomas nuo 15 punkto, ir lyginant bent vieną izoliuotų iš pavyzdžių CTCs charakteristiką, kur skirtumas izoliuotų iš kraujo mėginių CTCs charakteristikose yra gydymo veiksmingumo požymis;
pasirinktinai, kur charakteristika yra CTC koncentracija mėginyje.

21. **N**aviko atsiradimo subjekto stubure diagnozavimo būdas, šis būdas apima cirkuliuojančių navikinių ląstelių (CTCs) iš subjekto gauto kraujo mėginio atskyrimą, naudojant būdą pagal 15 arba 19 punktą, kai priklausomas nuo 15 punkto, kur išleidimo dalies aukštis trukdo CTC praėjimą,
tuo būdu buvimas bent vienos atskirtos cirkuliuojančios naviko ląstelės yra požymis, kad subjekte rastas navikas.

22. Būdas pagal 21 punktą, papildomai apimantis įrenginio atskyrimo laiptelio priekinio krašto įleidimo dalies nagrinėjimą dėl bent vienos atskirtos CTC buvimo nustatymo.

23. Būdas pagal 21 arba 22 punktą, papildomai apimantis vėliau einantį diagnostinio tyrimo atlikimą, kuris įvertina bent vienos atskirtos cirkuliuojančios naviko ląstelės, kuri buvo rasta, naviko ląstelės charakteristiką.

24. Būdas pagal 23 punktą, kur audinių specifinio antikūno diagnostinis tyrimas yra privalomas;
IR (ARBA), kur naviko specifinio antikūno diagnostinis tyrimas yra privalomas;
IR (ARBA), kur diagnostinis tyrimas apima nukleino rūgšties, gautos iš bent vienos atskirtos cirkuliuojančios naviko ląstelės, kuri buvo rasta, analizę;
IR (ARBA), kur diagnostinis tyrimas yra atskirtos cirkuliuojančios naviko ląstelės gebėjimo daugintis įvertinimas;
IR (ARBA), kur diagnostinis tyrimas yra atskirtos cirkuliuojančios naviko ląstelės morfologijos mikroskopinis stebėjimas.

25. Būdas pagal bet kurį iš 21- 24 punktų, kur bent viena cirkuliuojanti naviko ląstelė yra gauta iš standžiojo naviko, pavyzdžiui, kiaušidžių, prostatos arba krūties vėžio auglio.

26. Individo traumos buvimo ar atsiradimo indikacijos nustatymo būdas, paremtas cirkuliuojančių endotelio ląstelių buvimu kraujo mėginyje, šis būdas apima atskirtų cirkuliuojančių endotelio ląstelių iš kraujo mėginio, gauto iš individo, naudojant būdą pagal 17 arba 19 punktą, kai priklausomas nuo 17 punkto.

27. Indikacijos, kad pacientui neseniai buvo, šiuo metu vyksta arba neišvengiamai gresia atsiradimas miokardo infarkto, grindžiamo kardialinės kilmės išplėstų cirkuliuojančių endotelio ląstelių buvimu kraujo mėginyje, nustatymo būdas, šis būdas apima atskyrimą išplėstų cirkuliuojančių endotelio ląstelių iš kraujo mėginio, gauto iš paciento, naudojant būdą pagal 18 punktą.

---

(51) Int.Cl. ***H01H 1/54*** (2006.01)
H01H 50/44 (2006.01)
H01H 50/54 (2006.01)

(11) **2752862**

(96) 14162921.2

(96) 2012-02-09

(97) 2014-07-09

(97) 2016-01-20

(30) 931820, 2011-02-11, US

(72) Gruner, Philipp, US

(73) Hongfa Holdings U.S., Inc., Lake Forest CA 92630, US

(74) Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

(54) Dviejų pastoviųjų būsenų elektromagnetinė relė su X ašies pavaros varikliu

Apibrėžties punktai: 8, brėžiniai: 20.

(57) 1. Elektromagnetinės relės sąranka (10) srovei atrankiai praleisti per jungiklio gnybtus (11), apimanti:

ritės sąranką (12), apimančią srovę praleidžiančią ritę (16), ritės šerdį (17), aplink kurią apvyniota ritė, kur ritė apima elektromagneto varomuosius gnybtus (19), o šerdis apima priešinius gnybtus (21), priešinių nuolatinių magnetų pirmąsias ir antrąsias poras (13), kurios yra atitinkamai ir nejudamai išdėstytos greta šerdies gnybtų, kad šerdies kontaktai būtų atitinkamai perkeliami tarp magnetų porų; ir

jungiklio sąranką, apimančią pirmosios ir antrosios jungiamosios svirties (14) bei pirmosios ir antrosios kontakto spyruoklės sąranką, kur jungiamosios svirtys sujungia šerdies gnybtus, kontakto spyruoklių sąrankos sudarytos iš priešinių kontaktų porų (31), pirmąją ir antrąją spyruoklinę svirtį (15) bei pirmąjį ir antrąjį jungiklio gnybtą, kur ritė sukuria magnetinį lauką, kuris gali būti nukreipiamas per šerdį jos sukimuisi aplink sukimosi ašį perduoti per kryptinį pritraukimą prie magnetų porų pasirinktų magnetų, šerdies gnybtus jungiamosioms svirtims perjungti, kur jungiamosios svirtys perjungia kontakto spyruoklių sąrankas tarp atidarymo ir uždarymo padėties, o uždarymo padėtis yra skirta srovei praleisti per jungiklio sąranką, naudojant kontaktus ir jungiklio gnybtus,

b e s i s k i r i a n t i tuo, kad

ritės sąranka yra sukamoji, šerdies ašis sutampa su ritės ašimi (100), ritės sąranka apima ritės gaubtą (18), gaubiantį ritę ir šerdį bei turintį savo sukimosi ašį (101), statmeną ritės ašiai, visas ritės gaubtas sukasi aplink savo sukimosi ašį taip, kad ritės gaubtas ir juo apgaubta ritė bei šerdis kartu sukasi, ritės gaubtui sukantis aplink savo sukimosi ašį, o ritės ašis tuo pat metu gali sukamuoju judesiu pasislinkti tarp X formos plokštumos ribų.

2. Elektromagnetinės relės sąranka pagal 1 punktą, kur jungiamosios svirtys yra „L“ formos, kiekviena „L“ formos jungiamoji svirtis turi pirmąją ir antrąją jungiamąją dalį, antrosios jungiamosios dalys tęsiasi vienos link kitų statmenai pirmosioms jungiamosioms dalims, šerdies gnybtai yra sujungti su pirmosiomis jungiamosiomis dalimis, o atidarymo padėtyje spyruoklinės svirtys tęsiasi iš esmės lygiagrečiai antrosioms jungiamosioms dalims.

3. Elektromagnetinės relės sąranka pagal 2 punktą, kur spyruoklinės svirtys apima pirmąsias spyruoklines priemones, skirtas kontaktų vibracijai tarp kontaktų, perjungiant iš atidarymo padėties į uždarymo padėtį, slopinti.

4. Elektromagnetinės relės sąranka pagal 3 punktą, kur spyruoklinės svirtys apima antrąsias spyruoklines priemones, skirtas kontaktų vibracijos tarp kontaktų, perjungiant iš atidarymo padėties į uždarymo padėtį, slopinimui pagerinti.

5. Elektromagnetinės relės sąranka pagal 4 punktą, kur pirmosios spyruoklinės priemonės veikia greta pirmųjų jungiamųjų dalių, o antrosios spyruoklinės priemonės – greta antrųjų jungiamųjų dalių, o taip naudojant tarpu atskirtas spyruoklines priemones, atskirai amortizuojama kiekviena kontaktų pora; tarpu atskirtos amortizavimo priemonės geriau slopina amortizuojamo kontakto vibraciją tarp kontaktų, perjungiant iš atidarymo padėties į uždarymo padėtį.

6. Elektromagnetinės relės sąranka pagal 5 punktą, kur kiekviena kontaktų pora yra išdėstyta tarp tarpu atskirtų amortizavimo priemonių, o taip iš šonų priešpriešiais išdėstytos kiekvienos kontaktų poros amortizavimo priemonės geriau slopina amortizuojamo kontakto vibraciją tarp kontaktų, perjungiant iš atidarymo padėties į uždarymo padėtį.

7. Elektromagnetinės relės sąranka pagal 1 punktą, kur spyruoklinės svirtys yra lygiagrečios vienos kitoms tiek atidarymo, tiek uždarymo padėtyje ir kiekviena iš jų turi priešinius paviršius, kurie magnetinio lauko pritraukiami vienas prie kito trumpojo jungimo atveju ir magnetinio lauko pritraukti paviršiai išlaiko kontaktus uždarymo padėtyje, esant trumpajam jungimui.

8. Elektromagnetinės relės sąranka pagal 1 punktą, kur kiekvienas magnetų poros priešinis magnetas turi priešinius magnetinius paviršius, kurie yra iš esmės plokšti ir tęsiasi susikertančiose plokštumose, šerdis turi iš esmės plokščius priešinius paviršius, susiliečiantys šerdies ir magneto paviršiai yra pakreipti analogišku kampu magnetiniam srautui per šerdies ir magnetų sąlyčio paviršiaus plotą pagerinti.

---

(51) Int.Cl. ***H01S 3/23*** (2006.01)
H01S 3/06 (2006.01)
H01S 3/03 (2006.01)
H01S 3/08 (2006.01)

(11) **2835881**

(96) 14178635.0

(96) 2014-07-25

(97) 2015-02-11

(97) 2016-02-03

(30) 201314098, 2013-08-07, GB

(72) Lee, Jason Robert, GB
Fulford, Benjamin Stuart, GB

(73) Rofin-Sinar UK Ltd, Kingston upon Hull, HU10 6HD, GB

(74) Liucija JANICKAITĖ, 29, Inpatra UAB, Šeškinės g. 59-53, LT-07162 Vilnius, LT

(54) Optinio stiprintuvo konstrukcija

Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 7.

(57) 1. Aparatas, turintis osciliatorių, skleidžiantį stiprinamą spindulį (12), ir optinį stiprintuvą (10), šis optinis stiprintuvas turi:

stiprinimo terpę (14), kuri turi stačiakampio formos skerspjūvį su ilgąja kraštine ir trumpąja kraštine, skerspjūvio trumpoji kraštinė yra išilgai x ašies, ilgoji kraštinė yra išilgai y ašies, ir su z ašimi, x, y ir z ašys sudaro stačiakampę koordinačių sistemą;

ne mažiau kaip du gerai atspindinčius veidrodžius (20, 22), kur stiprinimo terpė išdėstyta tarp bent dviejų gerai atspindinčių veidrodžių, kur bent du gerai atspindintys veidrodžiai suprojektuoti ir išdėstyti taip, kad spindulys atspindimas bent vieną kartą nuo kiekvieno iš ne mažiau kaip dviejų gerai atspindinčių veidrodžių, kad apibrėžtų pirmąją ir antrąją trajektorijas (16, 18), kiekviena iš trajektorijų turi daugybę skersinių perėjimų (32) per stiprinimo terpę y-z plokštumoje, kur pirmoji ir antroji trajektorija atskirtos viena nuo kitos ir iš dalies sutampa stiprinimo terpėje,

b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad:

spindulys, patekdamas į optinį stiprintuvą, daro dvigubą pirmosios trajektorijos (16) perėjimą pradinio stiprintuvo etape (46) ir tada daro vieną perėjimą antrąja trajektorija (18) galios stiprintuvo etape.

2. Aparatas pagal 1 punktą, kur kiekvienoje trajektorijoje (16, 18) yra bent trys skersiniai perėjimai (32) per stiprinimo terpę (14).

3. Aparatas pagal 1 arba 2 punktą, kur antrojoje trajektorijoje (18) yra bent dar vienu skersiniu perėjimu (32) daugiau kaip pirmojoje trajektorijoje (16).

4. Aparatas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur optinis stiprintuvas (10) turi vaizdo gavimo veidrodį (34), išdėstytą stiprinimo terpės (14) išėjimo pusėje (26), kur spindulys (12), perėjęs pirmąja trajektorija (16), krinta į vaizdo gavimo veidrodį, o vaizdo gavimo veidrodis yra parinktas formuoti spindulį tiesiogiai ant savo galinio paviršiaus išilgai pirmosios trajektorijos, kad atliktų dvigubą perėjimą pradinio stiprintuvo etape (46).

5. Aparatas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur optinis stiprintuvas (10) turi pirmąjį ir antrąjį lęšius (36, 38), išdėstytus

stiprinimo terpės (14) įvesties pusėje (24), kur lęšiai išdėstyti taip, kad sudarytų teleskopą su didinimu, ir kur spindulys, išeinantis iš pradinio stiprintuvo etapo (46), yra iš naujo atspindimas per teleskopą, kad sudarytų įvesties spindulį energijos stiprinimo etape (48).

6. Aparatas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur optinis stiprintuvas (10) turi daugybę poliarizuojančių elementų.

7. Aparatas pagal 4 punktą, kur bangos ketvirčio plokštelė (40) yra greta vaizdo gavimo veidrodžio (34) stiprinimo terpės (14) išėjimo pusėje (26).

8. Aparatas pagal 6 arba 7 punktą, kur pirmasis poliarizacijos elementas išdėstytas stiprinimo terpės (14) įvesties pusėje (24).

9. Optinis stiprintuvo aparatas (10) pagal 8 punktą, kur pirmasis poliarizacijos elementas yra poliarizacijos kubas (42).

10. Aparatas pagal 8 arba 9 punktą, kur pirmasis poliarizacijos elementas ir pirmieji lęšiai (36) išdėstyti osciliatoriaus skleidžiamam spinduliui (12) nukreipti į stiprinimo terpę (14), skirtą pradiniam stiprinimo etapui (46).

11. Aparatas pagal 9 arba 10 punktą, kur poliarizacijos kubas (42) yra išdėstytas tarp pirmojo ir antrojo lęšių (36, 38).

12. Aparatas pagal 11 punktą, kur grįžimo veidrodis (44) yra tarp pirmojo poliarizuojančio elemento ir antrojo lęšio (38), kad nukreiptų spindulį atgal į stiprinimo terpę energijos stiprinimo etapui (48).

13. Aparatas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur optinis stiprintuvas (10) turi impulso rinkiklį, išdėstytą optinio stiprintuvo įėjime.

14. Aparatas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur gerai atspindintys veidrodžiai (20, 22) yra parinkti iš grupės, susidedančios iš:
plokščiųjų veidrodžių, sferinių veidrodžių, cilindrinių veidrodžių ir išlinkio tarp dviejų statmenų ašių skirtingų spindulių veidrodžių.

---

(51) Int.Cl. ***H01S 5/34*** (2006.01)
(11) **2511995**
(96) 12167206.7
(96) 2009-10-07
(97) 2012-10-17
(97) 2016-01-20
(30) 106693 P, 2008-10-20, US
402627, 2009-03-12, US
(72) Vurgaftman, Igor, US
Meyer, Jerry R., US
Kim, Mijin, US
Bewley, William W., US
Kim, Chul-soo, US
Lindle, James R., US
Canedy, Chadwick L., US
(73) The Government of the U.S.A., as represented by The Secretary of the Navy, Washington, DC 20375, US
(74) Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
(54) Aukštos temperatūros tarpjuostinis kaskadinis lazeris
Apibrėžties punktai: 3, brėžiniai: 5.
(57) 1. Tarpjuostinė kaskadinė aktyvioji terpė, apimanti:
aktyvią sustiprintą sritį, turinčią pirmąjį galą ir antrąjį galą, esantį priešais pirmąjį galą, turintį dengiantįjį sluoksnį (108a, 108b) kiekviename iš pirmojo ir antrojo galų, aktyvioji sustiprinta sritis apimanti daugybę kaskadinių pakopų, kiekviena iš kaskadinių pakopų (101) apima:
aktyvią sustiprintą kvantinių duobių sritį (101a, 201);

skylių purkštuvo sritį (101b, 202), gretimą aktyviai sustiprintai duobių sričiai; ir elektronų purkštuvo sritį (101c, 203), gretimą skylių purkštuvo sričiai;

kiekviena iš aktyvių sustiprintų kvantinių duobių sričių, skylių purkštuvo sritis ir elektronų purkštuvo sritis apima daugybę elektroninių barjerų ir bent viena iš elektroninių kvantinių duobių ir skylės kvantinė duobė ir aktyvioji pastiprinta sritis turi pirmosios pakopos aktyvią pastiprintą kvantinę duobių sritį ties jo pirmuoju galu ir paskutinės pakopos elektronų purkštuvo sritį ties jo antruoju galu, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad aktyvios pastiprintos srities bent vienos pakopos bent viena skylių purkštuvo sritis (202) yra atskirta nuo gretimos elektronų purkštuvo srities (203) AlSb elektroniniu barjeru (202d), turinčiu storį tarp 2,0 ir 2,5 mm, ir kuriame bent vienos pakopos bent viena elektronų purkštuvo sritis (101c, 203) turi mažesnį nei 25 nm storį; ir dar apima aukšto lūžio indekso atskirą apsauginį sluoksnį (106a, 106b), patalpintą tarp aktyvios sustiprintos srities ir atitinkamo dengiančiojo sluoksnio, atskiras apsauginis sluoksnis apima vieną iš GaSb, GaInSb, GaAlSb, GaAsSb, GaAlAsSb, GaInAsSb, GaAlInSb, ir GaAlInAsSb ir turi bent 0,8 μm bendrąjį storį.

2. Tarpjuostinė kaskadinė aktyvioji terpė pagal 1 punktą, kurioje aktyvios sustiprintos srities bent vienos pakopos bent viena skylių purkštuvo sritis apima bent vieną kvantinį barjerą, apimantį vieną iš elektroninių barjerų ir skylės barjerą ir dar apima bent dvi skylės kvantines duobes, kiekvienas iš bent vieno kvantinio barjero apima bent vieną iš AlSb, AlGaSb, AlGaAsSb, ir AlGaInAsSb, ir kiekvienas iš bent vieno kvantinio barjero apima vieną iš AlSb, AlGaSb, AlGaAsSb, ir AlGaInAsSb, ir kiekviena iš bent dviejų skylių kvantinių duobių apima vieną iš GaSb, GaInSb, GaAlSb, GaAsSb, GaAlAsSb, GaInAsSb, GaAlInSb, ir GaAlInAsSb, dviejų skylių kvantinių duobių bendrasis storis didesnis už 10 nm.

3. Tarpjuostinė kaskadinė aktyvioji terpė pagal 1 punktą, kurioje aktyvi sustiprinta kvantinių duobių sritis yra atskirta nuo gretimos skylių purkštuvo srities elektronų barjeru, turinčiu storį pakankamą sumažinti bangų funkcijos kvadratui, užeinančiam tarp aktyvios elektronų kvantinės duobės centro zonos ir skylių purkštuvo būsenos ne mažiau, kaip 5 %

Patento perleidimas pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 42 straipsnį

(11) **2503010**
(51) Int.Cl. ***C14B 15/00*** (2006.01)
C14C 15/00 (2006.01)
(13) T
(54) Būdas ir aparatas kailių apdorojimui
Perėmėjo pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, sutarties data
(73) Eikon Technologies Holding S.a.r.l., L-2661 Luxembourg, LU

---

(11) **2603614**
(51) Int.Cl. ***C14B 17/02*** (2006.01)
C14B 1/10 (2006.01)
C14B 1/02 (2006.01)
C14B 15/00 (2006.01)
(13) T
(54) Prietaisas kailiui apdoroti
Perėmėjo pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, sutarties data
(73) Eikon Technologies Holding S.a.r.l., L-2661 Luxembourg, LU

Europos patento pakeitimai, paskelbti pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 71 ir 79 straipsnius

(11) **1819227**

(51) Int.Cl. ***A61K 31/7068*** (2006.01)
A61K 31/724 (2006.01)
A61K 47/48 (2006.01)
A61P 3/00 (2006.01)
A61P 9/10 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

(13) T

(54) Decitabino farmacinė kompozicija

(73) Astex Pharmaceuticals, Inc., 4420 Rosewood Drive, Suite 200, Pleasanton, CA 94588, US

(46) 2011-05-25
Ankstesnis savininko pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, pakeitimo data
Astex Pharmaceuticals, Inc., 4140 Dublin Boulevard, Suite 200, Dublin, CA 94568, US
2016-04-18

Europos patentų išplėtimo Lietuvos Respublikoje panaikinimas pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 75 straipsnį

(11) EPO paskelbimo numeris	Panaikinimo data
1119334	2015-10-09
1326632	2015-10-11
1334962	2015-10-16
1334963	2015-10-16
1436321	2015-10-17
1440148	2015-10-14
1442023	2015-10-11
1495053	2015-10-11
1532986	2015-10-16
1553959	2015-10-08
1556338	2015-10-21
1684750	2015-10-22
1714977	2015-10-17

Europos patentai,
laikomi negaliojančiais
pagal Lietuvos Respublikos patentų
įstatymo 71 straipsnio 5 dalį

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
0981646	2016-01-06
1471806	2016-01-06
1485678	2016-01-06
1499453	2016-01-06
1547263	2016-01-13
1556073	2016-01-06
1611233	2016-01-06
1671183	2016-01-06
1673786	2016-01-06
2073013	2016-01-06
2213742	2016-01-06

Europos patentai, pripažinti negaliojančiais pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 71 ir 79 straipsnius

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
1478358	2016-03-09
2134607	2016-01-20

Europos patentai, kurių galiojimas pasibaigęs pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 36 straipsnį

Patento nr.	Galiojimo baigties data
0822760	2016-04-19
0846110	2016-04-18

Europos patentų galiojimo Lietuvos Respublikoje panaikinimas pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 81 straipsnį

(11) EPO paskelbimo numeris	Panaikinimo data
1800133	2015-10-07
1809602	2015-10-21
1816936	2015-10-20
1937118	2015-10-06
1937172	2015-10-17
1937245	2015-10-16
1937546	2015-10-19
1940821	2015-10-19
1954577	2015-10-06
2051033	2015-10-17
2053184	2015-10-09
2057122	2015-10-17
2081839	2015-10-19
2175588	2015-10-13
2197844	2015-10-13
2344397	2015-10-09
2491028	2015-10-19

Europos patentai, laikomi ab initio negaliojančiais pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 79 straipsnio 5 dalį

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
1561868	2016-01-13	1723458	2016-01-13
1566330	2016-01-13	1723771	2016-01-06
1607449	2016-01-06	1725995	2016-01-13
1608126	2016-01-06	1726640	2016-01-13
1627967	2016-01-06	1727442	2016-01-06
1637850	2016-01-06	1730600	2016-01-06
1657175	2016-01-13	1732915	2016-01-06
1666571	2016-01-13	1733121	2016-01-06
1672327	2016-01-13	1736376	2016-01-06
1673580	2016-01-06	1737677	2016-01-06
1686352	2016-01-06	1739101	2016-01-06
1693569	2016-01-13	1741561	2016-01-13
1700977	2016-01-06	1743221	2016-01-06
1710216	2016-01-13	1743357	2016-01-13
1711579	2016-01-13	1745902	2016-01-13
1712753	2016-01-13	1747616	2016-01-06
1719600	2016-01-13	1753385	2016-01-13
1720668	2016-01-06	1755832	2016-01-13
1722821	2016-01-13	1755898	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
1759073	2016-01-06	1814830	2016-01-13
1760274	2016-01-13	1818812	2016-01-06
1762011	2016-01-06	1824971	2016-01-13
1762837	2016-01-06	1826325	2016-01-13
1762998	2016-01-06	1827530	2016-01-06
1763200	2016-01-06	1830824	2016-01-13
1764990	2016-01-06	1831045	2016-01-13
1766162	2016-01-13	1832880	2016-01-13
1766516	2016-01-06	1834012	2016-01-06
1773973	2016-01-13	1837073	2016-01-06
1774118	2016-01-13	1838453	2016-01-06
1778037	2016-01-13	1845319	2016-01-13
1788864	2016-01-13	1847150	2016-01-06
1790094	2016-01-06	1849930	2016-01-13
1793760	2016-01-13	1852253	2016-01-06
1797323	2016-01-13	1855694	2016-01-13
1802970	2016-01-06	1856113	2016-01-06
1804988	2016-01-06	1856345	2016-01-13
1805938	2016-01-13	1856943	2016-01-06
1808560	2016-01-06	1859035	2016-01-13
1811230	2016-01-06	1859166	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
1860651	2016-01-06	1884720	2016-01-13
1861435	2016-01-13	1885957	2016-01-13
1861673	2016-01-06	1886106	2016-01-06
1862771	2016-01-13	1886414	2016-01-06
1863144	2016-01-06	1887932	2016-01-13
1867169	2016-01-13	1888388	2016-01-13
1867196	2016-01-13	1888653	2016-01-13
1867933	2016-01-06	1890877	2016-01-13
1872697	2016-01-06	1891067	2016-01-13
1873030	2016-01-06	1892864	2016-01-06
1874231	2016-01-06	1893308	2016-01-13
1874823	2016-01-13	1893637	2016-01-06
1877436	2016-01-13	1898710	2016-01-06
1877548	2016-01-06	1899783	2016-01-13
1878210	2016-01-13	1904113	2016-01-06
1880031	2016-01-06	1904727	2016-01-06
1880162	2016-01-13	1906086	2016-01-06
1883241	2016-01-13	1906339	2016-01-13
1883519	2016-01-13	1907775	2016-01-06
1883529	2016-01-06	1911418	2016-01-13
1884717	2016-01-13	1916872	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
1917437	2016-01-13	1952478	2016-01-06
1918916	2016-01-06	1953836	2016-01-13
1923796	2016-01-06	1954299	2016-01-13
1924566	2016-01-13	1954971	2016-01-06
1927010	2016-01-06	1956349	2016-01-13
1927466	2016-01-06	1956426	2016-01-06
1929579	2016-01-06	1959724	2016-01-06
1931344	2016-01-06	1960270	2016-01-06
1931541	2016-01-13	1962934	2016-01-06
1931780	2016-01-06	1963113	2016-01-06
1932636	2016-01-06	1965605	2016-01-06
1937476	2016-01-13	1971048	2016-01-13
1937612	2016-01-06	1971739	2016-01-06
1937910	2016-01-06	1973398	2016-01-06
1940327	2016-01-06	1973911	2016-01-13
1941241	2016-01-13	1974641	2016-01-06
1941356	2016-01-13	1974688	2016-01-13
1945146	2016-01-06	1976858	2016-01-06
1947134	2016-01-06	1977215	2016-01-13
1947700	2016-01-06	1980613	2016-01-06
1951392	2016-01-13	1981034	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
1983659	2016-01-06	1999894	2016-01-06
1986734	2016-01-13	2001354	2016-01-13
1987838	2016-01-13	2001466	2016-01-06
1987873	2016-01-06	2002649	2016-01-13
1989912	2016-01-06	2003268	2016-01-06
1991305	2016-01-06	2003986	2016-01-06
1992095	2016-01-13	2008114	2016-01-13
1992122	2016-01-13	2008398	2016-01-13
1992973	2016-01-06	2009736	2016-01-13
1992974	2016-01-06	2011949	2016-01-06
1994492	2016-01-13	2013431	2016-01-13
1994764	2016-01-13	2013628	2016-01-06
1995843	2016-01-06	2013938	2016-01-13
1995847	2016-01-06	2014019	2016-01-13
1996412	2016-01-13	2015384	2016-01-13
1996548	2016-01-06	2015574	2016-01-06
1996796	2016-01-06	2015767	2016-01-06
1997029	2016-01-13	2016058	2016-01-06
1998738	2016-01-13	2016070	2016-01-13
1999400	2016-01-13	2016074	2016-01-13
1999481	2016-01-06	2019664	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2021016	2016-01-06	2043732	2016-01-13
2021065	2016-01-13	2044380	2016-01-13
2021483	2016-01-06	2045470	2016-01-06
2021597	2016-01-06	2047538	2016-01-06
2022593	2016-01-13	2047628	2016-01-06
2023814	2016-01-06	2048698	2016-01-06
2024465	2016-01-13	2048946	2016-01-06
2026986	2016-01-06	2049443	2016-01-06
2027091	2016-01-06	2049650	2016-01-06
2027272	2016-01-06	2050305	2016-01-13
2034094	2016-01-06	2051396	2016-01-13
2035052	2016-01-06	2051799	2016-01-06
2035476	2016-01-13	2052149	2016-01-13
2037034	2016-01-06	2053688	2016-01-06
2039013	2016-01-06	2053777	2016-01-13
2040339	2016-01-06	2055787	2016-01-06
2040780	2016-01-06	2057935	2016-01-06
2040869	2016-01-06	2060057	2016-01-06
2041975	2016-01-06	2062305	2016-01-13
2042830	2016-01-13	2062615	2016-01-06
2043383	2016-01-06	2062952	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2063847	2016-01-06	2079959	2016-01-06
2063988	2016-01-13	2080428	2016-01-13
2064005	2016-01-06	2080736	2016-01-13
2064412	2016-01-06	2081332	2016-01-06
2065449	2016-01-06	2081592	2016-01-13
2065633	2016-01-06	2081618	2016-01-06
2066191	2016-01-13	2081622	2016-01-06
2066609	2016-01-06	2081680	2016-01-06
2066960	2016-01-06	2082815	2016-01-13
2068582	2016-01-13	2083013	2016-01-06
2069073	2016-01-13	2083101	2016-01-13
2069278	2016-01-06	2083580	2016-01-13
2069503	2016-01-06	2084582	2016-01-06
2072852	2016-01-06	2084972	2016-01-13
2073887	2016-01-06	2085025	2016-01-06
2074366	2016-01-06	2086150	2016-01-06
2074859	2016-01-13	2086516	2016-01-06
2076793	2016-01-06	2086945	2016-01-06
2077214	2016-01-13	2089248	2016-01-13
2078360	2016-01-06	2089385	2016-01-06
2079810	2016-01-06	2089753	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2089764	2016-01-06	2106812	2016-01-13
2090839	2016-01-13	2107301	2016-01-06
2091972	2016-01-13	2107606	2016-01-06
2092986	2016-01-13	2108240	2016-01-13
2093052	2016-01-13	2109421	2016-01-13
2094667	2016-01-13	2109440	2016-01-13
2094860	2016-01-13	2109457	2016-01-06
2095763	2016-01-06	2109957	2016-01-13
2097983	2016-01-06	2111269	2016-01-13
2098326	2016-01-06	2112104	2016-01-06
2101117	2016-01-06	2113955	2016-01-06
2101973	2016-01-06	2114200	2016-01-06
2102861	2016-01-06	2114310	2016-01-06
2104476	2016-01-06	2114480	2016-01-06
2104594	2016-01-06	2114647	2016-01-06
2105239	2016-01-13	2115875	2016-01-06
2105663	2016-01-06	2115903	2016-01-06
2106356	2016-01-06	2116528	2016-01-06
2106389	2016-01-06	2117456	2016-01-06
2106420	2016-01-06	2117633	2016-01-06
2106579	2016-01-06	2117806	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2118501	2016-01-06	2127134	2016-01-06
2118710	2016-01-06	2128212	2016-01-13
2118907	2016-01-13	2128971	2016-01-13
2119031	2016-01-06	2129212	2016-01-06
2119262	2016-01-06	2129308	2016-01-06
2119556	2016-01-06	2129704	2016-01-06
2120033	2016-01-13	2129744	2016-01-13
2120234	2016-01-06	2130817	2016-01-06
2121099	2016-01-13	2130962	2016-01-13
2121528	2016-01-06	2131411	2016-01-13
2122193	2016-01-13	2131539	2016-01-13
2122560	2016-01-06	2131779	2016-01-06
2122713	2016-01-13	2131985	2016-01-06
2122945	2016-01-06	2132134	2016-01-06
2123407	2016-01-06	2132392	2016-01-06
2124533	2016-01-06	2132910	2016-01-06
2124611	2016-01-13	2132991	2016-01-13
2124873	2016-01-06	2133377	2016-01-06
2125659	2016-01-13	2133397	2016-01-06
2126517	2016-01-06	2134473	2016-01-06
2127043	2016-01-06	2134554	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2134680	2016-01-13	2140807	2016-01-06
2134901	2016-01-06	2140830	2016-01-06
2135151	2016-01-06	2141213	2016-01-13
2135410	2016-01-13	2142004	2016-01-06
2135999	2016-01-13	2142025	2016-01-06
2136525	2016-01-06	2142566	2016-01-06
2136736	2016-01-06	2142851	2016-01-13
2136749	2016-01-13	2143115	2016-01-06
2136879	2016-01-06	2143186	2016-01-06
2137206	2016-01-06	2143195	2016-01-06
2137612	2016-01-13	2143936	2016-01-13
2137828	2016-01-06	2143942	2016-01-06
2138746	2016-01-13	2144096	2016-01-13
2139343	2016-01-13	2144152	2016-01-13
2139397	2016-01-13	2145380	2016-01-06
2139472	2016-01-13	2145532	2016-01-06
2140006	2016-01-13	2145750	2016-01-06
2140065	2016-01-13	2146012	2016-01-06
2140085	2016-01-13	2146145	2016-01-06
2140125	2016-01-13	2146186	2016-01-06
2140215	2016-01-13	2146187	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2146679	2016-01-06	2153258	2016-01-06
2146764	2016-01-06	2153435	2016-01-06
2147067	2016-01-06	2153779	2016-01-06
2147213	2016-01-13	2153856	2016-01-13
2148097	2016-01-06	2153966	2016-01-13
2148375	2016-01-06	2154242	2016-01-06
2148616	2016-01-13	2154243	2016-01-13
2148916	2016-01-13	2154453	2016-01-13
2149348	2016-01-06	2154591	2016-01-06
2149363	2016-01-06	2154953	2016-01-06
2150134	2016-01-06	2155067	2016-01-06
2150544	2016-01-13	2155691	2016-01-13
2150700	2016-01-06	2156180	2016-01-06
2151332	2016-01-06	2156215	2016-01-06
2151897	2016-01-13	2157314	2016-01-06
2152164	2016-01-13	2157412	2016-01-13
2152315	2016-01-06	2157416	2016-01-06
2152495	2016-01-06	2157593	2016-01-06
2153078	2016-01-13	2157879	2016-01-06
2153113	2016-01-06	2157987	2016-01-13
2153186	2016-01-13	2159561	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2159816	2016-01-13	2169770	2016-01-13
2160138	2016-01-06	2169972	2016-01-06
2160747	2016-01-06	2170001	2016-01-13
2162441	2016-01-06	2170031	2016-01-06
2162625	2016-01-06	2170221	2016-01-06
2164232	2016-01-13	2170270	2016-01-13
2164372	2016-01-13	2170431	2016-01-06
2164567	2016-01-06	2171041	2016-01-06
2164850	2016-01-13	2171467	2016-01-13
2165504	2016-01-06	2171514	2016-01-06
2166227	2016-01-06	2171633	2016-01-06
2167281	2016-01-06	2172068	2016-01-06
2167573	2016-01-06	2172169	2016-01-06
2168289	2016-01-13	2172403	2016-01-06
2168910	2016-01-13	2172547	2016-01-06
2169087	2016-01-13	2172760	2016-01-13
2169239	2016-01-06	2172798	2016-01-13
2169317	2016-01-06	2173908	2016-01-06
2169390	2016-01-06	2175300	2016-01-06
2169401	2016-01-06	2175906	2016-01-13
2169490	2016-01-06	2175918	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2176329	2016-01-06	2183127	2016-01-06
2176523	2016-01-13	2183494	2016-01-13
2176691	2016-01-06	2183593	2016-01-13
2177588	2016-01-06	2184089	2016-01-06
2178285	2016-01-06	2184803	2016-01-06
2178932	2016-01-13	2184930	2016-01-13
2179454	2016-01-13	2185589	2016-01-06
2179629	2016-01-06	2185636	2016-01-06
2179699	2016-01-06	2185949	2016-01-06
2179765	2016-01-13	2186340	2016-01-06
2179875	2016-01-06	2187166	2016-01-13
2180572	2016-01-13	2187371	2016-01-06
2180663	2016-01-06	2187896	2016-01-13
2180830	2016-01-06	2188617	2016-01-06
2180998	2016-01-06	2188903	2016-01-06
2181969	2016-01-13	2189140	2016-01-06
2182201	2016-01-13	2189155	2016-01-06
2182336	2016-01-13	2189344	2016-01-13
2182405	2016-01-13	2189465	2016-01-06
2182609	2016-01-13	2190402	2016-01-13
2182908	2016-01-06	2190629	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2190900	2016-01-06	2197800	2016-01-13
2191197	2016-01-13	2198304	2016-01-13
2191271	2016-01-13	2198324	2016-01-06
2191463	2016-01-13	2198346	2016-01-13
2191468	2016-01-06	2198401	2016-01-06
2191477	2016-01-06	2198666	2016-01-06
2192967	2016-01-13	2199275	2016-01-13
2193478	2016-01-06	2200539	2016-01-06
2193618	2016-01-06	2200650	2016-01-06
2193858	2016-01-13	2200970	2016-01-06
2194374	2016-01-13	2201327	2016-01-13
2194776	2016-01-06	2201646	2016-01-06
2194912	2016-01-06	2202045	2016-01-06
2195464	2016-01-06	2202462	2016-01-06
2195702	2016-01-06	2203089	2016-01-13
2196064	2016-01-13	2203411	2016-01-06
2196613	2016-01-13	2203677	2016-01-06
2197362	2016-01-06	2204350	2016-01-06
2197459	2016-01-06	2204528	2016-01-06
2197487	2016-01-06	2205159	2016-01-13
2197593	2016-01-06	2205311	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2206090	2016-01-06	2210089	2016-01-06
2206180	2016-01-06	2210629	2016-01-06
2206254	2016-01-06	2211007	2016-01-06
2206394	2016-01-06	2211086	2016-01-06
2206750	2016-01-13	2211217	2016-01-13
2207447	2016-01-13	2211292	2016-01-06
2207519	2016-01-13	2211776	2016-01-06
2207545	2016-01-06	2211859	2016-01-06
2207623	2016-01-06	2213728	2016-01-06
2207877	2016-01-13	2214571	2016-01-06
2207918	2016-01-06	2215176	2016-01-06
2208013	2016-01-06	2215484	2016-01-13
2208063	2016-01-06	2215681	2016-01-06
2208215	2016-01-13	2215866	2016-01-06
2208267	2016-01-06	2216463	2016-01-06
2208772	2016-01-06	2217768	2016-01-06
2209112	2016-01-06	2218026	2016-01-06
2209308	2016-01-13	2218631	2016-01-13
2209333	2016-01-06	2218799	2016-01-13
2209874	2016-01-06	2219309	2016-01-06
2209988	2016-01-13	2219916	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2220030	2016-01-13	2226143	2016-01-13
2220562	2016-01-13	2226406	2016-01-06
2220569	2016-01-06	2226839	2016-01-06
2220925	2016-01-06	2227273	2016-01-13
2221435	2016-01-06	2228044	2016-01-06
2221702	2016-01-06	2228231	2016-01-06
2221929	2016-01-13	2228436	2016-01-13
2222098	2016-01-13	2229480	2016-01-13
2222551	2016-01-06	2230065	2016-01-06
2222702	2016-01-13	2230077	2016-01-06
2222707	2016-01-06	2230480	2016-01-13
2223532	2016-01-06	2230727	2016-01-06
2223988	2016-01-06	2231272	2016-01-06
2224209	2016-01-13	2231391	2016-01-06
2224210	2016-01-13	2231682	2016-01-06
2225331	2016-01-06	2231904	2016-01-13
2225427	2016-01-06	2231973	2016-01-13
2225454	2016-01-13	2233168	2016-01-13
2225492	2016-01-13	2233393	2016-01-06
2225498	2016-01-06	2233962	2016-01-06
2225986	2016-01-06	2234288	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2234545	2016-01-06	2242998	2016-01-06
2234555	2016-01-06	2243320	2016-01-06
2234764	2016-01-13	2243475	2016-01-13
2235234	2016-01-06	2243556	2016-01-06
2236168	2016-01-13	2243625	2016-01-13
2236207	2016-01-13	2243679	2016-01-13
2238406	2016-01-13	2244030	2016-01-13
2239420	2016-01-06	2244566	2016-01-06
2239751	2016-01-13	2245812	2016-01-13
2239819	2016-01-13	2245829	2016-01-06
2240449	2016-01-06	2245832	2016-01-06
2240498	2016-01-06	2245855	2016-01-06
2240556	2016-01-13	2245881	2016-01-06
2240674	2016-01-13	2245917	2016-01-13
2240710	2016-01-13	2245952	2016-01-13
2241158	2016-01-06	2246010	2016-01-06
2241236	2016-01-06	2246268	2016-01-06
2241379	2016-01-13	2246389	2016-01-06
2241626	2016-01-06	2246513	2016-01-06
2242019	2016-01-13	2246601	2016-01-06
2242419	2016-01-13	2246831	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2247126	2016-01-06	2252809	2016-01-13
2247162	2016-01-06	2253364	2016-01-13
2247837	2016-01-13	2253375	2016-01-06
2247839	2016-01-06	2253376	2016-01-06
2247989	2016-01-06	2253824	2016-01-06
2248506	2016-01-13	2253889	2016-01-06
2248964	2016-01-13	2253928	2016-01-06
2249641	2016-01-06	2253946	2016-01-06
2249822	2016-01-06	2254106	2016-01-06
2250088	2016-01-06	2254303	2016-01-06
2250141	2016-01-06	2254385	2016-01-06
2250380	2016-01-06	2254509	2016-01-06
2250726	2016-01-13	2254512	2016-01-06
2250882	2016-01-06	2254539	2016-01-13
2251062	2016-01-13	2255191	2016-01-06
2251184	2016-01-13	2255839	2016-01-06
2251354	2016-01-06	2256177	2016-01-13
2251423	2016-01-13	2256320	2016-01-13
2251897	2016-01-06	2257109	2016-01-06
2252046	2016-01-13	2257462	2016-01-13
2252189	2016-01-06	2257524	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2257761	2016-01-06	2266442	2016-01-13
2257959	2016-01-13	2267305	2016-01-13
2258319	2016-01-06	2267350	2016-01-06
2258395	2016-01-06	2267488	2016-01-06
2259332	2016-01-06	2268435	2016-01-13
2259729	2016-01-06	2268471	2016-01-06
2260320	2016-01-13	2268515	2016-01-13
2261178	2016-01-13	2268984	2016-01-06
2261511	2016-01-06	2269281	2016-01-06
2261570	2016-01-06	2269320	2016-01-06
2262549	2016-01-13	2270101	2016-01-13
2263160	2016-01-13	2270594	2016-01-13
2263268	2016-01-06	2270775	2016-01-06
2263518	2016-01-06	2270813	2016-01-06
2264038	2016-01-06	2271937	2016-01-13
2264913	2016-01-06	2273730	2016-01-13
2265047	2016-01-06	2273867	2016-01-06
2265219	2016-01-06	2273911	2016-01-06
2265316	2016-01-13	2273995	2016-01-13
2266196	2016-01-13	2273997	2016-01-13
2266438	2016-01-06	2274068	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2274087	2016-01-06	2280532	2016-01-06
2274180	2016-01-13	2280672	2016-01-06
2274415	2016-01-13	2281650	2016-01-06
2275229	2016-01-06	2281731	2016-01-13
2275287	2016-01-06	2281733	2016-01-06
2275806	2016-01-06	2282053	2016-01-13
2276117	2016-01-06	2282466	2016-01-13
2276757	2016-01-06	2282945	2016-01-13
2276758	2016-01-06	2283189	2016-01-06
2277234	2016-01-13	2283244	2016-01-06
2277323	2016-01-06	2283447	2016-01-06
2277716	2016-01-06	2284352	2016-01-13
2278071	2016-01-06	2284708	2016-01-06
2278942	2016-01-06	2284984	2016-01-06
2279148	2016-01-06	2285496	2016-01-06
2279243	2016-01-06	2285537	2016-01-06
2279792	2016-01-06	2285873	2016-01-13
2279797	2016-01-13	2285954	2016-01-06
2279832	2016-01-13	2286066	2016-01-13
2279954	2016-01-06	2286138	2016-01-13
2280472	2016-01-06	2286240	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2286312	2016-01-06	2292599	2016-01-06
2286551	2016-01-06	2293512	2016-01-06
2287253	2016-01-06	2294053	2016-01-06
2287366	2016-01-06	2294078	2016-01-06
2287367	2016-01-13	2294198	2016-01-13
2287703	2016-01-13	2294219	2016-01-13
2287948	2016-01-06	2294392	2016-01-06
2288074	2016-01-06	2294479	2016-01-13
2288319	2016-01-06	2294707	2016-01-06
2288328	2016-01-06	2294729	2016-01-06
2288376	2016-01-13	2294772	2016-01-06
2288669	2016-01-06	2294792	2016-01-06
2290279	2016-01-13	2295024	2016-01-06
2290588	2016-01-06	2295056	2016-01-06
2291223	2016-01-06	2295207	2016-01-13
2291317	2016-01-06	2295216	2016-01-06
2291375	2016-01-06	2295536	2016-01-06
2291386	2016-01-13	2295563	2016-01-13
2291559	2016-01-13	2296028	2016-01-13
2291840	2016-01-13	2296201	2016-01-06
2292364	2016-01-06	2296626	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2296753	2016-01-06	2301647	2016-01-06
2297202	2016-01-13	2301692	2016-01-06
2297232	2016-01-06	2301784	2016-01-06
2297549	2016-01-06	2301830	2016-01-06
2297573	2016-01-06	2301946	2016-01-06
2297719	2016-01-13	2302378	2016-01-13
2297888	2016-01-06	2302557	2016-01-06
2298090	2016-01-13	2302635	2016-01-13
2298115	2016-01-06	2303008	2016-01-06
2298482	2016-01-13	2303212	2016-01-06
2298626	2016-01-13	2303343	2016-01-13
2299290	2016-01-06	2303529	2016-01-06
2299667	2016-01-06	2304036	2016-01-06
2299873	2016-01-06	2304227	2016-01-06
2300280	2016-01-13	2304583	2016-01-06
2300346	2016-01-13	2304711	2016-01-06
2300431	2016-01-06	2304847	2016-01-13
2300491	2016-01-06	2304869	2016-01-06
2300711	2016-01-13	2304994	2016-01-13
2300859	2016-01-13	2305048	2016-01-13
2301383	2016-01-06	2306660	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2307055	2016-01-06	2312029	2016-01-06
2307237	2016-01-13	2312885	2016-01-06
2307337	2016-01-13	2313377	2016-01-06
2308550	2016-01-13	2313541	2016-01-13
2308788	2016-01-13	2313658	2016-01-06
2308912	2016-01-06	2314200	2016-01-13
2308960	2016-01-13	2314267	2016-01-06
2309456	2016-01-06	2314414	2016-01-13
2309514	2016-01-06	2315005	2016-01-13
2309577	2016-01-06	2315803	2016-01-13
2309943	2016-01-13	2316205	2016-01-06
2310057	2016-01-13	2316453	2016-01-06
2310146	2016-01-13	2316525	2016-01-06
2310200	2016-01-06	2317297	2016-01-06
2310433	2016-01-06	2317404	2016-01-13
2310513	2016-01-06	2318090	2016-01-13
2310701	2016-01-06	2318135	2016-01-06
2311032	2016-01-06	2318157	2016-01-06
2311257	2016-01-06	2318633	2016-01-06
2311930	2016-01-06	2318837	2016-01-13
2312004	2016-01-06	2319017	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2319123	2016-01-06	2324717	2016-01-06
2319419	2016-01-06	2325936	2016-01-13
2320242	2016-01-13	2326134	2016-01-06
2320248	2016-01-13	2326233	2016-01-06
2320317	2016-01-06	2326430	2016-01-13
2320835	2016-01-06	2327576	2016-01-13
2320909	2016-01-06	2328307	2016-01-06
2320951	2016-01-06	2328475	2016-01-06
2321006	2016-01-13	2328480	2016-01-06
2321060	2016-01-06	2328649	2016-01-06
2321293	2016-01-06	2328730	2016-01-06
2321387	2016-01-13	2328889	2016-01-06
2322012	2016-01-06	2328923	2016-01-13
2322729	2016-01-06	2328962	2016-01-06
2323149	2016-01-13	2329189	2016-01-13
2323593	2016-01-13	2329223	2016-01-13
2323924	2016-01-13	2329248	2016-01-06
2324170	2016-01-06	2329348	2016-01-06
2324416	2016-01-13	2329577	2016-01-06
2324507	2016-01-06	2329903	2016-01-06
2324529	2016-01-13	2329993	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2330003	2016-01-06	2335929	2016-01-13
2330015	2016-01-06	2336349	2016-01-06
2330382	2016-01-06	2336450	2016-01-13
2330466	2016-01-06	2336458	2016-01-06
2331141	2016-01-06	2336473	2016-01-06
2331411	2016-01-06	2336581	2016-01-13
2331690	2016-01-13	2337171	2016-01-06
2332041	2016-01-06	2337208	2016-01-06
2332220	2016-01-06	2337516	2016-01-06
2332859	2016-01-06	2337653	2016-01-13
2332903	2016-01-13	2337972	2016-01-06
2333277	2016-01-06	2338587	2016-01-13
2333433	2016-01-13	2338628	2016-01-06
2333935	2016-01-06	2339796	2016-01-06
2334108	2016-01-06	2341053	2016-01-13
2334184	2016-01-13	2341845	2016-01-06
2334304	2016-01-06	2342097	2016-01-06
2334327	2016-01-06	2342100	2016-01-13
2334527	2016-01-13	2342115	2016-01-06
2335021	2016-01-13	2342185	2016-01-13
2335200	2016-01-06	2342351	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2342560	2016-01-06	2346493	2016-01-06
2342764	2016-01-13	2346806	2016-01-06
2342780	2016-01-06	2346809	2016-01-13
2343090	2016-01-13	2346916	2016-01-06
2343410	2016-01-06	2346990	2016-01-06
2343715	2016-01-06	2347296	2016-01-06
2343872	2016-01-06	2347457	2016-01-13
2343986	2016-01-06	2347798	2016-01-06
2344271	2016-01-06	2348373	2016-01-06
2344373	2016-01-13	2349105	2016-01-13
2344493	2016-01-06	2349127	2016-01-13
2344621	2016-01-06	2349293	2016-01-06
2344858	2016-01-06	2349475	2016-01-06
2345008	2016-01-06	2349566	2016-01-06
2345217	2016-01-13	2349717	2016-01-13
2345398	2016-01-06	2349826	2016-01-06
2345524	2016-01-06	2350035	2016-01-13
2345525	2016-01-13	2350166	2016-01-06
2345528	2016-01-06	2350646	2016-01-13
2346327	2016-01-13	2350751	2016-01-06
2346480	2016-01-06	2350978	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2351618	2016-01-13	2356522	2016-01-06
2351936	2016-01-06	2357752	2016-01-13
2352010	2016-01-13	2358716	2016-01-06
2352258	2016-01-13	2359757	2016-01-06
2352267	2016-01-13	2360173	2016-01-13
2352389	2016-01-06	2360420	2016-01-06
2352638	2016-01-06	2360494	2016-01-13
2352692	2016-01-06	2360834	2016-01-06
2352781	2016-01-06	2361166	2016-01-06
2352909	2016-01-13	2362390	2016-01-06
2353071	2016-01-06	2362563	2016-01-06
2353158	2016-01-13	2362752	2016-01-06
2353166	2016-01-06	2362924	2016-01-06
2353905	2016-01-06	2363067	2016-01-06
2354397	2016-01-13	2363306	2016-01-13
2354655	2016-01-06	2363310	2016-01-06
2354947	2016-01-06	2363900	2016-01-13
2356061	2016-01-06	2363997	2016-01-13
2356110	2016-01-06	2364084	2016-01-06
2356232	2016-01-13	2364414	2016-01-06
2356375	2016-01-06	2364512	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2364629	2016-01-06	2372906	2016-01-06
2365597	2016-01-06	2372951	2016-01-06
2366370	2016-01-06	2373065	2016-01-13
2366376	2016-01-13	2374449	2016-01-13
2366430	2016-01-06	2374768	2016-01-13
2366851	2016-01-06	2376057	2016-01-13
2367398	2016-01-06	2376487	2016-01-06
2367604	2016-01-13	2377349	2016-01-13
2368021	2016-01-13	2377596	2016-01-06
2368190	2016-01-06	2377994	2016-01-13
2368453	2016-01-06	2377996	2016-01-13
2369672	2016-01-06	2378040	2016-01-06
2369706	2016-01-13	2379829	2016-01-13
2369911	2016-01-06	2381130	2016-01-06
2371202	2016-01-06	2381971	2016-01-06
2371276	2016-01-13	2382120	2016-01-06
2371542	2016-01-06	2382625	2016-01-06
2372151	2016-01-13	2382637	2016-01-06
2372359	2016-01-06	2383027	2016-01-13
2372744	2016-01-13	2383363	2016-01-13
2372837	2016-01-06	2383615	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2383949	2016-01-06	2388769	2016-01-06
2384002	2016-01-13	2389124	2016-01-06
2384561	2016-01-06	2389501	2016-01-13
2385576	2016-01-06	2389519	2016-01-06
2385663	2016-01-06	2389745	2016-01-13
2386062	2016-01-06	2389765	2016-01-13
2386561	2016-01-13	2389781	2016-01-06
2386836	2016-01-06	2389990	2016-01-06
2386912	2016-01-06	2390538	2016-01-06
2387016	2016-01-06	2390688	2016-01-06
2387126	2016-01-06	2391502	2016-01-13
2387261	2016-01-13	2391600	2016-01-06
2387423	2016-01-06	2391674	2016-01-06
2387492	2016-01-06	2392106	2016-01-13
2387576	2016-01-13	2392801	2016-01-06
2387788	2016-01-13	2393335	2016-01-13
2387886	2016-01-06	2393476	2016-01-13
2388065	2016-01-13	2393990	2016-01-13
2388484	2016-01-06	2394031	2016-01-13
2388513	2016-01-06	2394079	2016-01-06
2388555	2016-01-13	2395666	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2396378	2016-01-13	2401232	2016-01-06
2396912	2016-01-06	2401253	2016-01-13
2397134	2016-01-06	2401400	2016-01-06
2397315	2016-01-13	2401450	2016-01-06
2397710	2016-01-06	2401550	2016-01-06
2397809	2016-01-06	2401751	2016-01-06
2398224	2016-01-13	2401809	2016-01-06
2398239	2016-01-06	2401904	2016-01-06
2398616	2016-01-13	2401905	2016-01-06
2398619	2016-01-06	2402204	2016-01-06
2398937	2016-01-06	2402290	2016-01-06
2399115	2016-01-06	2402776	2016-01-06
2399287	2016-01-06	2403147	2016-01-06
2399419	2016-01-06	2403962	2016-01-06
2399726	2016-01-13	2404572	2016-01-06
2400158	2016-01-13	2405147	2016-01-06
2400263	2016-01-06	2405991	2016-01-06
2400265	2016-01-13	2406377	2016-01-06
2400665	2016-01-13	2406418	2016-01-13
2400669	2016-01-06	2406458	2016-01-06
2400853	2016-01-06	2406524	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2406540	2016-01-06	2410937	2016-01-06
2406666	2016-01-06	2411203	2016-01-06
2406675	2016-01-13	2411443	2016-01-06
2407057	2016-01-06	2411572	2016-01-13
2407109	2016-01-06	2411611	2016-01-06
2407375	2016-01-06	2411965	2016-01-13
2407466	2016-01-13	2412294	2016-01-06
2407504	2016-01-06	2412480	2016-01-13
2407667	2016-01-13	2412494	2016-01-06
2408249	2016-01-06	2412597	2016-01-06
2408878	2016-01-06	2412834	2016-01-13
2408892	2016-01-06	2412980	2016-01-06
2409279	2016-01-06	2413032	2016-01-06
2409359	2016-01-06	2413518	2016-01-06
2409813	2016-01-06	2414001	2016-01-13
2410266	2016-01-13	2414008	2016-01-13
2410297	2016-01-06	2414043	2016-01-13
2410452	2016-01-13	2414377	2016-01-06
2410487	2016-01-13	2414762	2016-01-13
2410599	2016-01-13	2415126	2016-01-13
2410904	2016-01-13	2415198	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2415463	2016-01-13	2420746	2016-01-13
2416000	2016-01-06	2421080	2016-01-06
2416021	2016-01-13	2421846	2016-01-06
2416956	2016-01-06	2422059	2016-01-06
2416959	2016-01-06	2422352	2016-01-06
2417092	2016-01-06	2422558	2016-01-13
2417136	2016-01-06	2422779	2016-01-06
2417184	2016-01-06	2422941	2016-01-13
2418015	2016-01-06	2423136	2016-01-13
2418048	2016-01-06	2423641	2016-01-06
2418555	2016-01-13	2423818	2016-01-13
2418946	2016-01-06	2423942	2016-01-13
2419275	2016-01-06	2424177	2016-01-13
2419349	2016-01-13	2424321	2016-01-13
2419389	2016-01-13	2424394	2016-01-13
2419587	2016-01-06	2424484	2016-01-06
2420097	2016-01-06	2424756	2016-01-06
2420231	2016-01-13	2424875	2016-01-06
2420232	2016-01-06	2425258	2016-01-13
2420233	2016-01-13	2425531	2016-01-13
2420642	2016-01-13	2425664	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2425705	2016-01-06	2431164	2016-01-06
2425972	2016-01-13	2431200	2016-01-13
2426461	2016-01-13	2431282	2016-01-06
2426768	2016-01-06	2431510	2016-01-06
2426993	2016-01-13	2431740	2016-01-13
2427598	2016-01-06	2432029	2016-01-06
2427621	2016-01-06	2432259	2016-01-06
2427692	2016-01-13	2432711	2016-01-06
2428081	2016-01-13	2434520	2016-01-06
2428091	2016-01-13	2434790	2016-01-06
2428261	2016-01-06	2434900	2016-01-06
2428379	2016-01-13	2434901	2016-01-13
2428719	2016-01-13	2434974	2016-01-06
2428771	2016-01-13	2435441	2016-01-06
2429037	2016-01-13	2435442	2016-01-13
2429566	2016-01-06	2435493	2016-01-06
2429602	2016-01-06	2436021	2016-01-06
2430799	2016-01-06	2436050	2016-01-06
2431044	2016-01-13	2436129	2016-01-13
2431077	2016-01-06	2436669	2016-01-13
2431153	2016-01-06	2436679	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2436960	2016-01-06	2441017	2016-01-13
2437048	2016-01-06	2441100	2016-01-06
2437275	2016-01-06	2441299	2016-01-13
2437333	2016-01-06	2441575	2016-01-06
2437507	2016-01-06	2442216	2016-01-06
2437670	2016-01-13	2442827	2016-01-06
2437698	2016-01-06	2442867	2016-01-06
2437932	2016-01-13	2442970	2016-01-13
2438224	2016-01-13	2444116	2016-01-06
2438305	2016-01-13	2444149	2016-01-13
2438449	2016-01-13	2444251	2016-01-13
2438617	2016-01-06	2444359	2016-01-06
2438846	2016-01-06	2444395	2016-01-06
2439452	2016-01-06	2444611	2016-01-13
2440198	2016-01-06	2444625	2016-01-13
2440476	2016-01-06	2445182	2016-01-06
2440484	2016-01-06	2445653	2016-01-06
2440696	2016-01-06	2445658	2016-01-13
2440949	2016-01-13	2446526	2016-01-06
2440960	2016-01-06	2447043	2016-01-06
2441000	2016-01-06	2447420	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2447666	2016-01-13	2450434	2016-01-06
2448063	2016-01-13	2450649	2016-01-06
2448076	2016-01-06	2450697	2016-01-06
2448249	2016-01-06	2451066	2016-01-13
2448250	2016-01-06	2451285	2016-01-13
2448304	2016-01-06	2451357	2016-01-06
2448353	2016-01-13	2451764	2016-01-13
2448596	2016-01-06	2452090	2016-01-13
2448610	2016-01-06	2452226	2016-01-06
2448629	2016-01-06	2452910	2016-01-06
2448751	2016-01-13	2453139	2016-01-13
2448752	2016-01-06	2454003	2016-01-06
2449044	2016-01-06	2454159	2016-01-06
2449135	2016-01-06	2454292	2016-01-06
2449259	2016-01-13	2454499	2016-01-06
2449580	2016-01-06	2454537	2016-01-13
2449690	2016-01-06	2455346	2016-01-13
2449798	2016-01-06	2455417	2016-01-06
2449887	2016-01-06	2455450	2016-01-06
2449956	2016-01-13	2455633	2016-01-13
2450269	2016-01-06	2456162	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2456302	2016-01-06	2460593	2016-01-13
2456529	2016-01-06	2460803	2016-01-13
2456652	2016-01-06	2460996	2016-01-06
2457293	2016-01-13	2461040	2016-01-06
2457357	2016-01-06	2461055	2016-01-13
2457375	2016-01-06	2461446	2016-01-06
2457903	2016-01-13	2461697	2016-01-06
2457992	2016-01-06	2461710	2016-01-13
2458025	2016-01-06	2461829	2016-01-06
2458710	2016-01-06	2462115	2016-01-06
2459020	2016-01-13	2462177	2016-01-06
2459399	2016-01-06	2462252	2016-01-06
2459435	2016-01-06	2462466	2016-01-06
2459812	2016-01-06	2463594	2016-01-06
2459813	2016-01-06	2463899	2016-01-06
2459825	2016-01-06	2464335	2016-01-06
2459958	2016-01-13	2464409	2016-01-13
2460067	2016-01-06	2464411	2016-01-06
2460182	2016-01-13	2464603	2016-01-13
2460214	2016-01-06	2464739	2016-01-13
2460258	2016-01-06	2465094	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2465153	2016-01-06	2470637	2016-01-06
2465251	2016-01-06	2470922	2016-01-13
2465286	2016-01-06	2471079	2016-01-06
2466588	2016-01-13	2472185	2016-01-13
2466843	2016-01-06	2472710	2016-01-13
2467048	2016-01-06	2473086	2016-01-06
2467294	2016-01-06	2473448	2016-01-13
2467353	2016-01-13	2473713	2016-01-06
2467471	2016-01-13	2473989	2016-01-13
2467479	2016-01-06	2474619	2016-01-13
2467502	2016-01-13	2474643	2016-01-06
2467637	2016-01-13	2475377	2016-01-06
2467650	2016-01-06	2475468	2016-01-13
2468608	2016-01-06	2475593	2016-01-13
2468662	2016-01-06	2475621	2016-01-06
2468968	2016-01-13	2475736	2016-01-13
2470006	2016-01-06	2475951	2016-01-06
2470015	2016-01-13	2475992	2016-01-06
2470078	2016-01-06	2476183	2016-01-13
2470310	2016-01-06	2476489	2016-01-13
2470496	2016-01-06	2477193	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2477243	2016-01-06	2481979	2016-01-06
2477459	2016-01-13	2482593	2016-01-13
2477647	2016-01-13	2483151	2016-01-13
2477749	2016-01-06	2483196	2016-01-13
2478110	2016-01-06	2483211	2016-01-13
2478397	2016-01-06	2483303	2016-01-06
2479093	2016-01-06	2483377	2016-01-06
2479140	2016-01-06	2483555	2016-01-06
2479158	2016-01-06	2483565	2016-01-06
2479260	2016-01-06	2484691	2016-01-13
2479662	2016-01-06	2485229	2016-01-13
2479876	2016-01-06	2485433	2016-01-06
2480070	2016-01-06	2486288	2016-01-13
2480192	2016-01-13	2486747	2016-01-06
2480254	2016-01-13	2487118	2016-01-06
2481182	2016-01-13	2487146	2016-01-13
2481351	2016-01-06	2487699	2016-01-06
2481360	2016-01-06	2487740	2016-01-06
2481461	2016-01-06	2487810	2016-01-13
2481702	2016-01-06	2488081	2016-01-13
2481870	2016-01-13	2488409	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2488436	2016-01-13	2493211	2016-01-13
2488492	2016-01-13	2493348	2016-01-13
2488539	2016-01-06	2493359	2016-01-13
2489038	2016-01-13	2493421	2016-01-06
2489091	2016-01-06	2493461	2016-01-06
2489114	2016-01-13	2493633	2016-01-06
2489239	2016-01-13	2494220	2016-01-13
2489496	2016-01-06	2494598	2016-01-13
2489973	2016-01-06	2494641	2016-01-13
2490364	2016-01-13	2494737	2016-01-06
2490408	2016-01-13	2494755	2016-01-06
2490474	2016-01-06	2495109	2016-01-13
2490718	2016-01-13	2495204	2016-01-06
2490899	2016-01-13	2495747	2016-01-13
2491013	2016-01-13	2496012	2016-01-06
2491782	2016-01-06	2496055	2016-01-06
2491820	2016-01-06	2496107	2016-01-06
2492035	2016-01-13	2496348	2016-01-06
2492180	2016-01-13	2496797	2016-01-13
2492233	2016-01-13	2496849	2016-01-13
2492436	2016-01-13	2497449	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2497673	2016-01-06	2500537	2016-01-06
2497784	2016-01-06	2501265	2016-01-13
2497787	2016-01-13	2501304	2016-01-06
2497834	2016-01-06	2501317	2016-01-13
2498155	2016-01-06	2501607	2016-01-06
2498157	2016-01-13	2501940	2016-01-13
2498258	2016-01-13	2502580	2016-01-13
2498408	2016-01-13	2502581	2016-01-13
2498513	2016-01-06	2502685	2016-01-13
2498979	2016-01-06	2502783	2016-01-13
2499119	2016-01-06	2502868	2016-01-06
2499375	2016-01-13	2502936	2016-01-06
2499390	2016-01-13	2503024	2016-01-13
2499544	2016-01-06	2503292	2016-01-06
2499642	2016-01-06	2503313	2016-01-06
2499708	2016-01-06	2503887	2016-01-06
2499837	2016-01-13	2504659	2016-01-13
2499984	2016-01-06	2504742	2016-01-06
2500141	2016-01-06	2504839	2016-01-06
2500308	2016-01-06	2505445	2016-01-06
2500468	2016-01-13	2505539	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2505798	2016-01-06	2517112	2016-01-13
2505826	2016-01-13	2518077	2016-01-06
2506541	2016-01-13	2518482	2016-01-06
2507155	2016-01-13	2519723	2016-01-06
2507672	2016-01-06	2520472	2016-01-13
2508025	2016-01-06	2520757	2016-01-06
2508246	2016-01-06	2520783	2016-01-06
2508735	2016-01-06	2521265	2016-01-13
2508991	2016-01-06	2521476	2016-01-06
2508995	2016-01-06	2521753	2016-01-13
2509344	2016-01-13	2522400	2016-01-13
2509654	2016-01-06	2522485	2016-01-13
2511064	2016-01-13	2522704	2016-01-06
2511215	2016-01-13	2522785	2016-01-06
2511932	2016-01-13	2522936	2016-01-06
2511985	2016-01-13	2523618	2016-01-06
2512190	2016-01-06	2523666	2016-01-13
2513511	2016-01-06	2523882	2016-01-06
2514689	2016-01-13	2524119	2016-01-06
2515305	2016-01-06	2524407	2016-01-06
2515876	2016-01-06	2524562	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2524573	2016-01-13	2532837	2016-01-06
2524619	2016-01-06	2533080	2016-01-06
2524755	2016-01-06	2533150	2016-01-13
2525879	2016-01-06	2533943	2016-01-06
2525963	2016-01-13	2534209	2016-01-06
2526492	2016-01-06	2534387	2016-01-13
2526683	2016-01-13	2534697	2016-01-13
2526734	2016-01-06	2535385	2016-01-13
2527031	2016-01-06	2535681	2016-01-06
2527897	2016-01-13	2535723	2016-01-13
2528617	2016-01-06	2536313	2016-01-13
2528820	2016-01-13	2537099	2016-01-06
2530132	2016-01-06	2537682	2016-01-06
2530260	2016-01-13	2537995	2016-01-06
2530492	2016-01-13	2538058	2016-01-13
2531244	2016-01-06	2538113	2016-01-06
2531277	2016-01-13	2538240	2016-01-13
2531278	2016-01-13	2538609	2016-01-06
2531450	2016-01-06	2538886	2016-01-13
2532013	2016-01-13	2539632	2016-01-06
2532780	2016-01-13	2540749	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2540987	2016-01-06	2548424	2016-01-13
2541028	2016-01-06	2548483	2016-01-06
2541955	2016-01-13	2548841	2016-01-06
2542045	2016-01-06	2548855	2016-01-06
2542135	2016-01-06	2548856	2016-01-13
2542426	2016-01-06	2548962	2016-01-13
2543782	2016-01-06	2549262	2016-01-06
2543844	2016-01-13	2549759	2016-01-13
2544085	2016-01-13	2549785	2016-01-06
2544595	2016-01-06	2550059	2016-01-06
2544815	2016-01-06	2550375	2016-01-13
2545106	2016-01-13	2550489	2016-01-13
2545257	2016-01-13	2550646	2016-01-13
2546205	2016-01-13	2550663	2016-01-13
2546527	2016-01-13	2550769	2016-01-13
2547249	2016-01-06	2551057	2016-01-06
2547268	2016-01-06	2551876	2016-01-06
2547642	2016-01-13	2552195	2016-01-06
2547909	2016-01-06	2552285	2016-01-13
2547921	2016-01-06	2552335	2016-01-13
2548423	2016-01-13	2552552	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2553134	2016-01-13	2559779	2016-01-13
2553138	2016-01-13	2559923	2016-01-06
2553446	2016-01-06	2560338	2016-01-13
2553889	2016-01-13	2560841	2016-01-06
2554178	2016-01-13	2560953	2016-01-06
2554815	2016-01-06	2561011	2016-01-06
2556218	2016-01-06	2561613	2016-01-13
2556261	2016-01-06	2561796	2016-01-06
2556296	2016-01-13	2562152	2016-01-13
2556468	2016-01-13	2562357	2016-01-06
2556506	2016-01-06	2562646	2016-01-13
2556564	2016-01-06	2562784	2016-01-13
2556582	2016-01-06	2562822	2016-01-13
2556649	2016-01-06	2562863	2016-01-06
2557036	2016-01-13	2563213	2016-01-06
2557846	2016-01-13	2563561	2016-01-06
2558237	2016-01-06	2563667	2016-01-06
2558281	2016-01-13	2564262	2016-01-06
2558484	2016-01-13	2564434	2016-01-13
2559648	2016-01-13	2564607	2016-01-13
2559709	2016-01-13	2564659	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2564911	2016-01-06	2574228	2016-01-06
2564952	2016-01-13	2574302	2016-01-13
2565319	2016-01-13	2574468	2016-01-13
2565429	2016-01-06	2574817	2016-01-06
2565828	2016-01-13	2575048	2016-01-13
2566473	2016-01-06	2576251	2016-01-13
2566875	2016-01-06	2576252	2016-01-06
2567345	2016-01-13	2576264	2016-01-13
2567983	2016-01-13	2576322	2016-01-06
2568361	2016-01-13	2576774	2016-01-06
2568725	2016-01-13	2576790	2016-01-06
2568933	2016-01-13	2577743	2016-01-13
2568986	2016-01-13	2578567	2016-01-13
2569311	2016-01-13	2578874	2016-01-13
2569581	2016-01-13	2579375	2016-01-06
2570034	2016-01-13	2579625	2016-01-13
2570281	2016-01-06	2579754	2016-01-06
2570477	2016-01-06	2579805	2016-01-06
2571367	2016-01-13	2579839	2016-01-13
2571956	2016-01-13	2579916	2016-01-06
2573537	2016-01-13	2580174	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2580182	2016-01-06	2586212	2016-01-13
2580759	2016-01-13	2586263	2016-01-13
2580937	2016-01-13	2586744	2016-01-13
2581567	2016-01-13	2586956	2016-01-06
2581905	2016-01-06	2586960	2016-01-13
2582155	2016-01-13	2587381	2016-01-06
2582410	2016-01-06	2587975	2016-01-13
2582429	2016-01-13	2587980	2016-01-06
2582668	2016-01-13	2587995	2016-01-13
2582802	2016-01-13	2588524	2016-01-06
2582988	2016-01-06	2589191	2016-01-06
2583481	2016-01-13	2589260	2016-01-06
2583557	2016-01-13	2590603	2016-01-06
2583584	2016-01-06	2590829	2016-01-13
2583585	2016-01-13	2591365	2016-01-13
2583911	2016-01-13	2591497	2016-01-06
2584378	2016-01-06	2591674	2016-01-13
2585449	2016-01-06	2591954	2016-01-06
2585524	2016-01-06	2592658	2016-01-13
2585634	2016-01-13	2592682	2016-01-06
2585730	2016-01-13	2593209	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2593686	2016-01-06	2601036	2016-01-06
2594219	2016-01-13	2601284	2016-01-13
2594485	2016-01-13	2601482	2016-01-06
2594514	2016-01-06	2602021	2016-01-06
2595087	2016-01-06	2602120	2016-01-13
2595194	2016-01-06	2602251	2016-01-13
2595782	2016-01-06	2602747	2016-01-13
2596007	2016-01-06	2603346	2016-01-13
2596647	2016-01-06	2603386	2016-01-06
2597105	2016-01-06	2603950	2016-01-13
2597117	2016-01-13	2604097	2016-01-13
2597740	2016-01-06	2605517	2016-01-13
2598020	2016-01-06	2605556	2016-01-13
2598234	2016-01-06	2605672	2016-01-13
2598309	2016-01-13	2605881	2016-01-06
2598941	2016-01-06	2605911	2016-01-06
2599161	2016-01-06	2605947	2016-01-06
2599328	2016-01-06	2606038	2016-01-13
2599568	2016-01-06	2606045	2016-01-06
2599805	2016-01-13	2606182	2016-01-06
2600565	2016-01-06	2606516	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2606550	2016-01-13	2614163	2016-01-06
2606551	2016-01-06	2614706	2016-01-13
2607489	2016-01-13	2614802	2016-01-06
2608513	2016-01-06	2615029	2016-01-13
2608735	2016-01-13	2615084	2016-01-06
2608926	2016-01-06	2615280	2016-01-06
2608945	2016-01-13	2615457	2016-01-13
2609306	2016-01-06	2615654	2016-01-06
2609475	2016-01-06	2616141	2016-01-13
2609661	2016-01-06	2616181	2016-01-13
2611289	2016-01-06	2616252	2016-01-06
2611332	2016-01-13	2616279	2016-01-06
2611929	2016-01-13	2616775	2016-01-06
2611949	2016-01-06	2616987	2016-01-13
2612321	2016-01-06	2617166	2016-01-13
2612474	2016-01-13	2617741	2016-01-13
2612836	2016-01-13	2618042	2016-01-13
2613390	2016-01-13	2618342	2016-01-13
2613441	2016-01-13	2618357	2016-01-06
2613483	2016-01-13	2618412	2016-01-13
2613559	2016-01-06	2618834	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2618923	2016-01-13	2624762	2016-01-13
2619222	2016-01-06	2625100	2016-01-06
2619266	2016-01-06	2625747	2016-01-06
2619865	2016-01-06	2625826	2016-01-06
2619981	2016-01-06	2626071	2016-01-13
2620013	2016-01-13	2626611	2016-01-06
2620317	2016-01-06	2627050	2016-01-13
2620378	2016-01-06	2627229	2016-01-06
2620389	2016-01-06	2627424	2016-01-06
2621415	2016-01-13	2628003	2016-01-13
2621609	2016-01-06	2628236	2016-01-06
2621703	2016-01-06	2628237	2016-01-06
2621758	2016-01-06	2628260	2016-01-13
2621919	2016-01-13	2628310	2016-01-13
2622152	2016-01-13	2628437	2016-01-13
2622535	2016-01-13	2628472	2016-01-13
2622602	2016-01-06	2628887	2016-01-13
2623146	2016-01-06	2629274	2016-01-06
2623405	2016-01-06	2629367	2016-01-13
2623983	2016-01-06	2629715	2016-01-06
2624719	2016-01-06	2630927	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2631444	2016-01-13	2636393	2016-01-06
2631518	2016-01-13	2636454	2016-01-13
2631672	2016-01-13	2636567	2016-01-06
2631970	2016-01-13	2636677	2016-01-13
2632007	2016-01-13	2636700	2016-01-06
2632058	2016-01-13	2637106	2016-01-06
2632066	2016-01-06	2637176	2016-01-06
2632088	2016-01-13	2638392	2016-01-13
2632984	2016-01-13	2638447	2016-01-13
2633731	2016-01-13	2638795	2016-01-13
2633970	2016-01-06	2638845	2016-01-06
2634107	2016-01-06	2638870	2016-01-13
2634185	2016-01-13	2639449	2016-01-06
2634353	2016-01-06	2639852	2016-01-06
2635330	2016-01-06	2640846	2016-01-06
2635496	2016-01-06	2641067	2016-01-13
2635675	2016-01-06	2642177	2016-01-13
2635715	2016-01-13	2642623	2016-01-06
2635808	2016-01-13	2642804	2016-01-06
2635873	2016-01-13	2642933	2016-01-13
2636112	2016-01-06	2642940	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2643615	2016-01-06	2652123	2016-01-13
2644103	2016-01-13	2652586	2016-01-13
2644202	2016-01-13	2652596	2016-01-06
2644219	2016-01-06	2653332	2016-01-13
2644231	2016-01-06	2655518	2016-01-06
2644540	2016-01-06	2656723	2016-01-06
2644612	2016-01-06	2656834	2016-01-06
2644871	2016-01-06	2657033	2016-01-06
2644884	2016-01-06	2657198	2016-01-06
2644917	2016-01-13	2657503	2016-01-13
2645166	2016-01-13	2657554	2016-01-06
2645769	2016-01-06	2657645	2016-01-06
2645774	2016-01-06	2657701	2016-01-06
2645834	2016-01-06	2660178	2016-01-06
2646406	2016-01-13	2660491	2016-01-13
2646604	2016-01-06	2660554	2016-01-13
2646693	2016-01-13	2660972	2016-01-06
2647691	2016-01-13	2662028	2016-01-13
2650610	2016-01-13	2662307	2016-01-06
2650976	2016-01-06	2662667	2016-01-06
2651509	2016-01-06	2662704	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2662827	2016-01-13	2666917	2016-01-13
2662888	2016-01-13	2667071	2016-01-06
2663023	2016-01-06	2667396	2016-01-06
2663568	2016-01-06	2667675	2016-01-06
2663609	2016-01-06	2667981	2016-01-13
2663850	2016-01-06	2668067	2016-01-13
2664095	2016-01-06	2668274	2016-01-13
2664424	2016-01-06	2668502	2016-01-13
2664545	2016-01-13	2668887	2016-01-13
2665158	2016-01-13	2668892	2016-01-06
2665235	2016-01-06	2669012	2016-01-13
2665379	2016-01-13	2669151	2016-01-06
2665700	2016-01-13	2669169	2016-01-13
2665749	2016-01-13	2669325	2016-01-13
2665825	2016-01-13	2669497	2016-01-06
2665969	2016-01-13	2669592	2016-01-06
2666383	2016-01-13	2669736	2016-01-06
2666395	2016-01-13	2669889	2016-01-13
2666442	2016-01-13	2670560	2016-01-13
2666618	2016-01-13	2671005	2016-01-06
2666638	2016-01-06	2671139	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2671446	2016-01-13	2676410	2016-01-06
2671824	2016-01-13	2676419	2016-01-13
2671874	2016-01-13	2676743	2016-01-06
2671915	2016-01-06	2676847	2016-01-06
2671992	2016-01-06	2676881	2016-01-06
2672310	2016-01-06	2676921	2016-01-06
2672777	2016-01-06	2677251	2016-01-13
2672891	2016-01-06	2677666	2016-01-13
2673048	2016-01-13	2677725	2016-01-13
2673463	2016-01-06	2678314	2016-01-06
2673498	2016-01-06	2678942	2016-01-06
2674649	2016-01-13	2679139	2016-01-13
2674759	2016-01-06	2679177	2016-01-06
2674791	2016-01-13	2679287	2016-01-13
2674972	2016-01-06	2679368	2016-01-06
2675118	2016-01-06	2679549	2016-01-06
2675131	2016-01-13	2679657	2016-01-06
2675138	2016-01-13	2679719	2016-01-06
2675184	2016-01-13	2679747	2016-01-13
2675718	2016-01-13	2679888	2016-01-13
2675792	2016-01-06	2679889	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2680083	2016-01-06	2683528	2016-01-13
2680165	2016-01-06	2683779	2016-01-06
2680287	2016-01-13	2684155	2016-01-13
2680380	2016-01-06	2684257	2016-01-13
2680419	2016-01-06	2684356	2016-01-13
2680674	2016-01-06	2684459	2016-01-13
2680708	2016-01-06	2684830	2016-01-06
2680896	2016-01-13	2685056	2016-01-06
2681193	2016-01-06	2685739	2016-01-13
2681375	2016-01-06	2686114	2016-01-06
2681502	2016-01-13	2686216	2016-01-13
2681849	2016-01-06	2686324	2016-01-06
2681852	2016-01-13	2686484	2016-01-13
2681889	2016-01-06	2686735	2016-01-06
2681984	2016-01-06	2687113	2016-01-06
2682354	2016-01-06	2687163	2016-01-13
2682727	2016-01-06	2687241	2016-01-06
2682798	2016-01-13	2687242	2016-01-13
2683160	2016-01-13	2687451	2016-01-13
2683196	2016-01-13	2687466	2016-01-13
2683411	2016-01-13	2687523	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2687575	2016-01-13	2691001	2016-01-06
2687596	2016-01-06	2691082	2016-01-13
2687610	2016-01-06	2691311	2016-01-06
2687671	2016-01-13	2691335	2016-01-06
2687676	2016-01-13	2691507	2016-01-06
2687733	2016-01-13	2692149	2016-01-13
2687756	2016-01-06	2692215	2016-01-06
2688002	2016-01-06	2692244	2016-01-13
2688648	2016-01-06	2692545	2016-01-06
2688841	2016-01-06	2692766	2016-01-13
2689024	2016-01-13	2692948	2016-01-06
2689058	2016-01-13	2693065	2016-01-06
2689160	2016-01-06	2693072	2016-01-13
2689188	2016-01-13	2693838	2016-01-13
2689229	2016-01-06	2694129	2016-01-06
2689426	2016-01-06	2694247	2016-01-13
2689491	2016-01-13	2694313	2016-01-06
2689563	2016-01-06	2694755	2016-01-13
2689949	2016-01-13	2695361	2016-01-06
2690343	2016-01-06	2695467	2016-01-13
2690696	2016-01-13	2695521	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2695648	2016-01-06	2700897	2016-01-06
2695935	2016-01-06	2701007	2016-01-06
2697220	2016-01-13	2701374	2016-01-13
2697552	2016-01-13	2701603	2016-01-06
2697611	2016-01-13	2701828	2016-01-13
2697893	2016-01-13	2702430	2016-01-13
2698357	2016-01-06	2702878	2016-01-13
2698398	2016-01-13	2702943	2016-01-13
2698693	2016-01-13	2703180	2016-01-06
2698756	2016-01-06	2703206	2016-01-13
2698863	2016-01-13	2704233	2016-01-06
2699314	2016-01-06	2704849	2016-01-06
2699383	2016-01-06	2704938	2016-01-13
2699479	2016-01-06	2704951	2016-01-13
2699504	2016-01-13	2705267	2016-01-06
2699674	2016-01-06	2705596	2016-01-06
2699806	2016-01-06	2705770	2016-01-06
2700055	2016-01-13	2706183	2016-01-13
2700093	2016-01-13	2706925	2016-01-06
2700175	2016-01-13	2706960	2016-01-06
2700576	2016-01-13	2707412	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2707750	2016-01-06	2712103	2016-01-13
2708546	2016-01-06	2712128	2016-01-13
2708575	2016-01-06	2712308	2016-01-13
2708732	2016-01-13	2712767	2016-01-13
2708810	2016-01-06	2713100	2016-01-06
2708853	2016-01-13	2713699	2016-01-06
2709444	2016-01-06	2713720	2016-01-06
2709465	2016-01-13	2714117	2016-01-06
2709544	2016-01-13	2714229	2016-01-06
2709874	2016-01-13	2714356	2016-01-13
2709998	2016-01-06	2714973	2016-01-13
2710766	2016-01-13	2715033	2016-01-06
2710778	2016-01-06	2715054	2016-01-06
2710824	2016-01-13	2715267	2016-01-13
2710926	2016-01-06	2715372	2016-01-06
2711129	2016-01-06	2716075	2016-01-06
2711211	2016-01-13	2716193	2016-01-06
2711329	2016-01-13	2716280	2016-01-06
2711459	2016-01-13	2716590	2016-01-06
2711506	2016-01-13	2716699	2016-01-13
2711619	2016-01-13	2716771	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2716891	2016-01-13	2722437	2016-01-13
2717092	2016-01-06	2722860	2016-01-06
2717416	2016-01-06	2722903	2016-01-06
2718122	2016-01-13	2722969	2016-01-06
2718654	2016-01-06	2723547	2016-01-06
2718700	2016-01-06	2723609	2016-01-06
2719226	2016-01-06	2723767	2016-01-06
2719593	2016-01-06	2724382	2016-01-13
2720300	2016-01-13	2724698	2016-01-06
2720504	2016-01-13	2724798	2016-01-06
2720572	2016-01-06	2724917	2016-01-06
2720894	2016-01-13	2724994	2016-01-06
2721104	2016-01-06	2725283	2016-01-13
2721601	2016-01-13	2726177	2016-01-06
2721756	2016-01-13	2727416	2016-01-06
2721836	2016-01-06	2727567	2016-01-06
2721892	2016-01-06	2727868	2016-01-06
2722126	2016-01-06	2727869	2016-01-06
2722127	2016-01-13	2728190	2016-01-13
2722291	2016-01-13	2728200	2016-01-13
2722314	2016-01-06	2729310	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2729381	2016-01-13	2732809	2016-01-06
2729548	2016-01-06	2732811	2016-01-13
2729629	2016-01-13	2732843	2016-01-13
2729728	2016-01-06	2732845	2016-01-13
2730328	2016-01-13	2732855	2016-01-13
2730484	2016-01-06	2732974	2016-01-06
2730516	2016-01-13	2733017	2016-01-13
2730583	2016-01-13	2733085	2016-01-06
2730837	2016-01-13	2733103	2016-01-13
2730893	2016-01-06	2733144	2016-01-06
2730928	2016-01-13	2733184	2016-01-06
2731423	2016-01-13	2733804	2016-01-06
2731467	2016-01-13	2733974	2016-01-13
2731673	2016-01-13	2734277	2016-01-06
2731787	2016-01-06	2734294	2016-01-06
2731804	2016-01-13	2734382	2016-01-06
2732067	2016-01-06	2734666	2016-01-13
2732170	2016-01-06	2734694	2016-01-13
2732406	2016-01-13	2734840	2016-01-06
2732604	2016-01-06	2735234	2016-01-06
2732641	2016-01-06	2735420	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2735926	2016-01-13	2741534	2016-01-13
2736471	2016-01-13	2741646	2016-01-13
2736545	2016-01-06	2741671	2016-01-13
2736561	2016-01-06	2741691	2016-01-13
2736822	2016-01-13	2741819	2016-01-06
2737012	2016-01-13	2741926	2016-01-13
2737131	2016-01-13	2742428	2016-01-06
2737354	2016-01-06	2742549	2016-01-13
2737434	2016-01-06	2742718	2016-01-06
2737608	2016-01-06	2743017	2016-01-13
2737952	2016-01-13	2743044	2016-01-13
2737977	2016-01-06	2743301	2016-01-13
2738106	2016-01-13	2743560	2016-01-13
2738146	2016-01-13	2743727	2016-01-06
2738628	2016-01-06	2744169	2016-01-13
2739160	2016-01-13	2744418	2016-01-06
2739535	2016-01-06	2744563	2016-01-13
2739832	2016-01-13	2744630	2016-01-06
2740554	2016-01-13	2744698	2016-01-13
2740604	2016-01-13	2745602	2016-01-13
2741456	2016-01-13	2746142	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2746804	2016-01-06	2753408	2016-01-13
2747489	2016-01-06	2753472	2016-01-06
2748550	2016-01-13	2753824	2016-01-06
2748579	2016-01-06	2754151	2016-01-06
2748625	2016-01-13	2754235	2016-01-06
2748653	2016-01-13	2754354	2016-01-13
2749001	2016-01-13	2754505	2016-01-06
2749978	2016-01-13	2754590	2016-01-13
2750519	2016-01-06	2754600	2016-01-06
2750766	2016-01-06	2754886	2016-01-06
2750799	2016-01-06	2754887	2016-01-06
2751365	2016-01-13	2755341	2016-01-06
2751428	2016-01-13	2755583	2016-01-13
2751992	2016-01-06	2755732	2016-01-13
2752363	2016-01-13	2755768	2016-01-06
2752761	2016-01-06	2755872	2016-01-13
2753100	2016-01-06	2756012	2016-01-13
2753211	2016-01-06	2756246	2016-01-06
2753217	2016-01-13	2756536	2016-01-06
2753370	2016-01-06	2756756	2016-01-06
2753381	2016-01-06	2756768	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2757001	2016-01-13	2759821	2016-01-06
2757047	2016-01-13	2759847	2016-01-06
2757729	2016-01-06	2760146	2016-01-13
2757827	2016-01-06	2760239	2016-01-06
2758208	2016-01-06	2760299	2016-01-06
2758254	2016-01-06	2760521	2016-01-06
2758277	2016-01-13	2760631	2016-01-06
2758455	2016-01-13	2760677	2016-01-13
2758645	2016-01-06	2760771	2016-01-06
2758684	2016-01-13	2760811	2016-01-06
2758874	2016-01-06	2761061	2016-01-13
2758915	2016-01-13	2761097	2016-01-13
2758985	2016-01-06	2761165	2016-01-06
2759236	2016-01-13	2761171	2016-01-13
2759482	2016-01-06	2761227	2016-01-13
2759506	2016-01-06	2761329	2016-01-13
2759570	2016-01-13	2761340	2016-01-13
2759573	2016-01-06	2761652	2016-01-13
2759665	2016-01-13	2761674	2016-01-06
2759797	2016-01-13	2761719	2016-01-06
2759816	2016-01-13	2761986	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2762318	2016-01-13	2766927	2016-01-13
2762436	2016-01-13	2766997	2016-01-06
2762917	2016-01-06	2767485	2016-01-13
2762918	2016-01-06	2767693	2016-01-13
2763885	2016-01-06	2767849	2016-01-06
2764806	2016-01-06	2768355	2016-01-13
2764956	2016-01-13	2768356	2016-01-13
2764970	2016-01-13	2768359	2016-01-06
2765079	2016-01-13	2768372	2016-01-13
2765083	2016-01-13	2768440	2016-01-06
2765170	2016-01-13	2768699	2016-01-13
2765229	2016-01-06	2768793	2016-01-13
2765886	2016-01-13	2768937	2016-01-13
2765970	2016-01-06	2769026	2016-01-13
2765972	2016-01-13	2769048	2016-01-06
2766103	2016-01-13	2769127	2016-01-06
2766204	2016-01-06	2769158	2016-01-13
2766276	2016-01-13	2769246	2016-01-06
2766660	2016-01-13	2769373	2016-01-13
2766773	2016-01-06	2769395	2016-01-06
2766825	2016-01-06	2769427	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2769434	2016-01-06	2772538	2016-01-13
2769454	2016-01-06	2772745	2016-01-13
2770229	2016-01-06	2772818	2016-01-06
2770714	2016-01-13	2773130	2016-01-13
2770878	2016-01-13	2773153	2016-01-13
2770895	2016-01-13	2773233	2016-01-13
2770946	2016-01-13	2773239	2016-01-13
2771094	2016-01-13	2773329	2016-01-13
2771099	2016-01-13	2773478	2016-01-06
2771147	2016-01-13	2773485	2016-01-13
2771181	2016-01-13	2773575	2016-01-13
2771251	2016-01-13	2773583	2016-01-06
2771261	2016-01-06	2773846	2016-01-06
2771535	2016-01-06	2773898	2016-01-06
2771554	2016-01-06	2774003	2016-01-13
2771636	2016-01-06	2774007	2016-01-06
2771896	2016-01-06	2774116	2016-01-13
2771918	2016-01-13	2774144	2016-01-06
2771958	2016-01-13	2774368	2016-01-06
2772452	2016-01-06	2774433	2016-01-06
2772461	2016-01-06	2774447	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2774576	2016-01-13
2775060	2016-01-06
2775080	2016-01-06
2775088	2016-01-13
2775116	2016-01-13
2775181	2016-01-13
2775895	2016-01-13
2776309	2016-01-13
2776364	2016-01-13
2776581	2016-01-06
2776723	2016-01-06
2776760	2016-01-06
2777060	2016-01-13
2777341	2016-01-06
2777455	2016-01-06
2777606	2016-01-13
2777709	2016-01-13
2777938	2016-01-06
2777992	2016-01-06
2778048	2016-01-13
2778060	2016-01-13
2778453	2016-01-13
2778746	2016-01-13
2778837	2016-01-13
2779211	2016-01-13
2779596	2016-01-06
2779966	2016-01-06
2780113	2016-01-06
2780201	2016-01-13
2780224	2016-01-13
2780247	2016-01-06
2780271	2016-01-13
2780330	2016-01-06
2780499	2016-01-06
2780614	2016-01-06
2780711	2016-01-06
2780748	2016-01-13
2780926	2016-01-06
2781013	2016-01-13
2781096	2016-01-06
2781331	2016-01-13
2781412	2016-01-13
2781648	2016-01-06
2781928	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2781973	2016-01-06	2786386	2016-01-06
2781978	2016-01-06	2786661	2016-01-13
2782529	2016-01-06	2786717	2016-01-13
2782637	2016-01-06	2787440	2016-01-06
2782677	2016-01-13	2787851	2016-01-06
2782731	2016-01-13	2788209	2016-01-06
2782770	2016-01-13	2788499	2016-01-13
2783437	2016-01-13	2789222	2016-01-06
2783443	2016-01-13	2789280	2016-01-06
2783504	2016-01-06	2789620	2016-01-13
2784114	2016-01-13	2789878	2016-01-13
2784160	2016-01-13	2789976	2016-01-13
2784358	2016-01-06	2790033	2016-01-06
2784431	2016-01-13	2790064	2016-01-06
2784979	2016-01-06	2790347	2016-01-06
2785225	2016-01-13	2790413	2016-01-13
2785436	2016-01-13	2790785	2016-01-13
2785465	2016-01-13	2791193	2016-01-13
2785680	2016-01-06	2791938	2016-01-13
2785717	2016-01-13	2792418	2016-01-13
2785916	2016-01-06	2792603	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2793397	2016-01-13	2802589	2016-01-06
2793549	2016-01-13	2802595	2016-01-06
2794386	2016-01-06	2802802	2016-01-06
2794537	2016-01-06	2802923	2016-01-06
2794995	2016-01-13	2803160	2016-01-06
2795099	2016-01-13	2803578	2016-01-13
2795880	2016-01-06	2803775	2016-01-06
2796065	2016-01-13	2804190	2016-01-06
2796884	2016-01-06	2804358	2016-01-13
2796927	2016-01-13	2804451	2016-01-06
2797790	2016-01-13	2804533	2016-01-06
2798978	2016-01-06	2804568	2016-01-13
2800158	2016-01-06	2804640	2016-01-13
2800591	2016-01-13	2804692	2016-01-13
2800699	2016-01-06	2805029	2016-01-06
2801324	2016-01-06	2805191	2016-01-06
2801393	2016-01-06	2805306	2016-01-06
2801599	2016-01-13	2805410	2016-01-06
2802521	2016-01-13	2805412	2016-01-13
2802550	2016-01-13	2805453	2016-01-06
2802569	2016-01-06	2805476	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2805646	2016-01-06	2809165	2016-01-06
2805899	2016-01-13	2809200	2016-01-13
2805902	2016-01-13	2809202	2016-01-06
2806446	2016-01-06	2809395	2016-01-13
2806841	2016-01-06	2809639	2016-01-13
2806925	2016-01-13	2809640	2016-01-13
2806938	2016-01-06	2809671	2016-01-13
2806952	2016-01-06	2809676	2016-01-13
2807051	2016-01-06	2810294	2016-01-13
2807079	2016-01-06	2810398	2016-01-13
2807279	2016-01-06	2811063	2016-01-06
2807366	2016-01-13	2811597	2016-01-06
2807407	2016-01-06	2811611	2016-01-06
2807743	2016-01-13	2811725	2016-01-06
2807832	2016-01-13	2811813	2016-01-06
2807866	2016-01-06	2811871	2016-01-13
2808112	2016-01-13	2811876	2016-01-06
2808191	2016-01-13	2812169	2016-01-06
2808296	2016-01-06	2812208	2016-01-06
2808443	2016-01-13	2812292	2016-01-13
2808444	2016-01-06	2812321	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2812604	2016-01-06	2817885	2016-01-13
2812836	2016-01-06	2817913	2016-01-06
2813010	2016-01-13	2818104	2016-01-06
2813259	2016-01-13	2818296	2016-01-06
2813351	2016-01-13	2818404	2016-01-13
2813448	2016-01-06	2818422	2016-01-13
2813662	2016-01-13	2818448	2016-01-06
2813856	2016-01-06	2819581	2016-01-06
2814225	2016-01-13	2819625	2016-01-06
2814832	2016-01-13	2819719	2016-01-06
2814899	2016-01-06	2819869	2016-01-06
2814957	2016-01-13	2820026	2016-01-13
2814978	2016-01-13	2820238	2016-01-13
2815630	2016-01-06	2820401	2016-01-06
2815728	2016-01-06	2820696	2016-01-13
2816169	2016-01-06	2820734	2016-01-13
2816409	2016-01-06	2821109	2016-01-13
2817411	2016-01-06	2821272	2016-01-13
2817451	2016-01-13	2821645	2016-01-06
2817537	2016-01-06	2821843	2016-01-13
2817590	2016-01-06	2822017	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2822117	2016-01-06	2828510	2016-01-13
2822119	2016-01-13	2828672	2016-01-13
2822388	2016-01-06	2828802	2016-01-13
2822391	2016-01-06	2828864	2016-01-06
2822465	2016-01-13	2828893	2016-01-06
2822470	2016-01-13	2829382	2016-01-06
2822888	2016-01-13	2829565	2016-01-13
2823370	2016-01-06	2830540	2016-01-13
2824023	2016-01-06	2830707	2016-01-13
2824871	2016-01-13	2830955	2016-01-13
2824946	2016-01-13	2830989	2016-01-06
2825389	2016-01-13	2831192	2016-01-13
2825500	2016-01-06	2831601	2016-01-13
2825582	2016-01-13	2832184	2016-01-13
2826153	2016-01-13	2832987	2016-01-06
2826304	2016-01-06	2833557	2016-01-13
2826511	2016-01-06	2833737	2016-01-06
2826952	2016-01-06	2833818	2016-01-13
2827720	2016-01-06	2833992	2016-01-13
2827799	2016-01-13	2834099	2016-01-13
2828336	2016-01-06	2834630	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2835076	2016-01-13	2840583	2016-01-06
2835398	2016-01-13	2841278	2016-01-13
2835463	2016-01-13	2841722	2016-01-13
2835767	2016-01-06	2843096	2016-01-13
2836111	2016-01-13	2843276	2016-01-06
2836244	2016-01-13	2843312	2016-01-13
2836403	2016-01-13	2843370	2016-01-06
2836809	2016-01-06	2844305	2016-01-06
2837096	2016-01-13	2844514	2016-01-13
2837517	2016-01-06	2844856	2016-01-13
2837540	2016-01-13	2845019	2016-01-06
2837541	2016-01-13	2845028	2016-01-13
2838128	2016-01-06	2845367	2016-01-06
2838503	2016-01-13	2845711	2016-01-06
2838815	2016-01-13	2845731	2016-01-13
2839047	2016-01-13	2845992	2016-01-13
2839516	2016-01-06	2847531	2016-01-13
2839517	2016-01-06	2848510	2016-01-06
2839573	2016-01-13	2848521	2016-01-13
2840027	2016-01-13	2849591	2016-01-06
2840183	2016-01-06	2849826	2016-01-13

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data	(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2850802	2016-01-06	2863273	2016-01-13
2852280	2016-01-13	2863597	2016-01-06
2852350	2016-01-13	2866002	2016-01-13
2852421	2016-01-06	2866069	2016-01-13
2852804	2016-01-06	2866591	2016-01-06
2853149	2016-01-13	2868284	2016-01-13
2853221	2016-01-13	2868860	2016-01-13
2853622	2016-01-13	2869463	2016-01-06
2855378	2016-01-13	2869973	2016-01-06
2855930	2016-01-13	2870424	2016-01-06
2856535	2016-01-06	2870513	2016-01-06
2857229	2016-01-06	2870638	2016-01-13
2858212	2016-01-06	2871313	2016-01-06
2859423	2016-01-06	2873060	2016-01-13
2859834	2016-01-13	2873241	2016-01-06
2860130	2016-01-06	2873258	2016-01-06
2860819	2016-01-06	2873775	2016-01-13
2862244	2016-01-13	2875724	2016-01-06
2862267	2016-01-13	2877367	2016-01-06
2862386	2016-01-13	2879157	2016-01-13
2862861	2016-01-06	2879425	2016-01-06

(11) EPO paskelbimo numeris	Pripažinimo negaliojančiu data
2884386	2016-01-13
2885056	2016-01-06
2887876	2016-01-06
2889212	2016-01-06
2891222	2016-01-06
2893545	2016-01-13
2899311	2016-01-13
2905150	2016-01-06
2912830	2016-01-06
2942376	2016-01-06

Papildomos apsaugos liudijimo pakeitimai, pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 37 straipsnį

(11) **C 0792290**
(21) PA 2004 005
(22) 2004-09-16
(95) Insulin detemir
(94) 2019-06-04

(11) **C 1140840**
(21) PA 2006 008
(22) 2006-12-18
(95) Sorafenibas ir farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos
(94) 2021-07-21

(11) **C 0973804**
(21) PA 2007 004
(22) 2007-04-04
(95) Ranibizumabum
(94) 2022-01-24

(11) **C 1372696**
(21) PA 2008 014
(22) 2008-11-04
(95) Abataceptum
(94) 2022-05-23

(11) **C 1109558**
(21) PA 2008 017
(22) 2008-12-03
(95) Ranolazinum
(94) 2023-07-14

(11) **C 1261606**
(21) PA 2008 018
(22) 2008-12-04
(95) Rivaroxabanum
(94) 2023-10-02

(11) **C 1124961**
(21) PA 2009 006
(22) 2009-07-29
(95) Romiplostimum
(94) 2024-02-06

(11) **C 1505066**
(21) PA 2011 001
(22) 2011-01-25
(95) Bilastinum
(94) 2025-09-28

(11) **C 1893612**
(21) PA 2012 010
(22) 2012-06-26
(95) Vemurafenibum
(94) 2027-02-21

(11) **C 1920764**
(21) PA 2012 017
(22) 2012-09-20
(95) Travoprostum
(94) 2016-11-29

(11) **C 1966202**
(21) PA 2013 002
(22) 2013-01-09
(95) Ruxolitinibum
(94) 2027-08-28

(11) **C 1667986**
(21) PA 2013 010
(22) 2013-05-15
(95) Cabazitaxelum
(94) 2026-03-22

(11) **C 1564210**
(21) PA 2013 018
(22) 2013-07-12
(95) Elvitegravirum
(94) 2028-05-27

(11) **C 1427444**
(21) PA 2014 002
(22) 2014-01-02
(95) Inaktyvintas VM-2 padermės Vakarų Nilo virusas
(94) 2023-11-25

SISTEMINĖ EUROPOS PATENTŲ RODYKLĖ

(51)	(11)
A01J 11/04	2522411
A01K 3/00	2896768
A01N 43/62	2154969
A21D 13/00	2826375
A24B 15/00	1555898
A24B 15/28	1555898
A24D 3/04	2775869
A24D 3/04	2814341
A24F 47/00	1555898
A24F 47/00	2814341
A24F 47/00	2814343
A47F 1/035	2488425
A47F 1/08	2488425
A61B 10/00	1903946
A61B 10/02	1903946
A61C 8/00	2561825
A61C 13/263	2561825
A61F 9/007	2648664
A61F 13/15	2305862
A61K 9/00	1930002
A61K 9/00	2501384
A61K 9/00	2763684
A61K 9/107	1930002
A61K 9/14	2763684
A61K 9/16	2281555

(51)	(11)
A61K 9/16	2763684
A61K 9/20	2281555
A61K 9/22	2281555
A61K 9/46	1930002
A61K 9/48	2281555
A61K 31/00	2651419
A61K 31/145	2651419
A61K 31/185	2485724
A61K 31/215	1930002
A61K 31/216	1930002
A61K 31/335	2070530
A61K 31/365	2070530
A61K 31/40	2308838
A61K 31/415	2254870
A61K 31/4155	2308838
A61K 31/4155	2545045
A61K 31/416	2262777
A61K 31/4178	2308838
A61K 31/422	2308838
A61K 31/4245	2076501
A61K 31/4245	2308838
A61K 31/427	2308838
A61K 31/435	2262777
A61K 31/437	2349260
A61K 31/437	2545045

(51)	(11)
A61K 31/437	2576547
A61K 31/4439	2308838
A61K 31/4468	2545045
A61K 31/4725	2729460
A61K 31/485	2281555
A61K 31/505	2606034
A61K 31/506	2501384
A61K 31/506	2558457
A61K 31/506	2822939
A61K 31/517	2812323
A61K 31/519	2349260
A61K 31/519	2451299
A61K 31/519	2585467
A61K 31/53	2780332
A61K 31/55	2585467
A61K 31/551	2585467
A61K 31/593	2451299
A61K 31/7036	2651419
A61K 31/7048	2070530
A61K 31/7048	2678349
A61K 31/7088	2602322
A61K 31/7125	2612917
A61K 31/714	2451299
A61K 33/06	2451299
A61K 33/26	2451299
A61K 33/44	2763684
A61K 38/47	2154969
A61K 38/48	2154969

(51)	(11)
A61K 39/04	2651437
A61K 39/395	2158315
A61K 39/395	2215121
A61K 39/40	2395018
A61K 45/06	2070530
A61K 45/06	2451299
A61K 48/00	2154969
A61K 48/00	2602322
A61L 15/26	2305862
A61L 15/60	2305862
A61L 15/62	2305862
A61M 1/00	2648664
A61M 3/00	2763684
A61M 3/02	2763684
A61M 37/00	2699304
A61P 1/12	2070530
A61P 1/16	2451299
A61P 1/16	2847210
A61P 3/06	2308838
A61P 3/10	2262777
A61P 3/10	2308838
A61P 3/10	2485724
A61P 5/14	2451299
A61P 7/06	2451299
A61P 9/00	2262777
A61P 9/00	2576547
A61P 9/00	2729460
A61P 9/00	2822939

(51)	(11)
A61P 9/02	2847210
A61P 9/10	2308838
A61P 11/00	2585467
A61P 13/00	2254870
A61P 13/00	2262777
A61P 15/00	2576547
A61P 25/00	2254870
A61P 25/00	2812323
A61P 25/18	2558457
A61P 27/00	2349260
A61P 29/00	2254870
A61P 29/00	2545045
A61P 29/00	2812323
A61P 31/04	2395018
A61P 31/04	2678349
A61P 35/00	2215121
A61P 35/00	2501384
A61P 35/00	2606034
A61P 35/00	2780332
A61P 35/00	2812323
A61P 43/00	2451299
A61P 43/00	2763684
A61Q 13/00	2775869
B01D 19/00	2522411
B01D 19/02	2522411
B01L 3/00	2790020
B08B 9/00	2539086
B31F 1/12	2610051

(51)	(11)
B32B 15/01	2808426
B41M 3/00	2373490
B41M 5/28	2373490
B60L 11/18	1646526
B61D 15/06	2792570
B61D 17/06	2792570
B61F 19/04	2792570
B65B 7/28	2889224
B65B 29/02	2889224
B65D 19/00	2722285
B65D 19/40	2722285
B65D 71/06	2164770
B65D 79/02	2373490
B65D 83/00	2488425
B65D 85/804	2889224
B66C 1/10	2807107
B66D 1/74	2592038
B66D 1/74	2592039
C07D 207/34	2308838
C07D 231/14	2814813
C07D 231/54	2262777
C07D 231/56	2254870
C07D 233/88	2606034
C07D 239/69	2501384
C07D 239/95	2812323
C07D 253/08	2780332
C07D 271/06	2076501
C07D 401/04	2558457

(51)	(11)
C07D 401/04	2606034
C07D 401/04	2812323
C07D 401/06	2780332
C07D 401/12	2262777
C07D 401/12	2606034
C07D 401/12	2729460
C07D 401/12	2812323
C07D 401/14	2545045
C07D 401/14	2558457
C07D 401/14	2606034
C07D 401/14	2780332
C07D 403/04	2558457
C07D 403/04	2822939
C07D 403/12	2308838
C07D 403/12	2812323
C07D 403/14	2606034
C07D 405/14	2545045
C07D 409/14	2780332
C07D 413/04	2558457
C07D 413/12	2308838
C07D 413/14	2308838
C07D 413/14	2558457
C07D 413/14	2606034
C07D 417/12	2308838
C07D 417/14	2780332
C07D 451/00	2831068
C07D 451/10	2831068
C07D 471/04	2576547
C07D 471/04	2780332
C07D 487/04	2585467
C07D 487/04	2780332
C07D 495/04	2585467
C07D 498/04	2558457
C07D 513/04	2585467
C07F 7/18	2780332
C07H 17/08	2678349
C07K 16/00	2158315
C07K 16/12	2395018
C07K 16/30	2215121
C12N 1/20	2647717
C12N 1/21	2695943
C12N 5/09	2790020
C12N 5/10	2313495
C12N 9/22	2456886
C12N 9/92	2313495
C12N 15/09	2158315
C12N 15/11	2602322
C12N 15/11	2612917
C12N 15/113	2612917
C12N 15/13	2158315
C12N 15/13	2395018
C12N 15/70	2695943
C12N 15/73	2695943
C12N 15/81	2313495
C12P 5/02	2647717
C12P 7/04	2647717

(51)	(11)
C12P 7/10	2313495
C12P 19/02	2647717
C12P 19/24	2313495
C12P 21/02	2695943
C12Q 1/24	2790020
C12Q 1/68	2456886
C12R 1/645	2313495
C25D 5/10	2808426
C25D 5/36	2808426
C25D 5/48	2808426
C25D 5/50	2808426
C25D 7/06	2808426
D01F 8/06	2305862
D21F 11/00	2610051
E01B 25/28	2191070
E04B 1/70	2823235
E04H 17/14	2896768
E05B 17/20	2401456
E05B 25/00	2453084
E05D 11/06	2785940
E05F 1/12	2785940
E05F 3/12	2785940
E05F 3/20	2785940
F02M 25/00	2539086
F02M 35/10	2539086
F03D 1/00	2807107
F21K 99/00	2553314
F21Y 111/00	2553314

(51)	(11)
F24F 13/22	2823235
F25J 5/00	2818821
F28D 7/02	2818821
F28F 9/02	2818821
G01F 1/69	2299855
G01F 1/696	2299855
G01F 1/698	2299855
G01N 15/02	2790020
G01N 33/49	2790020
G01N 33/574	2790020
G07F 11/50	2488425
G09F 3/00	2373490
G10K 15/04	2699304
H01H 1/54	2752862
H01H 50/44	2752862
H01H 50/54	2752862
H01S 3/03	2835881
H01S 3/06	2835881
H01S 3/08	2835881
H01S 3/23	2835881
H01S 5/34	2511995

NUMERINĖ EUROPOS PATENTŲ RODYKLĖ

(11)	(51)
1555898	A24B 15/00
1555898	A24B 15/28
1555898	A24F 47/00
1646526	B60L 11/18
1903946	A61B 10/02
1903946	A61B 10/00
1930002	A61K 9/46
1930002	A61K 9/00
1930002	A61K 9/107
1930002	A61K 31/215
1930002	A61K 31/216
2070530	A61K 31/335
2070530	A61K 31/7048
2070530	A61K 31/365
2070530	A61P 1/12
2070530	A61K 45/06
2076501	C07D 271/06
2076501	A61K 31/4245
2154969	A01N 43/62
2154969	A61K 48/00
2154969	A61K 38/47
2154969	A61K 38/48
2158315	C12N 15/09
2158315	A61K 39/395
2158315	C12N 15/13
2158315	C07K 16/00
2164770	B65D 71/06
2191070	E01B 25/28
2215121	C07K 16/30
2215121	A61K 39/395
2215121	A61P 35/00
2254870	C07D 231/56
2254870	A61K 31/415
2254870	A61P 13/00
2254870	A61P 25/00
2254870	A61P 29/00
2262777	C07D 231/54
2262777	C07D 401/12
2262777	A61K 31/416
2262777	A61K 31/435
2262777	A61P 3/10
2262777	A61P 9/00
2262777	A61P 13/00
2281555	A61K 9/20
2281555	A61K 9/16
2281555	A61K 9/48
2281555	A61K 31/485
2281555	A61K 9/22
2299855	G01F 1/69
2299855	G01F 1/696

(11)	(51)
2299855	G01F 1/698
2305862	A61L 15/62
2305862	D01F 8/06
2305862	A61F 13/15
2305862	A61L 15/60
2305862	A61L 15/26
2308838	C07D 207/34
2308838	C07D 403/12
2308838	C07D 413/12
2308838	C07D 413/14
2308838	C07D 417/12
2308838	A61K 31/40
2308838	A61K 31/4155
2308838	A61K 31/4178
2308838	A61K 31/422
2308838	A61K 31/4245
2308838	A61K 31/427
2308838	A61K 31/4439
2308838	A61P 3/06
2308838	A61P 3/10
2308838	A61P 9/10
2313495	C12N 5/10
2313495	C12N 15/81
2313495	C12P 7/10
2313495	C12R 1/645
2313495	C12N 9/92
2313495	C12P 19/24
2349260	A61K 31/437
2349260	A61K 31/519
2349260	A61P 27/00
2373490	B41M 3/00
2373490	B41M 5/28
2373490	G09F 3/00
2373490	B65D 79/02
2395018	C07K 16/12
2395018	C12N 15/13
2395018	A61K 39/40
2395018	A61P 31/04
2401456	E05B 17/20
2451299	A61K 31/519
2451299	A61K 31/593
2451299	A61K 31/714
2451299	A61K 33/06
2451299	A61K 33/26
2451299	A61K 45/06
2451299	A61P 5/14
2451299	A61P 7/06
2451299	A61P 1/16
2451299	A61P 43/00
2453084	E05B 25/00
2456886	C12Q 1/68
2456886	C12N 9/22
2485724	A61K 31/185
2485724	A61P 3/10
2488425	B65D 83/00
2488425	A47F 1/035

(11)	(51)
2488425	A47F 1/08
2488425	G07F 11/50
2501384	A61K 31/506
2501384	A61P 35/00
2501384	A61K 9/00
2501384	C07D 239/69
2511995	H01S 5/34
2522411	B01D 19/00
2522411	B01D 19/02
2522411	A01J 11/04
2539086	B08B 9/00
2539086	F02M 35/10
2539086	F02M 25/00
2545045	C07D 401/14
2545045	C07D 405/14
2545045	A61K 31/4155
2545045	A61K 31/437
2545045	A61K 31/4468
2545045	A61P 29/00
2553314	F21K 99/00
2553314	F21Y 111/00
2558457	C07D 401/04
2558457	C07D 401/14
2558457	C07D 403/04
2558457	C07D 413/04
2558457	C07D 413/14
2558457	C07D 498/04
2558457	A61K 31/506
2558457	A61P 25/18
2561825	A61C 8/00
2561825	A61C 13/263
2576547	C07D 471/04
2576547	A61K 31/437
2576547	A61P 9/00
2576547	A61P 15/00
2585467	C07D 487/04
2585467	C07D 495/04
2585467	C07D 513/04
2585467	A61K 31/519
2585467	A61K 31/55
2585467	A61K 31/551
2585467	A61P 11/00
2592038	B66D 1/74
2592039	B66D 1/74
2602322	C12N 15/11
2602322	A61K 48/00
2602322	A61K 31/7088
2606034	C07D 233/88
2606034	C07D 401/04
2606034	C07D 401/12
2606034	C07D 401/14
2606034	C07D 403/14
2606034	C07D 413/14
2606034	A61K 31/505
2606034	A61P 35/00
2610051	D21F 11/00

(11)	(51)
2610051	B31F 1/12
2612917	C12N 15/113
2612917	A61K 31/7125
2612917	C12N 15/11
2647717	C12P 19/02
2647717	C12P 5/02
2647717	C12P 7/04
2647717	C12N 1/20
2648664	A61F 9/007
2648664	A61M 1/00
2651419	A61K 31/7036
2651419	A61K 31/145
2651419	A61K 31/00
2651437	A61K 39/04
2678349	C07H 17/08
2678349	A61K 31/7048
2678349	A61P 31/04
2695943	C12N 15/70
2695943	C12N 15/73
2695943	C12N 1/21
2695943	C12P 21/02
2699304	A61M 37/00
2699304	G10K 15/04
2722285	B65D 19/40
2722285	B65D 19/00
2729460	C07D 401/12
2729460	A61K 31/4725
2729460	A61P 9/00
2752862	H01H 1/54
2752862	H01H 50/44
2752862	H01H 50/54
2763684	A61K 33/44
2763684	A61P 43/00
2763684	A61K 9/00
2763684	A61K 9/14
2763684	A61K 9/16
2763684	A61M 3/02
2763684	A61M 3/00
2775869	A24D 3/04
2775869	A61Q 13/00
2780332	C07D 253/08
2780332	C07D 401/06
2780332	C07D 401/14
2780332	C07D 409/14
2780332	C07D 417/14
2780332	C07D 471/04
2780332	C07D 487/04
2780332	C07F 7/18
2780332	A61K 31/53
2780332	A61P 35/00
2785940	E05D 11/06
2785940	E05F 1/12
2785940	E05F 3/20
2785940	E05F 3/12
2790020	G01N 33/574
2790020	B01L 3/00

(11)	(51)
2790020	G01N 15/02
2790020	C12Q 1/24
2790020	G01N 33/49
2790020	C12N 5/09
2792570	B61F 19/04
2792570	B61D 15/06
2792570	B61D 17/06
2807107	B66C 1/10
2807107	F03D 1/00
2808426	C25D 5/10
2808426	C25D 5/36
2808426	C25D 5/50
2808426	C25D 7/06
2808426	B32B 15/01
2808426	C25D 5/48
2812323	C07D 403/12
2812323	C07D 401/04
2812323	C07D 401/12
2812323	C07D 239/95
2812323	A61K 31/517
2812323	A61P 35/00
2812323	A61P 29/00
2812323	A61P 25/00
2814341	A24D 3/04
2814341	A24F 47/00
2814343	A24F 47/00
2814813	C07D 231/14
2818821	F28F 9/02

(11)	(51)
2818821	F25J 5/00
2818821	F28D 7/02
2822939	C07D 403/04
2822939	A61K 31/506
2822939	A61P 9/00
2823235	F24F 13/22
2823235	E04B 1/70
2826375	A21D 13/00
2831068	C07D 451/10
2831068	C07D 451/00
2835881	H01S 3/23
2835881	H01S 3/06
2835881	H01S 3/03
2835881	H01S 3/08
2847210	A61P 1/16
2847210	A61P 9/02
2889224	B65B 29/02
2889224	B65B 7/28
2889224	B65D 85/804
2896768	E04H 17/14
2896768	A01K 3/00

TARPTAUTINĖS PATENTŲ KLASIFIKACIJOS SKYRIŲ SĄRAŠAS

A skyrius – Žmogaus poreikių tenkinimas.

B skyrius – Įvairūs technologiniai procesai, transportavimas.

C skyrius – Chemija, metalurgija.

D skyrius – Tekstilė, popierius.

E skyrius – Statyba, kalnakasyba.

F skyrius – Mechanika; apšvietimas; šildymas; ginklai; sprogdinimo darbai.

G skyrius – Fizika.

H skyrius – Elektra.

LIETUVOS RESPUBLIKOS VALSTYBINIO PATENTŲ BIURO
OFICIALUS BIULETENIS
2016 m. Nr. 9, 1 dalis „Išradimai“
Lietuvos Respublikos valstybinis patentų biuras,
Kalvarijų g. 3, LT-09310 Vilnius