ISSN 2029-2309
(online)

# LIETUVOS RESPUBLIKOS VALSTYBINIO PATENTŲ BIURO OFICIALUS BIULETENIS

2016/11, 2016-06-10

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

## IŠRADIMAI / INVENTIONS

Paraiškos / Applications - 2014 127 - 2015 100
Patentai / Patents - 6274

11 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 ..... 15

MM9A Panaikinti patentai ..... 17

MK9A Baigę galioti patentai ..... 18

Vardinė rodyklė ..... 19

Sisteminė rodyklė ..... 21

Numerinė išradimų rodyklė ..... 22

Numerinė paraiškų rodyklė ..... 23

EUROPOS PATENTAI ..... 24

FG9D Paskelbti patentai ..... 24

FG4D Paskelbti patentai ..... 46

PC9D Patento perleidimas ..... 242

PD9D, DC9D, TH9A Patento pakeitimai ..... 246

MM9D Išplėtimo panaikinimas ..... 250

MG9D Išplėtimo pripažinimas negaliojančiu ..... 251

MF9D Išplėtimo pripažinimas negaliojančiu ..... 252

MK9D Baigę galioti patentai ..... 253

MM4D Panaikinti patentai ..... 254

MG4D Patentai pripažinti negaliojančiais ..... 255

ND9D Papildomos apsaugos liudijimai ..... 300

TK9D Atitaisymai ..... 304

Sisteminė patentų rodyklė ..... 305

Numerinė patentų rodyklė ..... 313

Klasifikacijos skyriai ..... 321

* *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

**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,<br>Jogailos g. 4, Vilnius, LT-01116<br>tel. +370 5 272 39 24, +370 687 85880 faks. +370 5 272 39 24<br>emt@takas.lt |
| **49.** Vytautas Einoris | Gerbutavičiaus g. 1/42-155, LT-04318 Vilnius<br>tel. +370 5 245 19 87 faks. +370 5 274 50 43<br>einavytas@hotmail.com |
| **50.** Aušra Pakėnienė | AAA Law, J.Jasinskio 16 A, LT-03163 Vilnius<br>tel. +370 5 252 66 76 faks. +370 5 252 66 70<br>a.pakeniene@AAALaw.EU |
| **51.** Jurga Petniūnaitė | AAA Law, J.Jasinskio 16 A, LT-03163 Vilnius<br>tel. +370 5 252 66 76 faks. +370 5 252 66 70<br>j.petniunaite@AAALaw.EU |
| **52.** Jelena Gerasimovič | IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“,<br>Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius<br>tel. +370 5 231 08 27 faks. +370 5 231 05 93<br>info@gerasimovic.com |
| **53.** Malvina Milda Pranskevičienė | IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“,<br>Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius tel. +370 5 231 08 27 faks. +370 5 231 05 93<br>info@gerasimovic.com |
| **54.** Gediminas Pranevičius | Advokatų kontora VARUL, Konstitucijos pr. 7, LT-09308 Vilnius<br>tel. +370 5 248 73 37 faks. +370 5 248 73 38<br>gediminas.pranevicius@ipforma.lt |
| **55.** Vitalija Banaitienė | UAB TARPINĖ, p.o. box 1202, LT-01007, A.P.Kavoliuko g. 24-152, LT-04328 Vilnius<br>tel. +370 5 230 56 52, +370 699 02 023 faks. +370 5 248 97 37<br>banaitiene@tarpine.lt |
| **56.** Vilija Viešūnaitė | Advokatų profesinė bendrija „TRINITI LT“,<br>L. Stuokos-Gucevičiaus g. 9, LT-01122 Vilnius<br>tel. +370 5 231 22 11, +370 687 48 149 faks. +370 5 231 22 44<br>vilija.viesunaite@triniti.lt |
| **57.** Gvidas Urbonas | K. Donelaičio g. 33-101, LT-44240 Kaunas<br>tel. +370 37 324 432, +370 698 83 666 faks. +370 37 208 930<br>gvidasu@one.lt |
| **58.** Birutė Dauderienė | Advokatės Redos Žabolienės kontora METIDA,<br>Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius tel. +370 5 249 08 30 faks. +370 5 249 08 33<br>birute.dauderiene@metida.lt |
| **59.** Inga Lukauskienė | Advokatės Redos Žabolienės kontora METIDA,<br>Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius tel. +370 5 249 08 30 faks. +370 5 249 08 33<br>inga.lukauskiene@metida.lt |
| **60.** Lina Meškauskienė | Advokatės Meškauskienės kontora,<br>Pylimo g. 19, LT-01141 Vilnius tel. +370 5 272 17 17 faks. +370 5 272 19 84<br>lina.meskauskiene@akmp.lt, info@akmp.lt |
| **61.** Edita Ivanauskienė | Advokatės Editos Ivanauskienės kontora,<br>Vokiečių g. 7-2, LT-01130 Vilnius, Lietuva<br>tel. +370 5 277 77 04, +370 686 11 584 faks. +370 5 277 77 04<br>edita_ivanauskiene@yahoo.com, edita.ivanauskiene@eiip.lt |
| **62.** Tomas Jakubauskas | Advokatų kontora Eversheds Saladžius,<br>Jasinskio g. 16B, LT-01112 Vilnius<br>tel. +370 5 239 2391 faks. +370 5 239 2390<br>tomas.jakubauskas@eversheds.lt |
| **63.** Valters Gencs | A. Tumėno g. 4, LT-01109, Vilnius, Lietuva,<br>Kr. Valdemara g. 21, LV-1010, Riga, Latvija<br>tel. +370 5 261 1000, +371 6 724 0090 faks. +370 5 261 1100, +371 6 724 0091<br>gencs.valters@gencs.eu |
| **64.** Evaldas Pabrėža | UAB “IAM consultants”,<br>Kalvarijų g. 125 B, LT-08221 Vilnius<br>tel. +370 683 78384<br>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): **A61F 5/00**
*(21)* **2015 027**
*(13)* **A**
*(22)* 2015-04-22
*(30)* CN20140396353.8, 2014-08-13, CN
*(71)* Shaodun HE, Room 603, Building No. 12, Honeylake, Holiday Resort Residential Quarter, Xiangmei RD., Futian, Shenzhen, Guangdong 518034, CN
*(72)* Shaodun HE, CN
*(74)* Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija “Žabolienė ir partneriai METIDA”, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
*(54)* Automatiškai ištraukiamos lovos valdymo metodas
*(57)* Pirmojo mikrokompiuteriu valdomos lovos traukimo proceso metu, traukimo jėga, kurią atlaikytų žmogaus kūnas, yra nustatyta traukimo jėga. Kiekvieno traukimo ciklo metu traukimo jėgos yra vienodos. Tokiu būdu gali įvykti traukimo jėgos konfliktas, irnaudotojas jaustų nedidelį trūkčiojimą prasidėjus antrajam traukimo jėgos procesui. Siekiant pašalinti šiuos trūkumus, šios automatiškai ištraukiamos lovos valdymui taikytinas progresyvusis metodas. Traukimo jėga yra didinama laipsniškai kol galiausiai pasiekia nustatytą traukimo jėgą. Naudojant mikrokompiuteriu valdomą ištraukiamą lovą, tai padeda efektyviai pašalinti esamą trūkumą.
Apibrėžties punktai: 5, brėžiniai: 0.

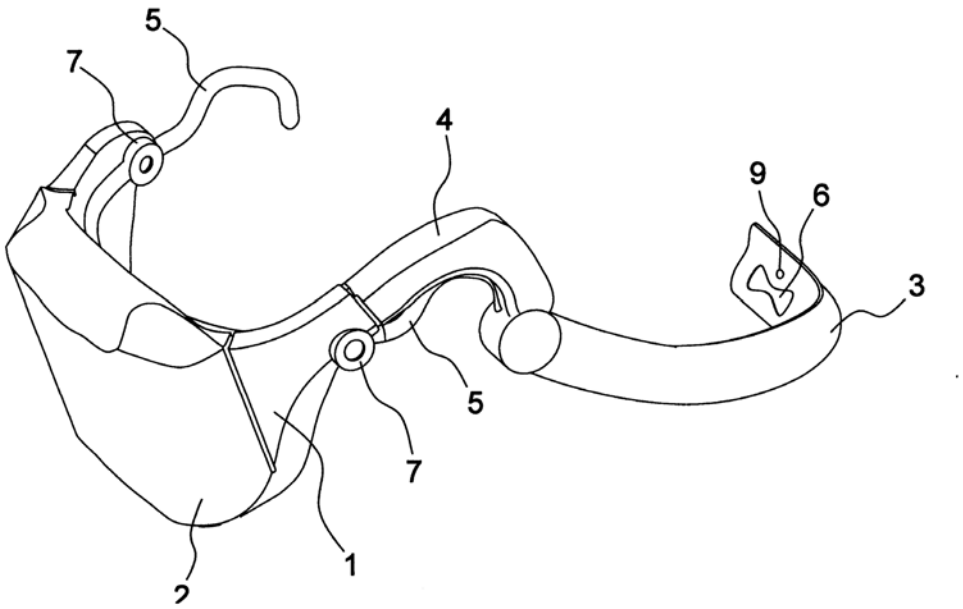
---

*(51)* Int. Cl. (2016.01): **A61F 5/00**
*(21)* **2015 035**
*(13)* **A**
*(22)* 2015-05-06
*(30)* CN201410709607., 2014-11-28, CN
*(71)* Shaodun HE, Room 603, Building No. 12, Honeylake, Holiday Resort Residential Quarter, Xiangmei RD., Futian, Shenzhen, Guangdong 518034, CN
*(72)* Shaodun HE, CN
*(74)* Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija “Žabolienė ir partneriai METIDA”, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
*(54)* Automatiškai ištraukiamos lovos valdymo metodas
*(57)* Automatiškai ištraukiamos lovos valdymo metodas. Pirmojo mikrokompiuteriu valdomos lovos traukimo proceso metu, traukimo jėga, kurią atlaikytų žmogaus kūnas, yra nustatyta traukimo jėga. Kiekvieno traukimo ciklo metu traukimo jėgos yra vienodos. Tokiu būdu gali įvykti traukimo jėgos konfliktas, ir naudotojas jaustų nedidelį trūkčiojimą prasidėjus antrajam traukimo jėgos procesui. Siekiant pašalinti šiuos trūkumus, šios automatiškai ištraukiamos lovos valdymui taikytinas progresyvusis metodas. Traukimo jėga yra didinama laipsniškai kol galiausiai pasiekia nustatytą traukimo jėgą. Naudojant mikrokompiuteriu valdomą ištraukiamą lovą, tai padeda efektyviai pašalinti esamą trūkumą.
Apibrėžties punktai: 7, brėžiniai: 0.

---

*(51)* Int. Cl. (2016.01): **A62B 7/00**
*(21)* **2014 127**
*(13)* **A**
*(22)* 2014-10-30
*(71)* Erikas KNEIŽYS, Vytauto g. 31-1, LT-59124 Prienai, LT
*(72)* Erikas KNEIŽYS, LT
*(54)* Nešiojamas aktyvus kvėpavimo takų apsaugos prietaisas
*(57)* Nešiojamas aktyvus kvėpavimo takų apsaugos prietaisas, susidedantis iš korpuso (1), oro filtro (2), oro slėgio sudarymo įrenginio, akumuliatoriaus, valdymo elektronikos, į ausis besiremiančio tvirtinimo lankelio (5), oro

perdavimo ortakio (4) ir lenkto oro padavimo vamzdelio (3), kurio gale yra bent viena anga (6) filtruotam orui išpūsti link varotojo nosies ar burnos.Prietaisas, minimaliai dengdamas veidą, suteikia vartotojui filtruoto oro tėkmę ir taip didžiąja dalimi apsaugo jį nuo aplinkinės oro taršos. Kadangi prietaisas neapsunkina kvėpavimo, jis tinkamas atliekant fizinę veiklą. Taip pat, prietaisas turi elektroninį slėgio jutiklį (9), pagal kurio parodymus valdymo elektronika nustato vartotojo kvėpavimo ciklą ir nutraukia oro tiekimą vartotojui iškvėpiant, taip tausodamas akumuliatoriaus energiją.



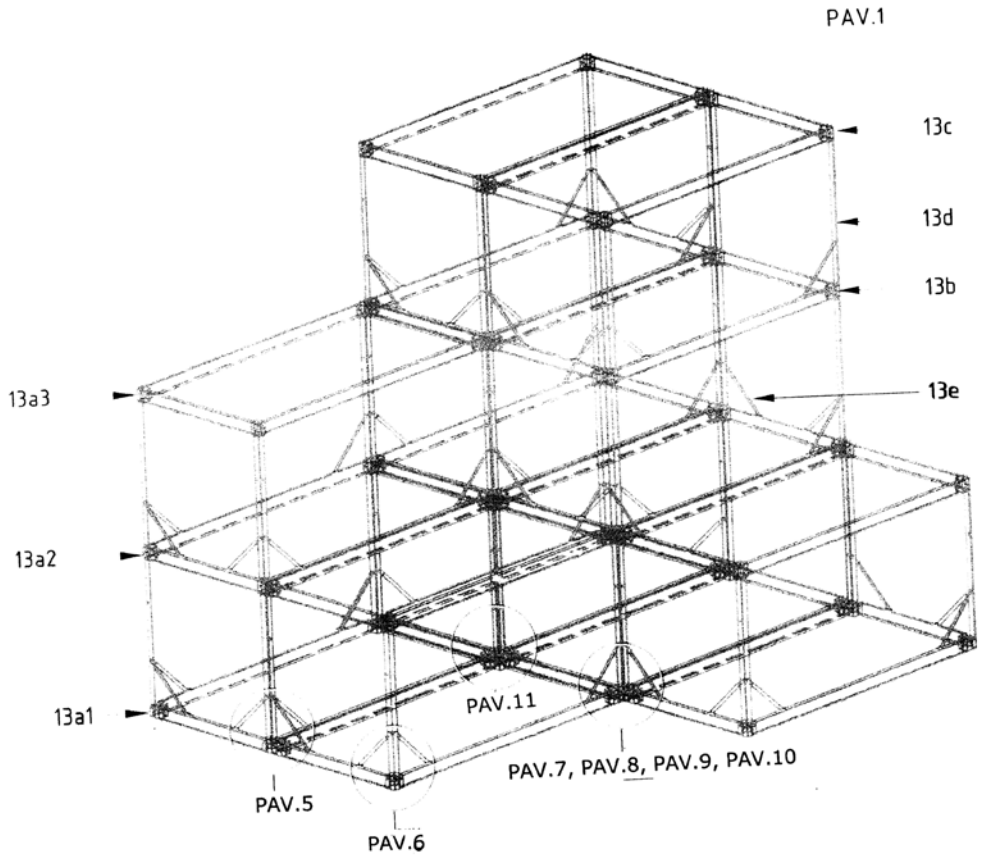

Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 2.

---

*(51)* Int. Cl. (2016.01): **C04B 38/00**
*(21)* **2015 100**
*(13)* **A**
*(22)* 2015-12-02
*(71)* Vilniaus Gedimino technikos universitetas, Saulėtekio al. 11, 10223 Vilnius, LT
UAB “Elnet Group”, Užpalių g. 37, LT-08400 Vilnius, LT
*(72)* Marijonas SINICA, LT
Ridas ČIRVINSKAS, LT
Jurga ŠEPUTYTĖ-JUCIKĖ, LT
Modestas KLIGYS, LT
Ina PUNDIENĖ, LT
*(74)* Ramunė GARŠVIENĖ, 30, Dūkštų g. 28-20, LT-07171 Vilnius, LT
*(54)* Termoizoliacinio statybinio elemento kompozicija ir gamybos būdas
*(57)* Išradimas priklauso statybos sričiai, tiksliau, akytiems statybiniams produktams, būtent termoizoliacinių statybinių elementų kompozicijoms ir jų gamybos būdams. Termoizoliacinio statybinio elemento kompozicija, kuri talpina cementą, orą įtraukiančią medžiagą, polistireninio putplasčio granules ir vandenį, dar papildomai apima porėtas granules su standžiu kevalu, kurios yra stambios frakcijos, o taip pat smulkios frakcijos porėtas granules, parinktas iš polistireninio putplasčio granulių ar iš smulkios frakcijos porėtų granulių su standžiu kevalu, esant komponentų santykiui, masės %: cementas - 28-48, orą įtraukianti medžiaga - 0,01-0,03, stambios frakcijos porėtos granulės su standžiu kevalu - 30-48, smulkios frakcijos porėtos granulės - 08-25, vanduo – likęs. Termoizoliacinio statybinio elemento gamybos būdas, kuriame termoizoliacinio statybinio elemento kompoziciją išmaišo uždaroje maišyklėje ir supila į formą, termoizoliacinio statybinio elemento gamybai naudoja pareikštą kompoziciją, o ją supylus į formą, išlygina supiltos į formą kompozicijos paviršių, po to vibruojančiai iš viršaus spaudžia tam, kad sutankintų struktūrą, ir išlaiko paminėtoje formoje bent parą.
Apibrėžties punktai: 6, brėžiniai: 0.

---

*(51)* Int. Cl. (2016.01): **E04B 1/00**
*(21)* **2014 137**
*(13)* **A**
*(22)* 2014-12-03
*(71)* Nordland Corporation, 8 Copthall, Roseau Valley 00152, Commonwealth of Dominica, DM
*(72)* Daniel ANDERSEN, LT
*(74)* Stanislava TELEIŠIENĖ, 31, UAB “Brainera”, Savanorių pr. 217, LT-02300 Vilnius, LT
*(54)* Plieninio karkaso sistema ir surinkimo būdas
*(57)* Plieninio karkaso sistema, sudaryta iš tarpusavyje sujungtų horizontalių elementų, kurie yra mažiausiai trijų formų (grindų, perdangos, lubų) rėmai (13a) su skersinėmis lygiagrečiomis sijomis (11), plieninių vertikalių elementų, kurie yra vieno aukšto kolonos (13b), sudarančios įvairių profilių kolonų rinkinį (13b1-13b7). Plieninis horizontalus rėmas (13a) yra lovinio profilio, o skersinės sijos (11) rėme įstatytos per garsą izoliuojančius laikiklius (12b) su garso izoliacijos tarpine (8) ir besilaikančios rėme (13a) dėl savo masės ir trinties. Sistema turi šonines standumo sijas (13c), jungiančias horizontalius rėmus (13a) su kolonomis (13b). Išorinė sienos panelė (1) pritvirtinta prie plieninio horizontalaus rėmo (13a), prie kurio per garso izoliacinį fiksatorių (12a), grindų arba lubų plokštę (10a, 10b) ir per du L formos laikiklius (14) taip pat pritvirtinta vidinė garsą izoliuojanti panelė (3). Vidinės sienos, šioje sistemoje, sumontuotos taip, kad neturi jokio tiesioginio kontakto su pagrindine laikančiąja konstrukcija.



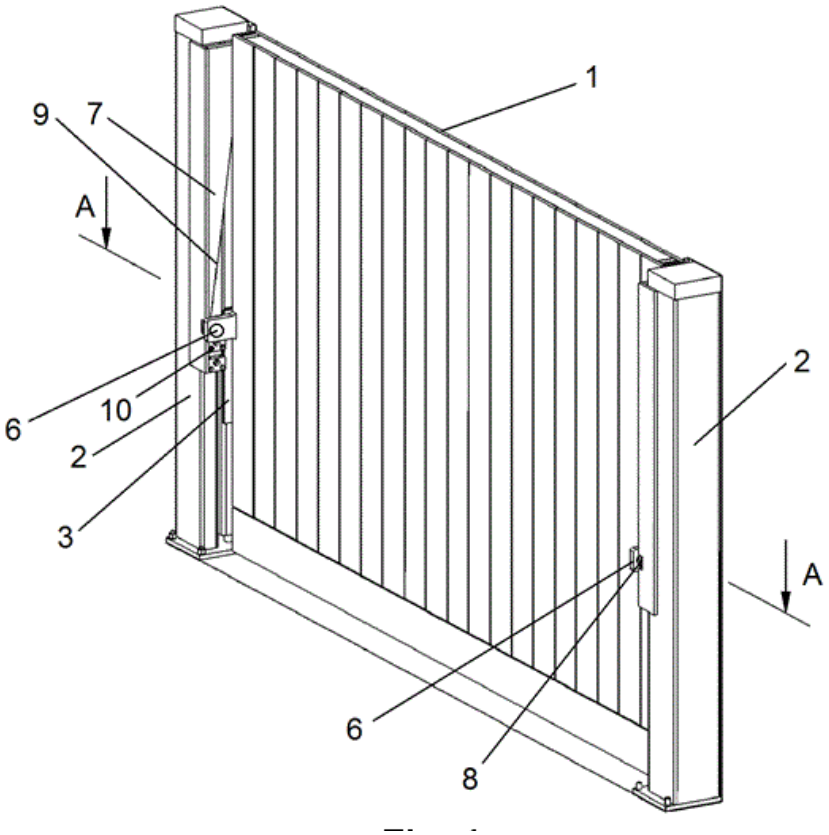

Apibrėžties punktai: 6, brėžiniai: 14.

---

*(51)* Int. Cl. (2016.01): **E05F 15/00**
*(21)* **2014 512**
*(13)* **A**
*(22)* 2014-12-08
*(71)* Remigijus GUOBYS, 4 Repton Green, St. Albans, AL3 6RT, Hertfordshire, GB
*(72)* Remigijus GUOBYS, GB
*(74)* Gediminas PRANEVIČIUS, 54, Advokatų kontora VARUL, Konstitucijos pr. 7, LT-09308 Vilnius, LT

*(54)* Garažo durų atidarymo įrenginys

*(57)* Išradimas skirtas plokštuminių garažo durų atidarymo įrenginiui, skirtam perkelti plokštumines garažo duris pakeliamuoju ir sukamuoju judesiais iš uždarytos vertikalios padėties į atidarytą ir pakeltą aukštyn horizontalią padėtį. Įrenginys susideda iš dviejų keltuvo kolonų, sumontuotų priešinguose garažo vartų kraštuose, turinčių įrengtus jose vertikalius slankiklius; garažo durų, turinčių sukimosi keltuvo kolonų slankikliuose ašis ir atramines svirtis su riedėjimo ratukais; ir dviejų pleišto formos kreipiančiųjų, įrengtų keltuvo kolonose, turinčių briaunas, skirtas garažo vartų atraminių svirčių riedėjimo ratukams. Toks plokštuminių garažo durų pakėlimo įrenginys, panaudojant keltuvo kolonas ir jose įrengtas įstrižas kreipiančiąsias, yra naudingas tuo, kad nereikalingi jokie papildomi išoriniai ir vizualiai matomi garažo viduje montuojami durų pavaros ir nukreipimo mechanizmai. Be to, tokios konstrukcijos pakeliamiems ir pasukamiems vartams nereikalingas užraktas, nes keltuvų kolonos, atraminės svirtys, kreipiančiosios ir ribotuvai derinyje atlieka užrakto funkciją, patikimai užblokuodami uždarytas garažo duris.




Apibrėžties punktai: 9, brėžiniai: 11.

---

*(51)* Int. Cl. (2016.01): **F24H 3/00**

*(21)* **2015 007**

*(13)* **A**

*(22)* 2015-02-03

*(30)* W.122777, 2014-02-06, PL

*(71)* “KRATKI.PL” MAREK BAL, ul. Gombrowicza 4, Wsola, 26-660 Jedlinsk, PL

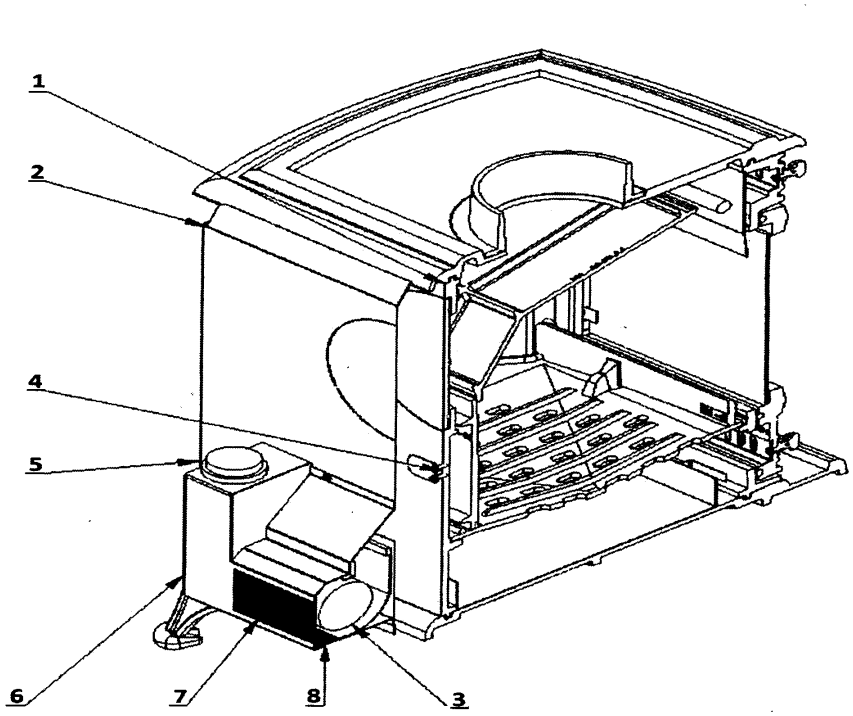
*(72)* Marek BAL, PL

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

*(54)* Šilumos priėmimo įrenginys

*(57)* Šis išradimas yra priskiriamas šilumos priėmimo prietaisų sričiai, o tiksliau prietaisų, tinkamų priimti šilumą iš šildymo įrenginio, tokio kaip židinys, ir perduoti šilumą į patalpą. Šilumos priėmimo įrenginys, tinkamas priimti šilumą iš šildymo įrenginio su turbina ir pratekamuoju vamzdynu, apima elektra varomą turbiną (3) apmaute (6), sumontuotą ant jo korpuso (2). Be to prietaise yra sumontuotas termostatas su reguliatoriumi (5) ir galvutės formos temperatūros jutikliu (4), kurie yra sujungti tarpusavyje kapiliaru, ir tuo pačiu metu korpusas (2) ir šildymo įrenginio

galinė siena (1) sudaro pratekamąjį vamzdį, lygiagretų šildymo įrenginio galinei sienai, o turbinos apmaute (6) yra angos (7) ir (8).




Apibrėžties punktai: 5, brėžiniai: 2.

***Patentas 6274 paskelbtas pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 28 straipsnį***

*(51)* Int. Cl. (2016.01): **A61B 5/00**
**G06T 7/00**
**G01N 33/00**

*(11)* **6274**

*(13)* B

*(21)* 2014 100

*(22)* 2014-09-09

*(41)* 2016-04-11

*(72)* Ingrida VAIŠNORIENĖ, LT
Janina DIDŽIAPETRIENĖ, LT
Ričardas ROTOMSKIS, LT
Narimantas Evaldas SAMALAVIČIUS, LT

*(73)* Nacionalinis vėžio institutas, Santariškių g. 1, LT-08406 Vilnius, LT

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

*(54)* Melanocitų vaizdinimas konfokalios atspindžio mikroskopijos būdu histologiniuose odos pjūviuose

*(57)* 1. Odos melanocitų vaizdinimo odoje sistema, apimanti:

(a) konfokalaus atvaizdo mikroskopą, skirtą odos melanocitų vaizdinimui;

(b) imunohistochemines reakcijas, skirtas melanocitų brandumui nustatyti;

(c) kompiuterį, skirtą skaitmeninei vaizdų analizei,

b e s i s k i r i a n t i tuo, kad melanocitai, kaip įvairaus brandumo ląstelės, yra identifikuojamos skaitmeniniuose vaizduose pagal melanosomų šviesos intensyvumo charakteristikas.

2. Sistema pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad kompiuterio skaitmeniniais vaizdais pateikiamos melanocitų citoplazmos atspindžio savybės priklauso nuo melanosomų brandumo stadijos.

3. Sistema pagal 1 arba 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad sistema yra pritaikyta diferencijuoti melanosomas pagal melanocito citoplazmą, turinčią nebrandžias I-II stadijos melanosomas, kuri yra pralaidi šviesai, o branduolys – kontrastuojantis.

4. Sistema pagal bet kurį iš 1 - 3 punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad sistema yra pritaikyta diferencijuoti melanosomas pagal melanocito citoplazmą, turinčią brandžias III-IV stadijos melanosomas, kurios pasižymi stipriomis šviesą laužiančiomis savybėmis, kuri yra šviesi, o branduolys – tamsus.

5. Odos melanocitų vaizdinimo odoje sistemos pagal 1 punktą panaudojimas melanocitų atspindžio savybėms nustatyti, siekiant gautą informaciją panaudoti paciento būsenos įvertinimui arba stebėjimui *in vivo* KAM, kur panaudojimas apima:

(a) konfokalaus atvaizdo mikroskopo, skirto odos melanocitų vaizdinimui, panaudojimą;

(b) imunohistocheminių reakcijų, skirtų melanocitų brandumui nustatyti, panaudojimą;

(c) kompiuterio, skirto skaitmeninei vaizdų analizei, panaudojimą;

b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad melanocitai, kaip įvairaus brandumo ląstelės, yra identifikuotos skaitmeniniuose vaizduose pagal melanosomų šviesos intensyvumo charakteristikas.

6. Panaudojimas pagal 5 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kompiuterio skaitmeniniais vaizdais pateikiamos melanocitų citoplazmos atspindžio savybės priklauso nuo melanosomų brandumo stadijos.

7. Panaudojimas pagal 5 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad sistema yra pritaikyta diferencijuoti melanosomas pagal melanocito citoplazmą, turinčią nebrandžias I-II stadijos melanosomas, kuri yra pralaidi šviesai, o branduolys – kontrastuojantis.

8. Panaudojimas pagal 5 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad sistema yra pritaikyta diferencijuoti melanosomas pagal melanocito citoplazmą, turinčią brandžias III-IV stadijos melanosomas, kurios pasižymi stipriomis šviesą laužiančiomis savybėmis, kuri yra šviesi, o branduolys – tamsus.

9. Panaudojimas pagal 5 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad būsena yra sveika oda.

10. Panaudojimas pagal 5 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad būsena yra melanocitinis odos navikas.

11. Panaudojimas pagal 10 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad melanocitinis odos navikas yra keratoma, melanoma, apgamas, lentigo.

12. Panaudojimas pagal 11 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad melanocitinis odos navikas yra apgamas.

13. Panaudojimas pagal 11 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad melanocitinis odos navikas yra melanoma.

## *Patentai, panaikinti pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 36 straipsnį*

| Patento nr. | Panaikinimo data |
|---|---|
| 5321 | 2015-11-06 |
| 5673 | 2015-11-11 |
| 5676 | 2015-11-25 |
| 5747 | 2015-11-25 |

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

| Patento nr. | Galiojimo baigties data |
|---|---|
| 4455 | 2016-05-22 |

# VARDINĖ PAREIŠKĖJŲ, IŠRADĖJŲ IR PATENTŲ SAVININKŲ RODYKLĖ

| (71) Pareiškėjas, valstybės kodas<br>(72) Išradėjas, valstybės kodas<br>(73) Patento savininkas, valstybės kodas | Žymėjimas<br>P - pareiškėjas<br>I - išradejas<br>S - patento savininkas | (51)<br>Klasifikacijos indeksas | (21)<br>Paraiškos numeris<br>(11)<br>Patento numeris | (13)<br>Dokumento rūšies kodas |
|---|---|---|---|---|
| „KRATKI.PL“ MAREK BAL, PL | P | F24H 3/00 | 2015 007 | A |
| ANDERSEN Daniel, LT | I | E04B 1/00 | 2014 137 | A |
| BAL Marek, PL | I | F24H 3/00 | 2015 007 | A |
| DIDŽIAPETRIENĖ Janina, LT | I | A61B 5/00<br>G01N 33/00<br>G06T 7/00 | 6274 | B |
| GUOBYS Remigijus, GB | I,P | E05F 15/00 | 2014 512 | A |
| HE Shaodun, CN | I,P | A61F 5/00 | 2015 027 | A |
| KLIGYS Modestas, LT | I | C04B 38/00 | 2015 100 | A |
| KNEIŽYS Erikas, LT | I,P | A62B 7/00 | 2014 127 | A |
| Nacionalinis vėžio institutas, LT | S | A61B 5/00<br>G01N 33/00<br>G06T 7/00 | 6274 | B |
| Nordland Corporation, DM | P | E04B 1/00 | 2014 137 | A |
| PUNDIENĖ Ina, LT | I | C04B 38/00 | 2015 100 | A |
| ROTOMSKIS Ričardas, LT | I | A61B 5/00<br>G01N 33/00<br>G06T 7/00 | 6274 | B |
| SAMALAVIČIUS Narimantas Evaldas, LT | I | A61B 5/00<br>G01N 33/00<br>G06T 7/00 | 6274 | B |
| SINICA Marijonas, LT | I | C04B 38/00 | 2015 100 | A |
| UAB „Elnet Group“, LT | P | C04B 38/00 | 2015 100 | A |
| VAIŠNORIENĖ Ingrida, LT | I | A61B 5/00<br>G01N 33/00<br>G06T 7/00 | 6274 | B |

| (71) Pareiškėjas, valstybės kodas<br>(72) Išradėjas, valstybės kodas<br>(73) Patento savininkas, valstybės kodas | Žymėjimas<br>P - pareiškėjas<br>I - išradejas<br>S - patento savininkas | (51)<br>Klasifikacijos indeksas | (21)<br>Paraiškos numeris<br>(11)<br>Patento numeris | (13)<br>Dokumento rūšies kodas |
|---|---|---|---|---|
| Vilniaus Gedimino technikos universitetas, LT | P | C04B 38/00 | 2015 100 | A |
| ČIRVINSKAS Ridas, LT | I | C04B 38/00 | 2015 100 | A |
| ŠEPUTYTĖ-JUCIKĖ Jurga, LT | I | C04B 38/00 | 2015 100 | A |

# SISTEMINĖ IŠRADIMŲ RODYKLĖ

| (51) Klasifikacijos indeksas | (21) Paraiškos numeris (11) Patento numeris | (13) Dokumento rūšies kodas |
|---|---|---|
| A61B 5/00 | 6274 | B |
| A61F 5/00 | 2015 027 | A |
| A61F 5/00 | 2015 035 | A |
| A62B 7/00 | 2014 127 | A |
| C04B 38/00 | 2015 100 | A |
| E04B 1/00 | 2014 137 | A |
| E05F 15/00 | 2014 512 | A |
| F24H 3/00 | 2015 007 | A |
| G01N 33/00 | 6274 | B |
| G06T 7/00 | 6274 | B |

# NUMERINĖ IŠRADIMŲ RODYKLĖ

| (21)<br>Paraiškos numeris | (11)<br>Patento numeris |
|---|---|
| 2014 100 | 6274 |

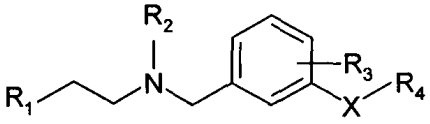
# NUMERINĖ IŠRADIMŲ PARAIŠKŲ RODYKLĖ

| (21)<br>Paraiškos numeris | (51)<br>Klasifikacijos indeksas |
|---|---|
| 2014 127 | A62B 7/00 |
| 2014 137 | E04B 1/00 |
| 2014 512 | E05F 15/00 |
| 2015 007 | F24H 3/00 |
| 2015 027 | A61F 5/00 |
| 2015 035 | A61F 5/00 |
| 2015 100 | C04B 38/00 |

## *Europos patentai, paskelbti pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 71 straipsnį*

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

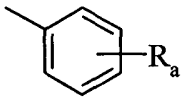
*(11)* **1859798**
*(13)* T
*(96)* 07015058.6
*(96)* 2002-03-15
*(97)* 2007-11-28
*(97)* 2015-12-30
*(30)* 279928 P, 2001-03-29, US
329449 P, 2001-10-15, US
*(72)* Chen, Zhaogen, US
Cohen, Michael Philip, US
Fisher, Matthew Joseph, US
Gillig, James Ronald, US
McCowan, Jefferson Ray, US
Miller, Shawn Christopher, US
Schaus, John Mehnert, US
Giethlen, Bruno, FR
*(73)* ELI LILLY AND COMPANY, Indianapolis, IN 46285, US
*(74)* Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* N-(2-ariletil)benzilaminai veikiantys, kaip 5-HT6 receptoriaus antagonistai
Apibrėžties punktai: 13, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Junginys, kurio struktūrinė formulė yra:




kur
X yra parinktas iš grupės, apimančios -O-, -NH-, -S-, -SO2-, -CH2-, -CH(F)-, -CH (OH)- ir -C(O)-;

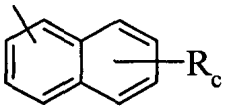
R1 yra parinktas iš grupės, apimančios pasirinktinai pakeistą fenilą, pasirinktinai pakeistą naftilą, pasirinktinai pakeistą nuo 5 iki 6 narių turintį monociklinį aromatinį heterociklinį junginį, kuris turi vieną heteroatomą, parinktą iš grupės, susidedančios iš azoto, deguonies, sieros, ir kur nuo 5 iki 6 narių turintis monociklinis aromatinis heterociklas yra, pasirinktinai, benzokondensuotas;

kur terminas „pasirinktinai pakeistas fenilas“ reiškia radikalą, kurio formulė



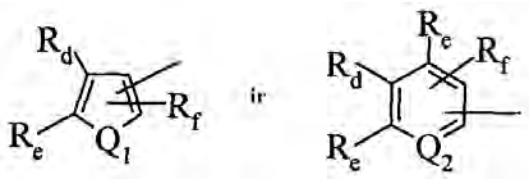
kur $R_a$ yra nuo 1 iki 3 grupių, nepriklausomai parinktų iš grupės, susidedančios iš vandenilio, hidroksi, $C_1$-$C_4$ alkilo, $C_1$-$C_4$ alkoksi, halogeno, benziloksi, karboksi, $C_1$-$C_4$ alkoksi karbonilo, amido, N-($C_1$-$C_4$ alkil)amido, sulfonilo amido, ciano, trifluormetilo, trifluormetoksi, nitro ir fenilo, pasirinktinai pakeisto su $C_1$-$C_4$ alkilu, $C_1$-$C_4$ alkoksi, halogenu, cianu ir trifluormetilu;

kur terminas „pasirinktinai pakeistas naftilas“ reiškia radikalą, kurio formulė



kur $R_c$ yra iš nuo 1 iki 2 grupių, nepriklausomai parinktų iš grupės, apimančios vandenilį, $C_1$-$C_4$ alkilą, $C_1$-$C_4$ alkoksi, halogeną, ciana, trifluormetilą ir nitro grupę;

kur terminas „pasirinktinai pakeistas nuo 5 iki 6 narių turintis monociklinis aromatinis heterociklas, turintis vieną heteroatomą, parinktą iš grupės, susidedančios iš azoto, deguonies, ir sieros, ir kur nuo 5 iki 6 narių turintis monociklinis aromatinis heterociklas yra pasirinktinai benzokondensuotas“ reiškia radikalą, kurio formulė



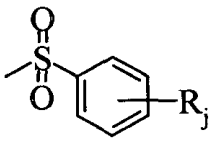

kur $Q_1$ yra parinktas iš grupės, apimančios -O-, -S-, ir -$NR_g$-, kur Rg yra parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio ir $C_1$-$C_4$ alkilo; ir $Q_2$ yra -N=, $R_d$, kiekvienas $R_e$ ir $R_f$ yra nepriklausomai parenkami iš grupės, susidedančios iš vandenilio, $C_1$-$C_4$ alkilo, $C_1$-$C_4$ alkoksi, halogeno, ciano ir trifluormetilo, arba $R_d$ ir $R_e$ (arba vienas iš $R_e$) yra paimti kartu su atomais, prie kurių jie yra prijungti ir sudaro benzo žiedą, kur benzo žiedas yra pasirinktinai pakeistas 1-4 pakaitais nepriklausomai parinktais iš grupės, susidedančios iš vandenilio, hidroksi, $C_1$-$C_4$ alkilo, $C_1$-$C_4$ alkoksi, trifluormetoksi, 2,2,2-trifluoretoksi, trifluormetilo, halogeno, karboksi, $C_1$-$C_4$ alkoksikarbonilo, amido grupės, N-($C_1$-$C_4$ -alkil) amido, amino, ($C_1$-$C_4$ alkil) amino, acilamino grupės, kur acilo grupė yra parinkta iš grupės, susidedančios iš $C_1$-$C_4$ alkilo ir fenilo; ciano, nitro, sulfonamido, fenilo grupė yra pasirinktinai pakeista su $C_1$-$C_4$ alkilu, $C_1$-$C_4$ alkoksi, halogenu, cianu ir trifluormetilu; fenoksi, benziloksi, -$NHS(O)_2R_h$, kur $R_h$ yra pasirinktas iš grupės, susidedančios iš $C_1$-$C_4$ -alkilo ir fenilo; ir -$S(O)_pR_i$, kur p yra 0, 1 arba 2 ir $R_i$ yra pasirinktas iš grupės, susidedančios iš $C_1$-$C_4$ alkilo ir fenilo, pasirinktinai pakeisto su $C_1$-$C_4$ alkilu, $C_1$-$C_4$ alkoksi, halogenu, cianu ir trifluormetilo; ir $R_f$ yra pasirinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, $C_1$-$C_4$ alkilo, $C_1$-$C_4$ -alkoksi, trifluormetilo ir halogeno;

R2 yra parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio ir C1-C3 -alkilo;

R3 yra parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, fluoro ir metilo; ir

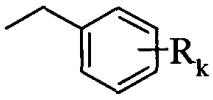
R4 yra parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, alilo, C2-C4 alkilo, fluorinto C2-C4 alkilo, pasirinktinai pakeisto fenilo, pasirinktinai pakeisto fenilsulfonilo, pasirinktinai pakeisto benzilo ir pasirinktinai pakeisto nuo 5 iki 6 narių turinčio monociklinio aromatinio heterociklo, turinčio vieną arba du heteroatomus, parinktus iš grupės, susidedančios iš azoto, deguonies, sieros ir, su sąlyga, kad R4 nėra pasirinktinai pakeistas fenilsulfonilas, kai X yra -SO2-, -CH2-, -CH(F)-, -CH(OH)- arba -C(O)-;

kur terminas „pasirinktinai pakeistas fenilsulfonilas“ reiškia radikalą, kurio formulė



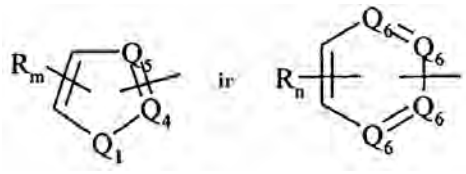
kur $R_j$ yra iš nuo 1 iki 3 grupių, nepriklausomai parinktų iš grupės, susidedančios iš vandenilio, $C_1$-$C_4$ alkilo, $C_1$-$C_4$ alkoksi, halogeno, ciano, trifluormetilo, nitro grupės ir fenilo;

kur terminas terminas „pasirinktinai pakeistas benzilas“ reiškia radikalą, kurio formulė



kur $R_k$ yra iš nuo 1 iki 3 grupių, nepriklausomai parinktų iš grupės, susidedančios iš vandenilio, $C_1$-$C_4$ alkilo, $C_1$-$C_4$ alkoksi, ciano grupės, nitro grupės, trifluormetilo ir halogeno;

kur terminas „pasirinktinai pakeistas nuo 5 iki 6 narių turintis monociklinis aromatinis heterociklas, turintis vieną arba du heteroatomus, parinktus iš grupės, susidedančios iš azoto, deguonies ir sieros“ reiškia radikalus, kurių formulės yra



kur $Q_3$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš -O-, -S- ir -$NR_{g'}$- kur $R_{g'}$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio ir $C_1$-$C_4$ alkilo; $Q_4$ ir $Q_5$ yra -$CR_m$, kur kiekvienas $R_m$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, $C_1$-$C_4$ alkilo, halogeno ir trifluormetilo arba vienas ar abu $Q_4$ ir $Q_5$ yra -N=; ir kur vienas arba du iš $Q_6$ yra -N=, o kiti yra -$CR_n$; kur kiekvienas $R_n$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, $C_1$-$C_4$ alkilo, $C_1$-$C_4$ alkoksi, halogeno, ciano grupės, nitro grupės ir trifluormetilo;

arba farmaciniu požiūriu priimtina šio junginio druska,

skirta naudoti demencijos arba kognityvinių sutrikimų, parinktų iš grupės, susidedančios iš su amžiumi susijusių kognityvinių gebėjimų pablogėjimo ir lengvų kognityvinių sutrikimų, gydymui.

2. Junginys, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur X yra parinktas iš grupės, susidedančios iš -O-, -NH- ir –S-; arba jo, farmaciniu požiūriu priimtina druska.

3. Junginys, skirtas naudoti pagal 2 punktą, kur X yra -O-; arba jo, farmaciniu požiūriu priimtina druska.

4. Junginys, skirtas naudoti pagal 3 punktą, kur R3 yra vandenilis; arba jo, farmaciniu požiūriu priimtina druska.

5. Junginys, skirtas naudoti pagal 4 punktą, kur R4 yra parinktas iš grupės, apimančios C2-C4 fluorintą alkilą ir pasirinktinai pakeistą fenilą; arba jo, farmaciniu požiūriu priimtina druska.

6. Junginys, skirtas naudoti pagal 5 punktą, kur R1 yra parinktas iš grupės, susidedančios iš pasirinktinai pakeisto fenilo ir pasirinktinai pakeisto 5-6-narius turinčio monociklinio aromatinio heterociklo, turinčio vieną heteroatomą, parinktą iš grupės, susidedančios iš azoto, deguonies ir sieros, ir kur 5-6 narį turintis monociklinis aromatinis heterociklas yra pasirinktinai benzokondensuotas; arba jo, farmaciniu požiūriu priimtina druska.

7. Junginys, skirtas naudoti pagal 6 punktą, kur R1 yra pasirinktinai pakeistas fenilas; arba jo, farmaciniu požiūriu priimtina druska.

8. Junginys, skirtas naudoti pagal 6 punktą, kur R1 yra pasirinktinai pakeistas nuo 5 iki 6 narių turintis monociklinis aromatinis heterociklas, turintis vieną heteroatomą, parinktą iš grupės, susidedančios iš azoto, deguonies, sieros, ir kur nuo 5 iki 6 narių turintis monociklinis aromatinis heterociklas yra benzokondensuotas; arba jo, farmaciniu požiūriu priimtina druska.

9. Junginys, skirtas naudoti pagal 8 punktą, kur benzokondensuotas nuo 5 iki 6 narių turintis monociklinis aromatinis heterociklas, yra pasirinktinai pakeistas indol-3-ilas; arba jo, farmaciniu požiūriu priimtina, druska.

10. Junginys, skirtas naudoti pagal bet kurį iš 7-9 punktų, kur R4 yra pasirinktinai pakeistas fenilas; arba jo, farmaciniu požiūriu priimtina druska.

11. Junginys, skirtas naudoti pagal bet kurį iš 7-9 punktų, kur R4 yra fluorintas C2-C4 alkilas; arba jo, farmaciniu požiūriu priimtina druska.

12. Junginys, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kur junginys yra N-(2-(6-fluor-1H-indol-3-il)etil)-3-(2,2,3,3-tetrafluorpropoksi)benzilaminas; arba jo, farmaciniu požiūriu priimtina druska.

13. Junginys, skirtas naudoti pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur demencija arba kognityviniai sutrikimai parinkti iš grupės, susidedančios iš su amžiumi susijusių kognityvinių gebėjimų sumažėjimo ir lengvų kognityvinių sutrikimų gydymui, pristabdymui, sutrikdymui, kontrolei ar progresavimo stabdymui, arba bent vieno iš šių minėtų sutrikimų profilaktikai.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 39/095*** (2006.01)
***A61P 31/04*** (2006.01)
*(11)* **2255826**
*(13)* T
*(96)* 10177890.0
*(96)* 2003-07-31
*(97)* 2010-12-01
*(97)* 2016-04-13
*(30)* 0218037, 2002-08-02, GB
0218036, 2002-08-02, GB
0218035, 2002-08-02, GB
0218051, 2002-08-02, GB
0220197, 2002-08-30, GB
0220199, 2002-08-30, GB
0225524, 2002-11-01, GB
0225531, 2002-11-01, GB
0230164, 2002-12-24, GB
0230168, 2002-12-24, GB
0230170, 2002-12-24, GB
0305028, 2003-03-05, GB
*(72)* Berthet, Francois-Xavier Jacques, BE
Biemans, Ralph, BE
Denoel, Philippe, BE
Feron, Christiane, BE
Goraj, Carine, BE
Poolman, Jan, BE
Weynants, Vincent, 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)* Neisseria vakcinos kompozicijos, apimančios antigenų derinius
Apibrėžties punktai: 17, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Imunogeninė kompozicija, apimanti GNA1870, NadA ir Lipo28, kur minėti antigenai, kai jie yra išorinėje membranos vezikulėje, yra aktyviau gaminami išorinėje membranos vezikulėje,
su sąlyga, kad imunogeninė kompozicija, nėra viena iš šių kompozicijų, aprašytų WO 2004/032958:
- (1) ‘NadA’ baltymo; (2) ‘741’ baltymo; (3) ‘936’ baltymo; (4) ‘953’ baltymo; ir (5) ‘287’ baltymo mišinys;
- ΔG287-953 hibridinio baltymo, 936-ΔG741 hibridinio baltymo, $NadA^{(NL)(C)}$ baltymo ir aliuminio hidroksido adjuvanto mišinys;
- ΔG287-953 hibridinio baltymo, 936-ΔG741 hibridinio baltymo, $NadA^{(NL)(C)}$ baltymo ir aliuminio hidroksido adjuvanto mišinys derinyje su OMVs, gautomis iš štamo H44/76; arba
ΔG287-953 hibridinio baltymo, 936-ΔG741 hibridinio baltymo, $NadA^{(NL)(C)}$ baltymo ir aliuminio hidroksido adjuvanto mišinys derinyje su OMVs, gautomis iš štamo 394/98.

2. Imunogeninė kompozicija, pagal 1 punktą, kur minėta kompozicija:

a) yra subvieneto kompozicija;

b) apima išorinės membranos vezikulės preparatą, kur antigenai yra aktyviau gaminami išorinėje membranos vezikulėje; arba

c) apima subvieneto kompoziciją, turinčią vieną arba daugiau antigenų, ir išorinės membranos vezikulės preparatą, turintį mažiausiai vieną antigeną, kuris yra aktyviau gaminamas išorinėje membranos vezikulėje.

3. Imunogeninė kompozicija pagal 2(b) arba (c) punktą, kur šeimininkė-ląstelė, iš kurios yra gaunamas išorinės membranos vezikulės preparatas:

a) yra pagamintas taip, kad sumažinti ekspresiją iš vieno arba daugiau iš lgtB arba IgtE;

b) negali sintetinti kapsulinio polisacharido ir yra pagamintas taip, kad sumažinti ekspresiją iš vieno arba daugiau iš siaD, ctrA, ctrB, ctrC, ctrD, synA (synX ir siaA ekvivalentai) arba synB (siaB ekvivalentas) ir synC (siaC ekvivalentas);

c) yra pagamintas taip, kad sumažinti ekspresiją iš vieno arba daugiau iš OpC, OpA arba PorA;

d) yra pagamintas taip, kad sumažinti FrpB ekspresiją; ir/arba

e) yra pagamintas taip, kad sumažinti ekspresiją iš msbB ir/arba htrB.

4. Imunogeninė kompozicija pagal 2(b), (c) arba 3 punktą, išorinės membranos vezikulės preparatas turi LPS, kuris yra konjuguotas su išoriniu membranos baltymu.

5. Imunogeninė kompozicija pagal 1-4 punktus, apimanti antigeną, gautą iš *Neisseria meningitidis* arba *Neisseria gonorrhoeae.*

6. Imunogeninė kompozicija pagal 5 punktą, kur mažiausiai vienas iš *Neisseria* antigenų yra gaunamas iš *N. meningitidis* B serogrupės.

7. Imunogeninė kompozicija pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, papildomai apimanti vieną arba daugiau iš bakterinių kapsulinių polisacharidų arba oligosacharidų.

8. Imunogeninė kompozicija pagal 7 punktą, kur kapsuliniai polisacharidai arba oligosacharidai yra gauti iš bakterijos, parinktos iš grupės, susidedančios iš *Neisseria meningitidis* A, C, Y ir W-135.

9. Imunogeninė kompozicija pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, papildomai apimanti adjuvantą.

10. Imunogeninė kompozicija pagal 9 punktą, kur adjuvantas apima aliuminio hidroksido gelį.

11. Vakcina, apimanti imunogeninę kompoziciją pagal 1-10 punktus ir farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį.

12. Vakcina, apimanti vieną arba daugiau polinukleotidų, kurių ekspresija yra valdoma eukariotiniu promotoriumi, koduojančiu GNA1870, NadA ir Lipo28.

13. Vakcinos pagal 11 arba 12 punktą panaudojimas gamybai vaisto, skirto *Neisseria* infekcijos gydymui arba prevencijai.

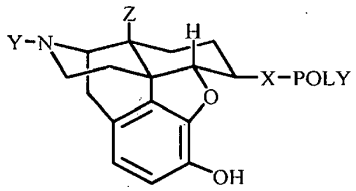
14. Vakcina pagal 11 arba 12 punktą, skirta panaudoti *Neisseria* infekcijos gydymui arba prevencijai.

15. Imunogeninės kompozicijos pagal 1-10 punktus gavimo būdas, apimantis maišymo kartu mažiausiai GNA1870, NadA ir Lipo28 antigenų iš *Neisseria* pakopą.

16. Imunogeninės kompozicijos pagal 2(b), (c) arba 3-9 punktus gavimo būdas, apimantis išorinės membranos vezikulių izoliavimo iš *Neisseria* kultūros pakopą.

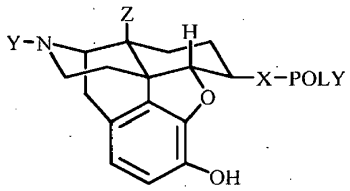
17. Vakcinos pagal 11 punktą gavimo būdas, apimantis imunogeninės kompozicijos pagal 1-10 punktus sujungimo su farmaciniu požiūriu priimtinu nešikliu pakopą.

*(51)* Int.Cl. ***A61K 47/48*** (2006.01)
*(11)* **2939696**
*(13)* T
*(96)* 15172363.2
*(96)* 2002-10-18
*(97)* 2015-11-04
*(97)* 2016-03-09
*(30)* 330400 P, 2001-10-18, US
*(72)* Bentley, Michael David, US
Roberts, Michael James, US
Shen, Xiaoming, US
Cheng, Lin, US
*(73)* Nektar Therapeutics, San Francisco, CA 94185, US
*(74)* Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
*(54)* Opioidų antagonistų polimerų konjugatai
Apibrėžties punktai: 11, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Polimero konjugatas, kurio formulė:




arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur:
Y yra alilas;
Z yra OH;
X yra jungtis, parinkta iš amido, amino, karbamato, eterio, tioeterio arba karbamido; ir
POLY turi formulę:
$CH_3O$-($CH_2$ $CH_2O)_n$-$CH_2CH_2$-
kurioje n yra nuo 2 iki 45.

2. Farmacinė kompozicija, apimanti:
polimero konjugatą ir
farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį,
kur polimero konjugatas turi formulę:

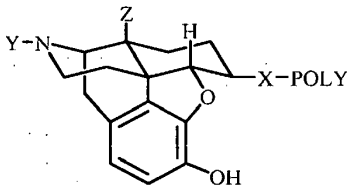



arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską, kur:
Y yra alilas;
Z yra OH;
X yra jungtis, parinkta iš amido, amino, karbamato, eterio, tioeterio arba karbamido; ir
POLY turi formulę:
$CH_3O$-($CH_2CH_2O)_n$-$CH_2CH_2$-
kurioje n yra nuo 2 iki 45.

3. Polimero konjugatas arba farmacinė kompozicija pagal 1 arba 2 punktą, kur n yra nuo 2 iki 20.

4. Polimero konjugatas arba farmacinė kompozicija pagal 2 punktą, kur POLY turi nuo 100 Da iki 500 Da molekulinę masę.

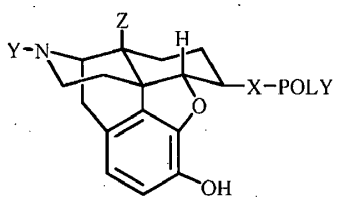
5. Farmacinė kompozicija, apimanti:
polimero konjugatą ir
opioidų agonistą; ir
farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį,
kur polimero konjugatas turi formulę:




arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską, kur:
Y yra alilas;
Z yra OH;
X yra jungtis, parinkta iš amido, amino, karbamato, eterio, tioeterio arba karbamido; ir
POLY turi formulę:
$CH_3O-(CH_2CH_2O)_n-CH_2CH_2-$
kurioje n yra nuo 2 iki 45.

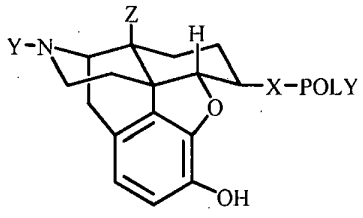
6. Farmacinė kompozicija pagal 5 punktą, kur opioidų agonistas yra parinktas iš grupės, susidedančios iš alfentanilo, bremazocino, buprenorfino, butorfanolio, kodeino, ciklazocino, dezocino, diacetilmorfino, dihidrokodeino, fentanilo, hidrokodono, hidromorfono, levorfanolio, meperidino (petidinas), metadono, morfino, nalbufino, noskapino, oksikodono, oksimorfono, papaverino, pentazocino, fenazocino, propiramo, propoksifeno, sufentanilo, tebaino ir tramadolio.

7. Polimero konjugatas, skirtas panaudoti vidurių užkietėjimo, atsiradusio po opioidų skyrimo, gydymui, kur polimero konjugatas turi formulę:



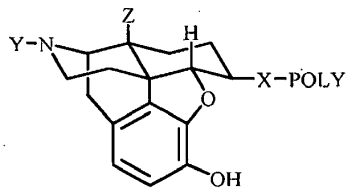

arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur:
Y yra alilas;
Z yra OH;
X yra jungtis, parinkta iš amido, amino, karbamato, eterio, tioeterio arba karbamido; ir
POLY turi formulę:
$CH_3O-(CH_2CH_2O)_n-CH_2CH_2-$
kurioje n yra nuo 2 iki 45.

8. Polimero konjugatas, skirtas panaudoti pykinimo, atsiradusio po opioidų skyrimo, gydymui, kur polimero konjugatas turi formulę:



arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur:
Y yra alilas;
Z yra OH;
X yra jungtis, parinkta iš amido, amino, karbamato, eterio, tioeterio arba karbamido; ir
POLY turi formulę:
$CH_3O-(CH_2CH_2O)n-CH_2CH_2-$
kurioje n yra nuo 2 iki 45.

9. Polimero konjugatas, skirtas panaudoti niežėjimo, atsiradusio po opioidų skyrimo, gydymui, kur polimero konjugatas turi formulę:




arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur:
Y yra alilas;
Z yra OH;
X yra jungtis, parinkta iš amido, amino, karbamato, eterio, tioeterio arba karbamido; ir
POLY turi formulę:
$CH_3O-(CH_2CH_2O)_n-CH_2CH_2-$
kurioje n yra nuo 2 iki 45.

10. Polimero konjugatas, skirtas panaudoti pagal 5, 7, 8 arba 9 punktą, kur n yra nuo 2 iki 20.

11. Polimero konjugatas, skirtas panaudoti pagal 5, 7, 8 arba 9 punktą, kur POLI turi nuo 100 Da iki 500 Da molekulinę masę.

---

*(51)* Int.Cl. ***C07C 233/40*** (2006.01)
***C07C 233/44*** (2006.01)
***C07C 233/51*** (2006.01)
***C07C 235/78*** (2006.01)
***C07C 237/20*** (2006.01)
***C07C 237/22*** (2006.01)
***C07D 295/13*** (2006.01)
*(11)* **1430020**
*(13)* T
*(96)* 02777207.8
*(96)* 2002-09-25
*(97)* 2004-06-23
*(97)* 2016-03-02
*(86)* PCT/EP2002/010746
*(86)* 2002-09-25
*(87)* WO 2003/029187
*(87)* 2003-04-10
*(30)* MI20010202, 2001-09-28, IT
*(72)* ALLEGRETTI, Marcello, IT
BERTINI, Riccardo, IT
BIZZARRI, Cinzia, IT
CESTA, Maria, Candida, IT

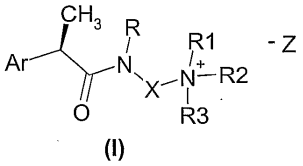
*(73)* Dompé farmaceutici s.p.a., 20122 Milano, IT

*(74)* Tatjana STERLINA, 37, UAB „Intels“, Naugarduko g. 32/2, LT-03225 Vilnius, LT

*(54)* R-2-arilpropiono rūgščių omega-amino alkilamidų ketvirtinės amonio druskos ir jų farmacinės kompozicijos

Apibrėžties punktai: 11, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. (R)-2-aril-propionamido junginiai, kurių formulė (I):



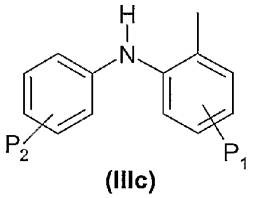

(I)

kurioje Ar yra parinktas iš:

a) $Ar_a$, kuris yra parinktas iš grupės, susidedančios iš 4-izobutilfenilo, 3-benzoil-fenilo;

b) 3 fenilo grupės, pakeistos izopropilu,

c) 2-(fenilamino)-fenilo, kurio formulė (III C):




(IIIc)

kurioje P1 ir P2 pakaitai rodo, kad dvi fenilo grupės, kiekviena nepriklausomai, turi C1-C4-alkilo, C1-C3-alkoksi grupių, chloro, fluoro ir/arba trifluormetilo mono arba poli pakaitus.

R yra vandenilis;

X yra:

- $C_1$-$C_6$ linijinis alkilenas, kurio $C_1$ yra pasirinktinai pakeistas $CO_2R_4$, kuriame $R_4$ yra H;
- $C_1$-$C_6$ linijinis alkilenas, kurio $C_1$ yra pasirinktinai pakeistas $CONHR_5$ grupe, kurioje $R_5$ yra OH;
- $(CH_2)_m$-CO-NH- $(CH_2)_n$, kuriame m ir n, kiekvienas nepriklausomai, yra sveikas skaičius nuo 2 iki 3;
- (CHR)-CONH-$(CH_2)_n$, kuriame n yra sveikas skaičius nuo 2 iki 3, o R’ yra metilas, turintis R arba S absoliučiąją konfigūraciją;
- fenilo arba fenilmetileno grupė, kurios formulė:




- arba X kartu su N atomu, prie kurio jis yra pririštas, ir R1 grupe suformuoja azo cikloalifatinį žiedą,

$NR_1R_2R_3$ grupė yra trimetilamonio, trietilamonio, N-cikloheksimetilo-N, N-dimetilamonio, N-ciklopentilamino-N, N-dimetilamonio, N-metil-1-piperidino, N-etil-1-piperidino, N-metil-4-morfolino, N-metil-4-tiomorfolino, N-benzil-N,N-dimetilamonio, N-alil-1-piperidino, 4-okso-N-metil-piperidino grupė arba X kartu su N aminu, prie kurio jis yra pririštas ir kartu su R1 grupe sudaro azotą, turintį 5-6-narių heterociklinį žiedą, o R2 ir R3 pakaitai nepriklausomai yra metilo arba cikloheksilo liekana,

Z yra farmaciniu požiūriu priimtinas ketvirtinių amonio druskų priešjonis,

arba minėti junginiai yra (R)-{3-[2-(3-benzoilfenil)-propionilamino]propil}-N-izopropil-N,N-dimetilamonio jodidas arba (R)-{3-[2-(4-izobutilfenil)-propionilamino]propil}-N-etil-N,N-dimetilamonio jodidas.

2.Junginiai pagal 1 punktą, kuriame X yra C2-C4 linijinis alkilenas.

3. Junginiai pagal 1 arba 2 punktą, kuriame (IIIc) formulės Ar grupės yra

parinktos iš 2-(2,6-dichlorfenil-amino)-fenilo; 2-(2,6-dichlorfenil-amino)-5-chlor-fenilo; 2-(2,6-dichlor-3-metil-fenil-amino)-fenilo; 2-{3-trifluormetil-fenilamino)-fenilo.

4. Junginiai pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kuriame Z yra halogeninas, parinktas iš Cl-, I, Br-, sulfato anijonų, metansulfonato arba p-toluensulfonato.

5. Junginiai pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, parinktų iš:

• (R)-(3-{2-[2-(2,6-dichlorfenilamino)-fenil]propionilamino}propil)-trimetilamonio jodido,

• (R)-{3-[2-(4-izobutilfenil)-propionilamino]propil}-trimetilamonio jodido;
• (R)-{3-[2-(3-benzoilfenil)-propionilamino]propil}-trimetilamonio jodido;
• (R)-{3-[2-(4-izobutilfenil)-propionilamino]propil}-N-etil-N, N-dimetilamonio jodido;
• (R)-{3-[2-(4-izobutilfenil)-propionilamino]propil}-N-cikloheksilmetil-N, N-dimetilamonio metano sultonato;
• (R)-{3-[2-(4-izobutilfenil)-propionilamino]propil}-N-cikloheksilmetil-N, N-dimetilamonio jodido;
• (R)-{3-[2-(4-ciklopentilmetilfenil)-propionilamino]propil}-trimetilamonio jodido;
• (R)-{3-[2-(3-benzoilfenil)-propionilamino]propil}-N-izopropil-N, N-dimetilamonio jodido;
• (R)-{4-[2-(4-izobutilfenil)-propionilamino]butil}-trimetilamonio jodido;
• (R)-{3-[2-(4-izobutilfenil)-propionilamino]propil}-1-metil-piperidino jodido;
• (R)-{3-[2-(3-benzoilfenil)-propionilamino]propil}-1-metil piperidino jodido;
• (R)-{3-[2-(4-izobutilfenil)-propionilamino]propil}-4-metil-morfolino jodido;
• (R)- 3-[2-(3-izopropilfenil)-propionilamino]propil}-4-metil-tiomorfolino metansulfonato;
• (R)-{2-[2-(4-izobutilfenil)-propionilamino]etil}-trimetilamonio bromido;
• (R)-[2-(4-izobutilfenil)-propionilamino]-1, 1-dimetil-4-piperidino-p-toluensulfonato;
• (R),(S')-2-(4-izobutilfenil)-N-[(1-karboksi-2"-N, N, N-trimetilamonio)etil]propionamido metansulfonato;
• R(-)-2-[(4-izobutilfenil)-N-(trimetilamoniumetil)metilamido]propionamido jodido;
• (R)(3-{2-[2(2,6-dichlorfenilamino)-fenil]-propionilamino}-propil)-trimetilamonio metansulfonato;
• (2R),(4"S)1-{4-karboksi-4-[2-(4-izobutil-fenil)-propionilamino]butil}-1-metil-piperidino jodido;
• R(-)-{3-[2-(4'-izobutilfenil)-propionilamino]-propil}-(N-benzil)-N, N-dimetilamonio jodido;
• 2R-{3-[2-(4'-isobutilfenil])-propionilamino]-propil}-(1"metil-4"karboksiamido)piperidino jodido;
• (2R)-{3-[2-(4'-izobutilfenil)-propionilamino]-propil}-(1"-metil-4"okso)piperidino jodido;
• R(-)-{3-[2-(4'-izobutilfenil) -propionilamino] -propil}-trietilamonio jodido;
• R (-)-{3-[2-(4'-izobutilfenil)-propionilamino]-propil}-1-alilpiperidino bromido;
• R(-)-2-[(4'-izobutil)fenil]-N-[4"-N, N,-N-trimetilaminofenil]propionamido jodido;
• R(-)-2-[(4'-izobutil)fenil]-N-[4"-N, N,N-trimetilaminometilfenil]propionamido jodido.

6. Junginiai pagal bet kurį iš 1-5 punktų, skirti naudoti kaip vaistai.

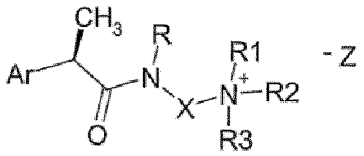
7. Junginiai pagal bet kurį iš 1-5 punktų, skirti naudoti kaip neutrofilų chemotaksio inhibitoriai ir monocitai, sukeliami C5a.

8. Junginiai pagal bet kurį iš 1-5 punktų, skirti naudoti psoriazės, pūslelinės ir pemfigoido, reumatoidinio artrito, žarnyno lėtinių uždegiminių patologijų, įskaitant opinį kolitą, ūminio respiracinio distreso sindromą, idiopatinę fibrozę, cistinę fibrozę, lėtinę obstrukcinę plaučių ligą ir glomerulonefrito gydymui.

9. Junginiai pagal bet kurį iš 1-5 punktų, skirti naudoti ligų, sukeltų išemijos ir reperfuzijos, profilaktikai ir gydymui.

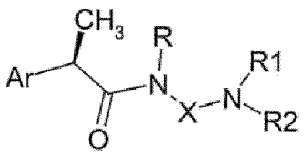
10. Farmacinės kompozicijos, apimančios junginį, pagal 1-5 punktus, mišinyje su tinkamu nešikliu.

11. Būdas, skirtas (R)-2-aril-propionamido junginių gavimui, kurių (I) formulė:




**(I)**

kurioje Ar, X, $R_1$, $R_2$, $R_3$ turi reikšmes, kaip apibūdinta 1 punkte, apimančiame amidų reakciją, kurių formulė (IV):




**(IV)**

kartu su $R_3Z$ formulės junginiais, kurioje Z yra įprastinė pasišalinanti grupė.

*(51)* Int.Cl. ***C07D 401/12*** (2006.01)
***A61K 31/4709*** (2006.01)
***C07D 211/46*** (2006.01)
***C07D 211/48*** (2006.01)
***C07D 211/58*** (2006.01)
***C07D 401/14*** (2006.01)
***C07D 405/14*** (2006.01)
***C07D 409/14*** (2006.01)
***C07D 453/02*** (2006.01)
***A61K 31/445*** (2006.01)
***A61K 31/452*** (2006.01)
***C07D 401/06*** (2006.01)
***C07D 405/12*** (2006.01)
***C07D 409/06*** (2006.01)
***C07D 409/12*** (2006.01)
***C07D 471/08*** (2006.01)
***G01N 33/94*** (2006.01)

*(11)* **2246345**
*(13)* T
*(96)* 10173127.1
*(96)* 2004-02-13
*(97)* 2010-11-03
*(97)* 2016-02-10
*(30)* 447843 P, 2003-02-14, US
467035 P, 2003-05-01, US

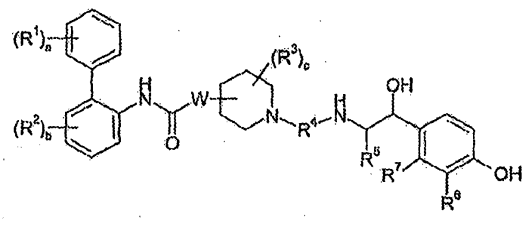
*(72)* MAMMEN, Mathai, US
HUGHES, Adam, US
LEE, Tae Weon, US
HUSFELD, Craig, US
STANGELAND, Eric, US
CHEN, Yan, US
DUNHAM, Sarah, AU

*(73)* Theravance Respiratory Company, LLC, South San Francisco, CA 94080, US

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

*(54)* Bifenilo dariniai, turintys beta2 adrenerginio receptoriaus agonisto ir muskarininio receptoriaus antagonisto aktyvumą
Apibrėžties punktai: 32, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Junginiai, kurių formulė I:



I

kurioje:

a yra 0 arba sveikas skaičius nuo 1 iki 3;

kiekviena $R^1$ nepriklausomai yra parinkta iš (1-4C)alkilo, (2-4C)alkenilo, (2-4C)alkinilo, (3-6C)cikloalkilo, ciano, halo, $-OR^{1a}$, $-C(O)OR^{1b}$, $-SR^{1c}$, $-S(O)R^{1d}$, $-S(O)_2R^{1e}$ ir $-NR^{1f}R^{1g}$;

kiekviena iš $R^{1a}$, $R^{1b}$, $R^{1c}$, $R^{1d}$, $R^{1e}$, $R^{1f}$ ir $R^{1g}$ nepriklausomai yra vandenilis, (1-4C)alkilas arba fenil-(1-4C)alkilas;

b yra 0 arba sveikas skaičius nuo 1 iki 3;

kiekviena $R^2$ nepriklausomai yra parinkta iš (1-4C)alkilo, (2-4C)alkenilo, (2-4C)alkinilo, (3-6C)cikloalkilo, ciano, halo, $-OR^{2a}$, $-C(O)OR^{2b}$, $-SR^{2c}$, $-S(O)R^{2d}$, $-S(O)_2R^{2e}$ ir $-NR^{2f}R^{2g}$.

kiekviena iš $R^{2a}$, $R^{2b}$, $R^{2c}$, $R^{2d}$, $R^{2e}$, $R^{3f}$ ir $R^{2g}$ nepriklausomai yra vandenilis, (1-4C)alkilas arba fenil-(1-4C)alkilas;

W yra prisijungusi prie 3- arba 4-padėties azoto atomo atžvilgiu piperidino žiede ir reiškia O arba $NW^a$;

$W^a$ yra vandenilis arba (1-4C)alkilas;

c yra 0 arba sveikas skaičius nuo 1 iki 4;

kiekviena $R^3$ nepriklausomai yra parinkta iš (1-4C)alkilo, (2-4C)alkenilo, (2-4C)alkinilo, (3-6C)cikloalkilo, ciano, halo, $-OR^{3a}$, $-C(O)OR^{3b}$, $-SR^{3c}$, $-S(O)R^{3d}$, $-S(O)_2R^{3e}$ ir $-NR^{3f}R^{3g}$; arba dvi $R^3$ grupės yra susijungusios, siekiant gauti (1-3C) alkileną, (2-3C)alkenileną arba oksiran-2,3-diilą;

kiekviena iš $R^{3a}$, $R^{3b}$, $R^{3c}$, $R^{3d}$, $R^{3e}$, $R^{3f}$ ir $R^{3g}$ nepriklausomai yra vandenilis arba (1-4C)alkilas;

$R^4$ yra dvivalentė grupė, kurios formulė:

$$-(R^{4a})_d-(A^1)_e-(R^{4b})_f-Q-(R^{4c})_g-(A^2)_h-(R^{4d})_i-$$

kurioje:

d, e, f, g, h ir i kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš 0 ir 1;

$R^{4a}$, $R^{4b}$, $R^{4c}$ ir $R^{4d}$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš (1-10C)alkileno, (2-10C)alkenileno ir (2-10C)alkinileno, kur kiekviena alkileno, alkenileno arba alkinileno grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 5 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš (1-4C)alkilo, fluoro, hidroksi, fenilo ir fenil-(1-4C)alkilo;

$A^1$ ir $A^2$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš (3-7C)cikloalkileno, (6-10C)arileno, -O-(6-10C)arileno, (6-10C) arilen-O-, (2-9C)heteroarileno, -O-(2-9C)heteroarileno, (2-9C)heteroarilen-O- ir (3-6C)heterocikleno, kur kiekvienas cikloalkilenas yra nepakeistas arba pakeistas nuo 1 iki 4 pakaitų, parinktų nepriklausomai iš (1-4C)alkilo, ir kiekviena arileno, heteroarileno arba heterocikleno grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo, (1-4C)alkoksi, -S-(1-4C)alkilo, -S(O)-(1-4C)alkilo, $-S(O)_2$-(1-4C)alkilo, -C(O)O(1-4C)alkilo, karboksilo, ciano, hidroksi, nitro, trifluormetilo ir trifluormetoksi;

Q yra parinkta iš jungties, -O-, -C(O)O-, -OC(O)-, -S-, -S(O)-, $-S(O)_2$-, $-N(Q^a)C(O)$-, $-C(O)N(Q^b)$-, $-N(Q^c)S(O)_2$-, $-S(O)_2N(Q^d)$-, $-N(Q^e)C(O)N(Q^f)$-, $-N(Q^g)S(O)_2N(Q^h)$-, $-OC(O)N(Q^i)$-, $-N(Q^j)C(O)O$- ir $-N(Q^k)$;

$Q^a$, $Q^b$, $Q^c$, $Q^d$, $Q^e$, $Q^f$, $Q^g$, $Q^h$, $Q^{i,}$ $Q^j$ ir $Q^k$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio, (1-6C)alkilo, $A^3$ ir (1-4C) alkilen-$A^4$, kur alkilo grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 3 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš fluoro, hidroksi ir (1-4C)alkoksi; arba kartu su azoto atomu ir $R^{4b}$ arba $R^{4c}$ grupe, prie kurių jos yra prisijungusios, sudaro 4-6-narę azacikloalkileno grupę;

$A^3$ ir $A^4$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš (3-6C)cikloalkilo, (6-10C)arilo, (2-9C)heteroarilo ir (3-6C)heterociklilo, kur kiekvienas cikloalkilas yra nepakeistas arba pakeistas nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš (1-4C)alkilo, ir kiekviena arilo, heteroarilo arba hetorociklilo grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo ir (1-4C)alkoksi;

su sąlyga, kad gretimų atomų skaičius trumpiausioje grandinėje tarp dviejų azoto atomų, prie kurių $R^4$ yra prisijungusi, yra intervale nuo 4 iki 16;

$R^5$ reiškia vandenilį arba (1-4C)alkilą;

$R^6$ yra $-NR^{6a}CR^{6b}(O)$ arba $-CR^{6c}R^{6d}OR^{6e}$ ir $R^7$ yra vandenilis; arba $R^6$ ir $R^7$ kartu sudaro $-NR^{7a}C(O)-CR^{7b}=CR^{7c}$-, $-CR^{7d}=CR^{7e}-C(O)-NR^{7f}$-, $-NR^{7g}C(O)-CR^{7h}R^{7i}-CR^{7j}R^{7k}$- arba $-CR^{7l}R^{7m}-CR^{7n}R^{7o}$- C(O)-$NR^{7p}$-;

kiekviena iš $R^{6a}$, $R^{6b}$, $R^{6c}$, $R^{6d}$ ir $R^{6e}$ nepriklausomai yra vandenilis arba (1-4C)alkilas; ir
kiekviena iš $R^{7a}$, $R^{7b}$, $R^{7c}$, $R^{7d}$, $R^{7e}$, $R^{7f}$, $R^{7g}$, $R^{7h}$, $R^{7i}$, $R^{7j}$, $R^{7k}$, $R^{7l}$, $R^{7m}$, $R^{7n}$, $R^{7o}$ ir $R^{7p}$ nepriklausomai yra vandenilis arba (1-4C)alkilas;

arba jų farmaciniu požiūriu priimtina druska arba solvatas arba stereoizomeras.

2. Junginys pagal 1 punktą, kur gretimų atomų skaičius trumpiausioje grandinėje tarp dviejų azoto atomų, prie kurių $R^4$ yra prisijungusi, yra intervale nuo 8 iki 14.

3. Junginys pagal 2 punktą, kur te skaičius gretimų atomų trumpiausioje grandinėje tarp dviejų azoto atomų, prie kurių $R^4$ yra prisijungusi, yra 8, 9, 10 arba 11.

4. Junginys pagal bet kurį iš 1 – 3 punktų, kur W yra prisijungusi prie piperidino žiedo 4-padėtyje azoto atomo atžvilgiu.

5. Junginys pagal bet kurį iš 1 – 4 punktų, kur a, b, ir c kiekviena yra 0 ir $W^a$ ir $R^5$ abi yra vandenilis.

6. Junginys pagal bet kurį iš 1 – 4 punktų, kur W reiškia O.

7. Junginys pagal bet kurį iš 1 – 6 punktų, kur $R^6$ yra -NHCHO arba $-CH_2OH$ ir $R^7$ yra vandenilis; arba $R^6$ ir $R^7$ kartu sudaro -NHC(O)-CH=CH-, -CH=CH-C(O)-NH-, $-CH_2-CH_2$-C(O)NH- arba -NHC(O)-$CH_2-CH_2$-.

8. Junginys pagal bet kurį iš 1 – 7 punktų, kur $R^4$ yra dvivalentė grupė kurios formulė $-(R^{4a})_d-$, kur $R^{4a}$ yra (4-10C) alkilenas.

9. Junginys pagal 8 punktą, kur $R^4$ yra $-(CH_2)_8-$, $-(CH_2)_9$ ir $=(CH_2)_{10}-$.

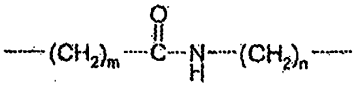
10. Junginys pagal bet kurį iš 1 – 7 punktų, kur $R^4$ yra dvivalentė grupė, kurios formulė:
$-(R^{4a})_d-(A^2)_h-(R^{4d})_i-$

kur $R^{4a}$ yra (1-10C)alkilenas; $A^2$ yra (6-10C)arilenas arba (2-9C)heteroarilenas; ir $R^{4d}$ yra (1-10C)alkilenas.

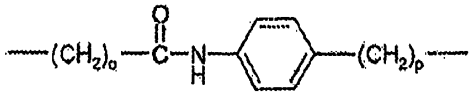
11. Junginys pagal bet kurį iš 1 – 7 punktų, kur $R^4$ yra dvivalentė grupė, kurios formulė:
$-(R^{4n})_d-Q-(A^2)_h-(R^{4d})_i-$
kur Q yra -O- arba $-N(Q^k)-$; $Q^k$ yra vandenilis arba (1-3C)alkilas; $R^{4a}$ yra (1-10C)alkilenas; $A^2$ yra (6-10C)arilenas arba (2-9C)heteroarilenas; ir $R^{4d}$ yra (1-10C)alkilenas.

12. Junginys pagal bet kurį iš 1 – 7 punktų, kur Q yra $-N(Q^a)C(O)-$ arba $-C(O)N(Q^b)-$.

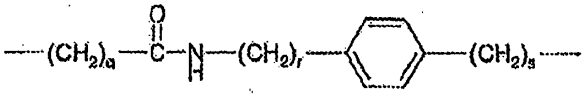
13. Junginys pagal 12 punktą, kur $R^4$ yra parinkta iš:



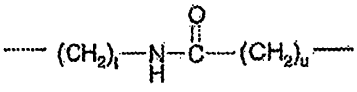
kur m yra sveikas skaičius nuo 2 iki 10; ir n yra sveikas skaičius nuo 2 iki 10; su sąlyga, kad m + n yra sveikas skaičius nuo 4 iki 12;



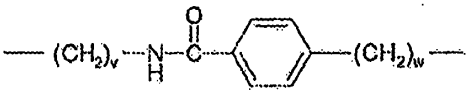
kur o yra sveikas skaičius nuo 2 iki 7; ir p yra sveikas skaičius nuo 1 iki 6; su sąlyga, kad o + p yra sveikas skaičius nuo 3 iki 8; ir kur fen-1,4-ileno grupė pasirinktinai yra pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo, (1-4C)alkoksi, -S-(1-4C)alkilo, -S(O)-(1-4C)alkilo, $-S(O)_2-$(1-4C)alkilo, -C(O)O(1-4C)alkilo, karboksi, ciano, hidroksi, nitro, trifluormetilo ir trifluormetoksi;



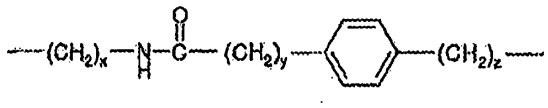
kur q yra sveikas skaičius nuo 2 iki 6; r yra sveikas skaičius nuo 1 iki 5; ir s yra sveikas skaičius nuo 1 iki 5; su sąlyga, kad q + r + s yra sveikas skaičius nuo 4 iki 8; ir kur fen-1,4-ileno grupė pasirinktinai yra pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo, (1-4C)alkoksi, -S-(1-4C)alkilo, -S(O)-(1-4C)alkilo, $-S(O)_2-$(1-4C)alkilo, -C(O)O(1-4C)alkilo, karboksi, ciano, hidroksi, nitro, trifluormetilo ir trifluormetoksi;



kur t yra sveikas skaičius nuo 2 iki 10; ir u yra sveikas skaičius nuo 2 iki 10; su sąlyga, kad t + u yra sveikas skaičius nuo 4 iki 12;

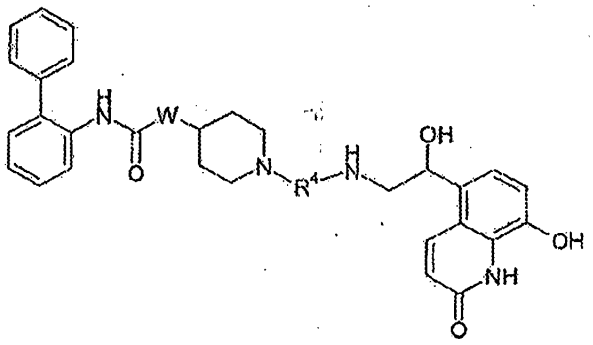


kur v yra sveikas skaičius nuo 2 iki 7; ir w yra sveikas skaičius nuo 1 iki 6; su sąlyga, kad v + w yra sveikas skaičius nuo 3 iki 8; ir kur fen-1,4-ileno grupė pasirinktinai yra pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo, (1-4C)alkoksi, -S-(1-4C)alkilo, -S(O)-(1-4C)alkilo, -$S(O)_2$(1-4C)alkilo, -C(O)O(1-4C)alkilo, karboksi, ciano, hidroksi, nitro, trifluormetilo ir trifluormetoksi; ir



kur x yra sveikas skaičius nuo 2 iki 6; y yra sveikas skaičius nuo 1 iki 5; ir z yra sveikas skaičius nuo 1 iki 5; su sąlyga, kad x + y + z yra sveikas skaičius nuo 4 iki 8; ir kur fen-1,4-ileno grupė pasirinktinai yra pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo, (-4C)alkoksi, -S-(1-4C)alkilo, -S(O)-(1-4C)alkilo, -$S(O)_2$-(1-4C)alkilo, -C(O)O(1-4C)alkilo, karboksi, ciano, hidroksi, nitro, trifluormetilo ir trifluormetoksi.

14. Junginys pagal 1 punktą, kurio formulė II:



II

kurioje:

W reiškia 0 arba $NW^a$;

$W^a$ yra vandenilis arba (1-4C)alkilas;

$R^4$ yra dvivalentė grupė, kurios formulė:

-$(R^{4a})_d$-$(A^1)_e$-$(R^{4b})_f$ -Q-$(R^{4c})_g$-$(A^2)_h$-$(R^{4d})_i$-

kurioje:

d, e, f, g, h ir i kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš 0 ir 1;

$R^{4a}$, $R^{4b}$, $R^{4c}$ ir $R^{4d}$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš (1-10C)alkileno, (2-10C)alkenileno ir (2-10C)alkinileno, kur kiekviena alkileno, alkenileno arba alkinileno grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 5 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš (1-4C)alkilo, fluoro, hidroksi, fenilo ir fenil-(1-4C)alkilo;

$A^1$ ir $A^2$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš (3-7C)cikloalkileno, (6-10C)arileno, -O-(6-10C)arileno, (6-10C) arilen-O-, (2-9C)heteroarileno, -O-(2-9C)heteroarileno, (2-9C)heteroarilen-O- ir (3-6C)heterocikleno, kur kiekvienas cikloalkilenas yra nepakeistas arba pakeistas nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš (1-4C)alkilo, ir kiekviena arileno, heteroarileno arba heterocikleno grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo, (1-4C)alkoksi, -S-(1-4C)alkilo, -S(O)-(1-4C)alkilo, -$S(O)_2$-(1-4C)alkilo, -C(O)O(1-4C)alkilo, karboksi, ciano, hidroksi, nitro, trifluormetilo ir trifluormetoksi;

Q yra parinkta iš jungties, -O-, -C(O)O-, -OC(O)-, -S-, -S(O)-, -$S(O)_2$-, -$N(Q^a)$C(O)-, -C(O)$N(Q^b)$-, -$N(Q^c)S(O)_2$-, -$S(O)_2N(Q^d)$-, -$N(Q^e)$C(O)$N(Q^f)$-, -$N(Q^g)S(O)_2N(Q^h)$-, -OC(O)$N(Q^i)$-, -$N(Q^j)$C(O)O- ir -$N(Q^k)$;

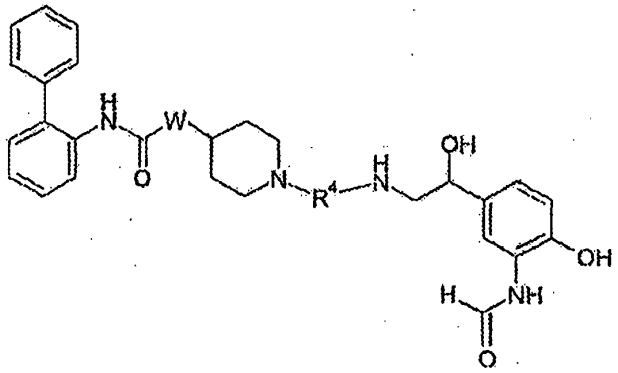
$Q^a$, $Q^b$, $Q^c$, $Q^d$, $Q^e$, $Q^f$, $Q^g$, $Q^h$, $Q^i$, $Q^j$ ir $Q^k$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio, (1-6C)alkilo, $A^3$ ir (1-4C) alkilen-$A^4$, kur alkilo grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 3 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš fluoro, hidroksi ir (1-4C)alkoksi; arba kartu su azoto atomu ir $R^{4b}$ arba $R^{4c}$ grupe, prie kurios jos yra prisijungusios, sudaro 4-6-narę azacikloalkileno grupę;

$A^3$ ir $A^4$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš (3-6C)cikloalkilo, (6-10C)arilo, (2-9C)heteroarilo ir (3-6C)heterociklilo, kur kiekvienas cikloalkilas yra nepakeistas arba pakeistas nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš (1-4C)alkilo, ir kiekviena arilo, heteroarilo arba heterociklilo grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo ir (1-4C)alkoksi;

su sąlyga, kad gretimų atomų skaičius trumpiausioje grandinėje tarp dviejų azoto atomų, prie kurių $R^4$ yra prisijungusi, yra intervale nuo 4 iki 14;

arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska arba solvatas arba stereoizomeras.

15. Junginys pagal 1 punktą, kurio formulė III:



III

kurioje:

W reiškia O arba $NW^a$;

$W^a$ yra vandenilis arba (1-4C)alkilas;

$R^4$ yra dvivalentė grupė, kurios formulė:

$-(R^{4a})_d-(A^1)_e-(R^{4b})_f-Q-(R^{4c})_g-(A^2)_h-(R^{4d})_i-$

kurioje:d, e, f, g, h ir i kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš 0 ir 1;

$R^{4a}$, $R^{4b}$, $R^{4c}$ ir $R^{4d}$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš (1-10C)alkileno, (2-10C)alkenileno ir (2-10C)alkinileno, kur kiekviena alkileno, alkenileno arba alkinileno grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 5 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš (1-4C)alkilo, fluoro, hidroksi, fenilo ir fenil-(1-4C)alkilo;

$A^1$ ir $A^2$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš (3-7C)cikloalkileno, (6-10C)arileno, -O-(6-10C)arileno, (6-10C) arilen-O-, (2-9C)heteroarileno, -O-(2-9C)heteroarileno, (2-9C)hetoroarilen-O- ir (3-6C)hetcrocikleno, kur kiekvienas cikloalkilenas yra nepakeistas arba pakeistas nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš (1-4)alkilo, ir kiekviena arileno, heteroarileno arba heterocikleno grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo, (1-4C)alkoksi, -S-(1-4C)alkilo, -S(O)-(1-4C)alkilo, $-S(C)_2$-(1-4C)alkilo, -C(O)O(1-4C)alkilo, karboksi, ciano, hidroksi, nitro, trifluormetilo ir trifluormetoksi;

Q yra parinkta iš jungties, -O-, -C(O)O-, -OC(O)-, -S-, -S(O)-, $-S(O)_2$-, $-N(Q^a)C(O)$-, $-C(O)N(Q^b)$-, $-N(Q^c)S(O)_2$-, $-S(O)_2N(Q^d)$-, $-N(Q^e)C(O)N(Q^f)$-, $-N(Q^g)S(O)_2N(Q^h)$-, $-OC(O)N(Q^i)$-, $-N(Q^j)C(O)O$- ir $-N(Q^k)$;

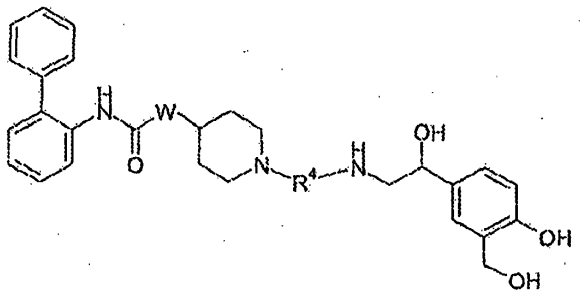
$Q^a$, $Q^b$, $Q^c$, $Q^d$, $Q^e$, $Q^f$, $Q^g$, $Q^h$, $Q^i$, $Q^j$ ir $Q^k$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio, (1-6C)alkilo, $A^3$ ir (1-4C) alkilen-$A^4$, kur alkilo grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 3 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš fluoro, hidroksi ir (1-4C)alkoksi; arba kartu su azoto atomu ir $R^{4b}$ arba $R^{4c}$ grupe, prie kurių jos yra prisijungusios, sudaro 4-6-narę azacikloalkileno grupę;

$A^3$ ir $A^4$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš (3-6C)cikloalkilo, (6-10C)arilo, (2-9C)heteroarilo ir (3-5C)heterociklilo, kur kiekvienas cikloalkilas yra nepakeistas arba pakeistas nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš (1-4C)alkilo, ir kiekviena arilo, hetoroarilo arba heterociklilo grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo ir (1-4C)alkoksi;

su sąlyga, kad gretimų atomų skaičius trumpiausioje grandinėje tarp dviejų azoto atomų, prie kurių $R^4$ yra prisijungusi, yra intervale nuo 4 iki 14;

arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska arba solvatas arba stereoizomeras.

16. Junginys pagal 1 punktą, kurio formulė IV:



IV

kurioje:
W reiškia O arba $NW^a$;
$W^a$ yra vandenilis arba (1-4C)alkilas;
$R^4$ yra dvivalentė grupė, kurios formulė:
$-(R^{4a})_d-(A^1)_e-(R^{4b})_f-Q-(R^{4c})_g-(A^2)_h-(R^{4d})_i-$
kurioje:
d, e, f, g, h ir i kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš 0 ir 1;
$R^{4a}$, $R^{4b}$, $R^{4c}$ ir $R^{4d}$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš (1-10C)alkileno, (2-10C)alkenileno ir (2-10C)alkinileno, kur kiekviena alkileno, alkenileno arba alkenileno grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 5 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš (1-4C)alkilo, fluoro, hidroksi, fenilo ir fenil-(1-4C)alkilo;
$A^1$ ir $A^2$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš (3-7C)cikloalkileno, (6-10C)arileno, -O-(6-10C)arileno, (6-10C)arilen-O-, (2-9C)heteroarileno, -O-(2-9C)heteroarileno, (2-9C)heteroarilen-O- ir (3-6C)heterocikleno, kur kiekvienas cikloalkilenas yra nepakeistas arba pakeistas nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš (1-4C)alkilo, ir kiekviena arileno, heteroarileno arba heterocikleno grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo, (1-4C)alkoksi, -S-(1-4C)alkilo, -S(O)-(1-4C)alkilo, $-S(O)_2$-(1-4C)alkilo, -C(O)O(1-4C)alkilo, karboksi, ciano, hidroksi, nitro, trifluormetilo ir trifluormetoksi;
Q yra parinkta iš jungties, -O-, -C(O)O-, -OC(O)-, -S-, -S(O)-, $-S(O)_2$-, $-N(Q^a)C(O)-$, $-C(O)N(Q^b)-$, $-N(Q^c)S(O)_2-$, $-S(O)_2N(Q^d)-$, $-N(Q^e)C(O)N(Q^f)-$, $-N(Q^g)S(O)_2N(Q^h)-$, $-OC(O)N(Q^i)-$, $-N(Q^j)C(O)O-$ ir $-N(Q^k)$;
$Q^a$, $Q^b$, $Q^c$, $Q^d$, $Q^e$, $Q^f$, $Q^g$, $Q^h$, $Q^i$, $Q^j$ ir $Q^k$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio, (1-6C)alkilo, $A^3$ ir (1-4C)alkilen-$A^4$, kur alkilo grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 3 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš fluoro, hidroksi ir (1-4C)alkoksi; arba kartu su azoto atomu ir $R^{4b}$ arba $R^{4c}$ grupe, prie kurių jos yra prisijungusios, sudaro 4-6-narę azacikloalkileno grupę;
$A^3$ ir $A^2$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš (3-6C)cikloalkilo, (6-10C)arilo, (2-9C)heteroarilo ir (3-6C)heterociklilo, kur kiekvienas cikloalkilas yra nepakeistas arba pakeistas nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš (1-4C)alkilo, ir kiekviena arilo, heteroarilo arba heterociklilo grupė yra nepakeista arba pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo ir (1-4C)alkoksi;
su sąlyga, kad gretimų atomų skaičius trumpiausioje grandinėje tarp dviejų azoto atomų, prie kurių $R^4$ yra prisijungusi, yra intervale nuo 4 iki 14;
arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska arba solvatas arba stereoizomeras.

17. Junginys pagal bet kurį iš 14, 15 arba 16 punktų, kur gretimų atomų skaičius trumpiausioje grandinėje tarp dviejų azoto atomų, prie kurių $R^4$ yra prisijungusi, yra intervale nuo 8 iki 14.

18. Junginys pagal bet kurį iš 14, 15 arba 16 punktų, kur gretimų atomų skaičius trumpiausioje grandinėje tarp dviejų azoto atomų, prie kurių $R^4$ yra prisijungusi, yra 8, 9, 10 arba 11.

19. Junginys pagal bet kurį iš 14, 15 arba 16 punktų, kur W reiškia O.

20. Junginys pagal bet kurį iš 14, 15 arba 16 punktų, kur $R^4$ yra dvivalentė grupė, kurios formulė $-(R^{4a})_d-$, kurioje $R^{4a}$ yra (4-10C)alkilenas.

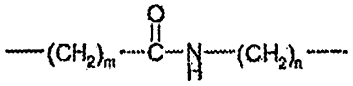
21. Junginys pagal 20 punktą, kur $R^4$ yra $-(CH_2)_8-$, $-(CH_2)_9$ ir $-(CH_2)_{10}-$.

22. Junginys pagal bet kurį iš 14, 15 arba 16 punktų, kur $R^4$ yra dvivalentė grupė, kurios formulė:
$-(R^{4a})_d-(A^2)_h-(R^{4d})_i-$
kur $R^{4a}$ yra (1-10C)alkilenas; $A^2$ yra (6-10C)arilenas arba (2-9C)heteroarilenas; ir $R^{4d}$ yra (1-10C)alkilenas.

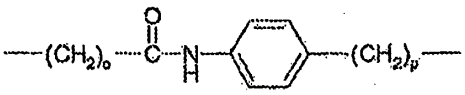
23. Junginys pagal bet kurį iš 14, 15 arba 16 punktų, kur $R^4$ yra dvivalentė grupė, kurios formulė:
$-(R^{4a})_d-Q-(A^2)_h-(R^{4d})_i-$
kur Q yra -O- arba $-N(Q^k)-$; $Q^k$ yra vandenilis arba (1-3C)alkilas; $R^{4a}$ yra (1-10C)alkilenas; $A^2$ yra (6-10C)arilenas arba (2-9C)heteroarilenas; ir $R^{4d}$ yra (1-10C)alkilenas.

24. Junginys pagal bet kurį iš 14, 15 arba 16 punktų, kur Q yra $-N(Q^a)C(O)-$ arba $-C(O)N(Q^b)-$.

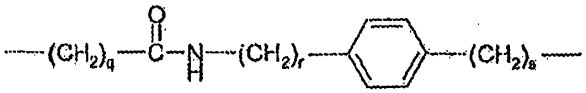
25. Junginys pagal 24 punktą, kur $R^4$ yra parinkta iš:



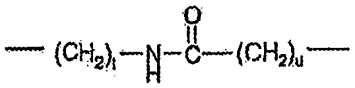
kur m yra sveikas skaičius nuo 2 iki 10; ir n yra sveikas skaičius nuo 2 iki 10; su sąlyga, kad m + n yra sveikas skaičius nuo 4 iki 12;



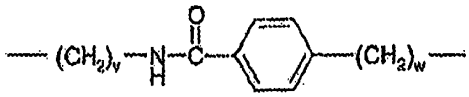
kur o yra sveikas skaičius nuo 2 iki 7; ir p yra sveikas skaičius nuo 1 iki 6; su sąlyga, kad o + p yra sveikas skaičius nuo 3 iki 8; ir kur fen-1,4-ileno grupė pasirinktinai yra pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo, (14C)alkoksi, -S-(1-4C)alkilo, -S(O)-(1-4C)alkilo, $-S(O)_2$-(1-4C)alkilo, -C(O)O(1-4C)alkilo, karboksi, ciano, hidroksi, nitro, trifluormetilo ir trifluormetoksi;



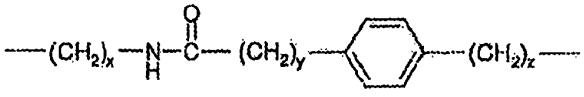
kur q yra sveikas skaičius nuo 2 iki 6; r yra sveikas skaičius nuo 1 iki 5; ir s yra sveikas skaičius nuo 1 iki 5; su sąlyga, kad q + r + s yra sveikas skaičius nuo 4 iki 8; ir kur fen-1,4-ileno grupė pasirinktinai yra pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo, (1-4C)alkoksi, -S-(1-4C)alkilo, -S(O)-(1-4C)alkilo, $-S(O)_2$-(1-4C)alkilo, -C(O)O(1-4C)alkilo, karboksi, ciano, hidroksi, nitro, trifluormetilo ir trifluormetoksi;



kur t yra sveikas skaičius nuo 2 iki 10; ir u yra sveikas skaičius nuo 2 iki 10; su sąlyga, kad t + u yra sveikas skaičius nuo 4 iki 12;



kur v yra sveikas skaičius nuo 2 iki 7; ir w yra sveikas skaičius nuo 1 iki 6; su sąlyga, kad v + w yra sveikas skaičius nuo 3 iki 8; ir kur fen-1,4-ileno grupė pasirinktinai yra pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo, (1-4C)alkoksi, -S-(1-4C)alkilo, -S(O)-(1-4C)alkilo, $-S(O)_2$-(1-4C)alkilo, -C(O)O(1-4C)alkilo, karboksi, ciano, hidroksi, nitro, trifluormetilo ir tifluormetoksi; ir



kur x yra sveikas skaičius nuo 2 iki 6; y yra sveikas skaičius nuo 1 iki 5; ir z yra sveikas skaičius nuo 1 iki 5; su sąlyga, kad x + y + z yra sveikas skaičius nuo 4 iki 8;

ir kur fen-1,4-ileno grupė pasirinktinai yra pakeista nuo 1 iki 4 pakaitų, nepriklausomai parinktų iš halo, (1-4C)alkilo, (1-4C)alkoksi, -S-(1-4C)alkilo, -S(O)-(1-4C)alkilo, $-S(O)_2$-(1-4C)alkilo, -C(O)O(1-4C)alkilo, karboksi, ciano, hidroksi, nitro, trifluormetilo ir trifluormetoksi.

26. Junginys pagal bet kurį iš 14, 15 arba 16 punktų, kur $R^4$ yra parinkta iš:
-$(CH_2)_7$-;
$(CH_2)_8$-;
-$(CH_2)_9$-;
$(CH_2)_{10}$-;
-$(CH_2)_{11}$-;
-$(CH_2)_2C(O)NH(CH_2)_5$-;
-$(CH_2)_2N(CH_3)C(C)(CH_2)_5$-;
-$(CH_2)_2C(O)NH$(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2NHC(O)$(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2NHC(O)NH(CH_2)_5$-;
-$(CH_2)_3NHC(O)NH(CH_2)_5$-;
-$(CH_2)_2C(O)NHCH_2$(cikloheks-1,3-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2NHC(O)$(*cis*-ciklopent-1,3-ilen)-;
-$(CH_2)_2NHC(O)NH$(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
1-[-$(CH_2)_2C(O)$](piperidin-4-il)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_2NHC(O)$(*trans*-cikloheks-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2NHC(O)$(*cis*-ciklopent-1,3-ilen)-;
-$(CH_2)_2NH$(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
1-[-$(CH_2)_2NHC(O)$](piperidin-4-il)$(CH_2)_2$-;
-$CH_2$(fen-1,4-ilen)NH(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2C(O)NHCH_2$(fen-1,3-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2C(O)NHCH_2$(pirid-2,6-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2C(O)NH$(*cis*-cikloheks-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2C(O)NH$(*trans*-cikloheks-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2NHC(O)$(*cis*-ciklopent-1,3-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2N(CH_3)C(O)$(fen-1,3-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2N(CH_3)C(O)$(*trans*-cikloheks-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2C(O)NH$(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2C(O)NH$(fen-1,4-ilen)C*H$(CH_3)$-((*S*)-izomeras);
-(CH2)2C(O)NH(fen-1,4-ilen)C*H$(CH_3)$-((*R*)-izomeras);
2-[(S)-(-$CH_2$-](pirolidin-1-il)C(O)$(CH_2)_4$-;
2-[(S)-(-$CH_2$-](pirolidin-1-il)C(O)(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2C(O)NH$(4-chlorfen-1,3-ilen)$CH_2$-;
-$CH_2$(2-fluorfen-1,3-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2C(O)NH$(4-metilfen-1,3-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2C(O)NH$(6-chlorfen-1,3-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2C(O)NH(_2$-chlorfen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2C(O)NH$(2,6-dichlorfen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2NHC(O)NHCH_2$(fen-1,3-ilen)$CH_2$-;
4-[-$CH_2$-](piperidin-1-il)C(O)(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2C(O)N(CH_2CH_3)$(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
1-[-$(CH_2)_2NHC(O)$](piperidin-4-il)-;
-$(CH_2)_2C(O)NH$(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_2NHC(O)$(tien-2,5-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2N(CH_3)C(O)$(3-nitrofen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2N(CH_3)C(O)$(*trans*-cikloheks-1,4-ilen)-;
1-[-$CH_2$(2-fluorfen-1,3-ilen)$CH_2$](piperidin-4-il)-;
5-[-$(CH_2)_2NHC(O)$](piridin-2-il)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_3$(tien-2,5-ilen)$(CH_2)_3$-;
-$(CH_2)_2$(fen-1,4-ilen)NH(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
-$CH_2$(fen-1,2-ilen)NH(fen-14-ilen)$(CH_2)_2$-;
1-[-$CH_2$(2-fuorofen-1,3-ilen)$CH_2$](piperidin-4-il)$(CH_2)_2$-;
1-[-$CH_2$(2-fluorfen-1,3-ilen)$CH_2$](piperidin-4-il)$CH_2$-;

-$(CH_2)_2$C(O)NH(3-chlorfen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$C(O)NH(2-($CF_3$O-)fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_3$(fen-1,3-ilen)NH(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_2$S(O)$_2$NH$(CH_2)_5$-;
-$CH_2$(fen-1,3-ilen)NH(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_2$C(O)NH(2-jodfen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$C(O)NH(2-chlor-5-metoksifen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$C(O)NH(2-chlor-6-metilfen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$C(O)NH$(CH_2)_5$-;
-$(CH_2)_2$N$(CH_3)$S(O)$_2$(fen-1,4-ilen)$CH_2$;
-$(CH_2)_2$C(O)NH(2-bromfen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_3$(fen-1,4-ilen)NH(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$;
-$(CH_2)_3$(fen-1,2-ilen)NH(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
1-[-$CH_2$(2-fluorfen-1,3-ilen)$CH_2$](piperidin-4-il)$(CH_2)_3$-;
-$(CH_2)_2$C(O)NH(2-metoksifen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_5$NH(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
4-[-$(CH_2)_2$-](piperidin-1-il)(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_2$C(O)NH(fen-1,4-ilen)CH$(CH_3)CH_2$-;
-$(CH_2)_2$-(*trans*-cikloheks-1,4-ilen)NH(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_2$C(O)NH(2-fluorfon-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$(fen-1,3-ilen)NH(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$;
-$(CH_2)_2$C(O)NH(2,5-difluorfen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$NHC(O)(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
1-[-$CH_2$(pirid-2,6-ilen)$CH_2$](piperidin-4-il)$CH_2$-;
-$(CH_2)_3$NH(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_2$NH(naft-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_3$O(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
1-[-$(CH_2)_3$](piperidin-4-il)$CH_2$-;
4-[-$(CH_2)_2$](piperidin-1-il)C(O)(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_3$(fen-1,4-ilen)NHC(O)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_3$O(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
2-[-$(CH_2)_2$](benzimiodazol-5-il)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$-(*trans*-cikloheks-1,4-ilen)NHC(O)$(CH_2)_2$-,
-$(CH_2)_2$-(*trans*-cikloheks-1,4-ilen)MHC(O)$(CH_2)_4$-;
-$(CH_2)_2$-(*trans*cikloheks-1,4-ilen)NHC(O)$(CH_2)_5$-;
4-[-$(CH_2)_2$](piperidin-1-il)C(C)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_2$NHC(O)NH(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$N$(CH_3)(CH_2)_2$(*cis*-cikloheks-1,4-ilen)-;
-$(CH_2)_2$C(O)NH(2,3,6-tetrafluorfen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$C(O)NH(2,6-dijodfen-1,4-ilen)$CH_2$-;
4-[-$(CH_2)_2$](piperidin-1-il)C(O)$(CH_2)_3$-;
4-[-$(CH_2)_2$](piperidin-1-il)C(O)$(CH_2)_4$-;
4-[-$(CH_2)_2$](piperidin-1-il)C(O)$(CH_2)_5$-;
-$(CH_2)_2$C(O)NH$CH_2$(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$HC(O)NH$CH_2$(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$C(O)NH(2-metilfen-1,4-ilen)$CH_2$-;
1-[-$(CH_2)_3$O(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$](piperidin-4-il)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$C(O)NH$CH_2$(fen-1,3-ilen)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_2$O(fen-1,3-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$N$(CH_3)$C(O)$CH_2$O(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$N$(CH_3)$C(O)$CH_2$O(fen-1,3-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$N$(CH_3)$C(O)(fur-2,5-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$N$(CH_3)$C(O)(tien-2,5-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$O(fen-1,4-ilen)O$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_2$(*trans*-cikloheks-1,4-ilen)NHC(O)(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;

-$(CH_2)_2$(*trans*-cikloheks-1,4-ilen)NHC(O)$CH_2$O(fen-1,2-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$(*trans-cik*loheks-1,4-ilen)NHC(O)$CH_2$O(fen-1,3-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$(*trans*-cikloheks-1,4-ilen)NHC(O)$CH_2$O(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$(*trans*-cikloheks-1,4-ilen)NHC(O)(fur-2,5-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$(*trans*-cikloheks-1,4-ilen)NHC(O)(tien-2,5-ilen)$CH_2$-;
4-[-$(CH_2)_2$](piperidin-1-il)C(O)$CH_2$O(fen-1,2-ilen)$CH_2$-;
4-[-$(CH_2)_2$](piperidin-1-il)C(O)$CH_2$O(fen-1,3-ilen)$CH_2$-;
4-[-$(CH_2)_2$](piperidin-1-il)C(O)$CH_2$O(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
4-[-$(CH_2)_2$](piperidin-1-il)C(O)(fur-2,5-ilen)$CH_2$-;
4-[$(CH_2)_2$](piperidin-1-il)C(O)(tien-2,3-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$(fen-1,4-ilen)MHC(O)(fen-1,3-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$(fen-1,4-ilen)NHC(O)(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$(fen-1,4-ilen)NHC(O)$CH_2$O(fen-1,2-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$(fen-1,4-ilen)NHC(O)$CH_2$O(fen-1,3-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$(fen-1,4-ilen)NHC(O)$CH_2$O(fen-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$(fen-1,4-ilen)NHC(O)(fur-2,5-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$(fen-1,4-ilen)NHC(O)(tien-2,5-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$(*trans*-cikloheks-1,4-ilen)NHC(O)(fen-1,3-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_3$O(fen-1,3-ilen)$CH_2$-;
-$CH_2CH(OH)CH_2NH$(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_4NH$(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_2C(O)NH$(fen-1,4-ilen)$CH_2NHC(O)CH_2$-;
-$(CH_2)_2C(O)NH$(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2NHC(O)CH_2$-;
-$(CH_2)_2C(O)NHCH_2$(*trans*-cikloheks-1,4-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2NHC(O)(CH_2)_5$-;
-$(CH_2)_2$O(fen-1,3-ilen)O$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_2$O(fen-1,2-ilen)O$(CH_2)_2$-;
-$CH_2$(fen-1,2-ilen)O(fen-1,2-ilen)$CH_2$-;
-$(CH_2)_2$(O)NH$(CH_2)_6$;
-$(CH_2)_3$(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_3$-;
-$(CH_2)_3$(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_4$(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_3$(furan-2,5-ilen)$(CH_2)_3$-;
-$(CH_2)_2N(CH_3)C(O)NH$(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$;
4-[-$(CH_2)_2$(piperidin-1-il)C(O)NH(fen-1,4-ilen)$(CH_2)_2$-;
-$(CH_2)_3$(fen-1,3-ilen)$(CH_2)_3$-;
-$(CH_2)_3$(tetrahidrofuran-2,5-ilen)$(CH_2)_3$-; ir
-$(CH_2)_2$O(fen-1,4-ilen)C(O)$(CH_2)_2$-.

27. Farmacinė kompozicija, apimanti farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį ir junginio pagal bet kurį iš 1 – 26 punktų terapiniu požiūriu veiksmingą kiekį.

28. Farmacinė kompozicija pagal 27 punktą, kur kompozicija papildomai apima steroidinio priešuždegiminio agento terapiniu požiūriu veiksmingą kiekį.

29. Farmacinė kompozicija pagal 27 punktą, kur kompozicija papildomai apima $PDE_4$ inhibitoriaus terapiniu požiūriu veiksmingą kiekį.

30. Junginys pagal bet kurį iš 1 – 26 punktų, skirtas panaudoti terapijoje arba kaip vaistas.

31. Junginys pagal bet kurį iš 1 – 26 punktų, skirtas plaučių susirgimo gydymui.

32. Junginys pagal 31 punktą, kur plaučių susirgimas yra lėtinė obstrukcinė plaučių liga arba astma.

*(51)* Int.Cl. ***C07K 14/705*** (2006.01)
***G01N 33/68*** (2006.01)
*(11)* **1536234**
*(13)* T
*(96)* 04008908.8
*(96)* 2001-05-23
*(97)* 2005-06-01
*(97)* 2016-03-16
*(30)* 579927, 2000-05-26, US
214065 P, 2000-06-26, US
*(72)* Peach, Robert J., US
Naemura, Joseph R., US
Linsley, Peter S., US
Bajorath, Jürgen, US
*(73)* Bristol-Myers Squibb Company, Princeton, NJ 08543, US
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Tirpios CTLA4 mutantinės molekulės ir jų panaudojimas
Apibrėžties punktai: 24, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. CTLA4 mutantinė molekulė, apimanti aminorūgščių seką, kuri prasideda metioninu +1 padėtyje ir baigiasi asparto rūgštimi +124 padėtyje, kaip pavaizduota 8 paveiksle, arba kuri prasideda alaninu -1 padėtyje ir baigiasi asparto rūgštimi +124 padėtyje, kaip pavaizduota 8 paveiksle.

2. CTLA4 mutantinė molekulė pagal 1 punktą, papildomai apimanti aminorūgščių seką, kuri keičia užląstelinės CTLA4 dalies tirpumą, gimininguma arba valentingumą.

3. CTLA4 mutantinė molekulė pagal 1 punktą, kuri yra sulietas baltymas, papildomai apimantis imunoglobulino fragmentą.

4. CTLA4 mutantinė molekulė pagal 3 punktą, kur imunoglobulino fragmentas yra imunoglobulino pastovioji sritis arba jos dalis.

5. CTLA4 mutantinė molekulė pagal 4 punktą, kur imunoglobulino pastovioji sritis apima lankstą ir imunoglobulino molekulės CH2 ir CH3 sritis.

6. CTLA4 mutantinė molekulė pagal 4 arba 5 punktą, kur imunoglobulino pastovioji sritis arba jos dalis yra žmogaus arba beždžionės imunoglobulino pastovioji sritis arba jos dalis.

7. CTLA4 mutantinė molekulė pagal bet kurį iš 3 - 6 punktų, kur imunoglobulino fragmentas apima vieną arba daugiau mutacijų mažinančių efektorinę funkciją.

8. CTLA4 mutantinė molekulė pagal bet kurį iš 3 - 7 punktų, kur imunoglobulino fragmentas apima lankstą ir bet kurios arba visos cisteino liekanos lankste yra pakeistos serinu.

9. CTLA4 mutantinė molekulė pagal 8 punktą, kur cisteinas esantis +130 padėtyje yra pakeistas serinu, cisteinas esantis +136 padėtyje yra pakeistas serinu, ir cisteinas esantis +139 padėtyje yra pakeistas serinu, kaip parodyta 8 paveiksle.

10. CTLA4 mutantinė molekulė pagal bet kurį iš 4 - 9 punktų, kur žmogaus imunoglobulino pastovioji sritis yra mutuojama įtraukiant +130 padėtyje esantį cisteiną pakeistą serinu, +136 padėtyje esantį cisteiną pakeistą serinu, +139 padėtyje esantį cisteiną pakeistą serinu ir +148 padėtyje esantį proliną pakeistą serinu, kaip pavaizduota 8 paveiksle.

11. CTLA4 mutantinė molekulė pagal bet kurį iš 3 - 10 punktų, kur imunoglobulino fragmentas apima aminorūgščių seką, kuri prasideda glutamo rūgštimi +126 padėtyje ir baigiasi lizinu +357 padėtyje, kaip pavaizduota 8 paveiksle.

12. CTLA4 mutantinė molekulė pagal bet kurį iš 3 - 11 punktų, papildomai apimanti jungties aminorūgšties liekaną, kuri yra tarp aminorūgščių sekos, kuri baigiasi asparto rūgštimi +124 padėtyje ir imunoglobulino fragmento.

13. CTLA4 mutantinė molekulė pagal 12 punktą, kur jungties aminorūgšties liekana yra glutaminas.

14. CTLA4 mutantinė molekulė pagal 1 punktą, apimanti aminorūgščių seką, kuri prasideda metioninu +1 padėtyje ir baigiasi lizinu +357 padėtyje, kaip parodyta 8 paveiksle, arba kuri prasideda alaninu -1 padėtyje ir baigiasi su lizinu +357 padėtyje, kaip parodyta 8 paveiksle.

15. CTLA4 mutantinė molekulė pagal bet kurį vieną iš 3 - 14 punktų, kuri yra tirpi.

16. Nukleino rūgšties molekulė, apimanti nukleotidų seką, koduojančią aminorūgščių seką, atitinkančią CTLA4 mutantinės molekulės seką pagal bet kurį vieną iš 1 - 15 punktų.

17. Nukleino rūgšties molekulė pagal 16 punktą, apimanti nukleotidų seką, kuri prasideda guanidinu -3 nukleotido padėtyje ir baigiasi adeninu +1071 nukleotido padėtyje, kaip parodyta 8 paveiksle, arba apimanti nukleotidų seką, prasidedančią adeninu +1 nukleotido padėtyje ir pasibaigiančią adeninu +1071 nukleotido padėtyje, kaip parodyta 8 paveiksle.

18. Vektorius, apimantis nukleino rūgšties molekulės seką pagal bet kurį iš 16 arba 17 punktų.

19. Vektoriaus šeimininko sistema, apimanti vektorių pagal 18 punktą tinkamoje šeimininko ląstelėje.

20. Ląstelė-šeimininkė, turinti vektorių pagal 18 punktą.

21. CTLA4 mutantinės molekulės gamybos būdas, apimantis vektoriaus šeimininko sistemos pagal 19 punktą auginimą taip, kad būtų pagaminama CTLA4 mutantinė molekulė ląstelėje šeimininkėje, ir gauto baltymo išskyrimą.

22. Farmacinė kompozicija, apimanti CTLA4 mutantinę molekulę pagal bet kurį vieną iš 1 – 15 punktų.

23. CTLA4 mutantinės molekulės, pagal bet kurį iš 1 - 15 punktų, panaudojimas farmacinės kompozicijos, skirtos gydyti imuninės sistemos ligą, gamybai.

24. Panaudojimas pagal 23 punktą, kur imuninės sistemos liga, yra autoimuninė liga, imunoproliferacinė liga arba su transplantatu susijęs sutrikimas.

## *Europos patentai, paskelbti pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 79 straipsnį*

*(51)* Int.Cl. ***A01B 35/26*** (2006.01)
*(11)* **2592918**
*(96)* 11733666.9
*(96)* 2011-07-12
*(97)* 2013-05-22
*(97)* 2016-03-02
*(86)* PCT/EP2011/061875
*(86)* 2011-07-12
*(87)* WO 2012/007470
*(87)* 2012-01-19
*(30)* 202010008085 U, 2010-07-15, DE
*(72)* WIDMAIER, Helmut, DE
SMEETS, Florian, DE
*(73)* Betek GmbH & Co. KG, 78733 Aichhalden, DE
*(74)* Stanislava TELEIŠIENĖ, 31, UAB „Brainera“, Savanorių pr. 217, LT-02300 Vilnius, LT
*(54)* Dirvos įdirbimo įrankis
Apibrėžties punktai: 16, brėžiniai: 16.

*(57)* 1. Dirvos įdirbimo įrankis, būtent rautuvo antgalis su atramine dalimi (10), kur atraminė dalis (10) turi pjovimo briaunų laikiklį (13) galinėje dalyje, kur pjovimo briaunų laikiklis (13) laiko pagrindinio pjovimo elementą (20) ir bent du antrinio pjovimo elementus (21), kur pagrindinio pjovimo elementas (20) ir antrinio pjovimo elementai (21) yra pritvirtinti prie pjovimo briaunų laikiklio (13) pjovimo elemento atramos (14), kur ir pagrindinio pjovimo elementas (20), ir antrinio pjovimo elementai (21) kiekvienu atveju turi pjovimo briauną (20.3, 21.3), kur antrinio pjovimo elementų (21) pjovimo briaunos (21.3) išdėstytos paslinktos pagrindinio pjovimo elemento (20) pjovimo briaunos (20.3) atžvilgiu, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad antrinio pjovimo elementų (21) pjovimo briaunos (21.3) išdėstytos lygiagrečiai viena kitai, o pagrindinio pjovimo elemento (20) pjovimo briauna (20.3) yra lygiagreti antrinio pjovimo elementų (21) pjovimo briaunoms (21.3).

2. Dirvos įdirbimo įrankis pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad antrinio pjovimo elementų (21) pjovimo briaunos (21.3) išdėstytos lygiuojant vieną su kita.

3. Dirvos įdirbimo įrankis pagal 1 arba 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad pagrindinio pjovimo elemento (20) pjovimo briauna (20.3) išdėstyta nutolusi ne mažiau kaip 4 mm nuo antrinio pjovimo elemento (21) pjovimo briaunos (21.3).

4. Dirvos įdirbimo įrankis pagal vieną iš 1-3 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad pagrindinio pjovimo elemento (20) pjovimo briauna (20.3) išdėstyta nutolusi daugiausiai 15 mm nuo antrinio pjovimo elemento (21) pjovimo briaunos (21.3).

5. Dirvos įdirbimo įrankis pagal vieną iš 1-4 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad pjovimo briaunų laikiklis (13) turi pjovimo elemento atramą (14) pagrindinio pjovimo elementui (20) ir antrinio pjovimo elementams (21), tuo, kad pjovimo elemento atramos (14) turi lizdo paviršių (14.1) ir kontaktinį paviršių (14.2), kuris išdėstytas kampu į pastarąjį, tuo, kad pagrindinio pjovimo elementas (20) ir antrinio pjovimo elementai (21) – kiekvienas į lizdo paviršių (14.1) remiasi tvirtinimo dalimi (20.1; 21.1), o į kontaktinį paviršių (14.2) – pjovimo iškyša (20.2; 21.2).

6. Dirvos įdirbimo įrankis pagal 5 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad antrinio pjovimo elementų (21) ir pagrindinio pjovimo elemento (20) kontaktiniai paviršiai (14.2) ir (arba) lizdo paviršiai (14.1) išdėstyti lygiagrečiai vienas kitam.

7. Dirvos įdirbimo įrankis pagal vieną iš 1-6 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad pagrindinio pjovimo elementas (20) išsikiša į priekį (V) antrinio pjovimo elementų atžvilgiu arba išdėstytas atitrauktai atgal pastarųjų atžvilgiu.

8. Dirvos įdirbimo įrankis pagal vieną iš 5-7 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad lizdo paviršiai (14.1) sumontuoti nutolę vienas nuo kito atstumu nuo 8 mm iki 14 mm.

9. Dirvos įdirbimo įrankis pagal 5-8 punktus, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kontaktiniai paviršiai (14.2) sumontuoti nutolę vienas nuo kito ne mažiau kaip 4 mm, pageidautina, atstumu nuo 10 mm iki 15 mm.

10. Dirvos įdirbimo įrankis pagal vieną iš 1-9 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad ir pagrindinio pjovimo elementas, ir antrinio pjovimo elementai (20, 21) turi kreipiamuosius paviršius (20.4; 21.4), kurie išdėstyti lygiagrečiai vienas kitam ir nutolę viena nuo kito ne mažiau kaip 4 mm, pageidautina, atstumu nuo 5 mm iki 11 mm.

11. Dirvos įdirbimo įrankis pagal vieną iš 1-10 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kreipiamieji paviršiai (20.4; 21.4) išdėstyti kampu, pageidautina, ribose nuo 0,1° iki 90°, vienas kito atžvilgiu.

12. Dirvos įdirbimo įrankis pagal vieną iš 1-11 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad antrinio pjovimo elementai (21) išdėstyti ant pjovimo briaunų laikiklio (13) simetriškai iš abiejų pusių, atsižvelgiant į pagrindinio pjovimo elementą (20).

13. Dirvos įdirbimo įrankis pagal vieną iš 1-12 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad ne mažiau kaip du antrinio pjovimo elementai (21) kiekvienu atveju išdėstyti iš abiejų pagrindinio pjovimo elemento (20) pusių.

14. Dirvos įdirbimo įrankis pagal vieną iš 1-13 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad antrinio pjovimo elementų (21) pjovimo briaunos plotis (21.3) yra bent 0,5 karto didesnis už pagrindinio pjovimo elemento (20) pjovimo briaunos plotį (20.3).

15. Dirvos įdirbimo įrankis pagal vieną iš 1-14 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad pagrindinio pjovimo elemento (20) pjovimo briauna (20.3) yra atitraukta skersai krypties į priekį (V) atžvilgiu ir svorio kryptimi antrinio pjovimo elemento (21) pjovimo briaunos (21.3) atžvilgiu.

16. Dirvos įdirbimo įrankis pagal vieną iš 1-15 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad atraminė dalis (10) turi išsikišančią trupintuvo sienelę (16) ir (arba) įgilintą trupintuvo griovelį (17).

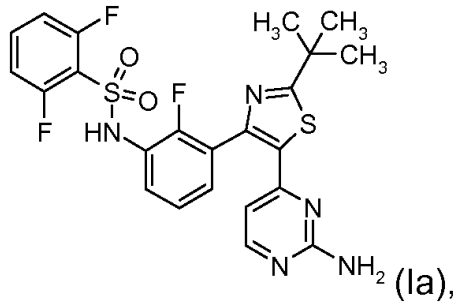
---

*(51)* Int.Cl. ***A01N 43/42*** (2006.01)
*(11)* **2282636**
*(96)* 09743378.3
*(96)* 2009-05-04
*(97)* 2011-02-16
*(97)* 2016-03-23
*(86)* PCT/US2009/042682
*(86)* 2009-05-04
*(87)* WO 2009/137391
*(87)* 2009-11-12
*(30)* 50744, 2008-05-06, US
*(72)* ADAMS, Jerry, Leroy, US
DICKERSON, Scott, Howard, US
JOHNSON, Neil, W., US
KUNTZ, Kevin, US
PETROV, Kimberly, US
RALPH, Jeffrey, M., US
RHEAULT, Tara Renae, US
SCHAAF, Gregory, US
STELLWAGEN, John, US
TIAN, Xinrong, US
UEHLING, David Edward, US
WATERSON, Alex Gregory, US
WILSON, Brian, US
ADJABENG, George, US
HORNBERGER, Keith, US
*(73)* Novartis AG, 4056 Basel, CH
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

*(54)* Benzensulfonamido tiazolo ir oksazolo junginiai

Apibrėžties punktai: 19, brėžiniai: 0.

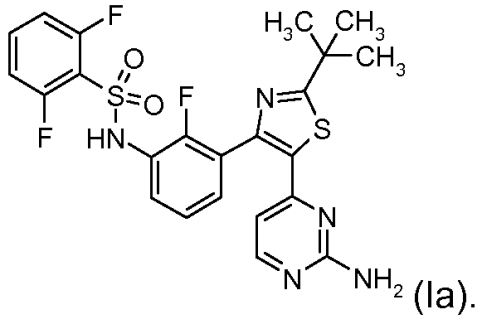
*(57)* 1. N-{3-[5-(2-amino-4-pirimidinil)-2-(1,1-dimetiletil)-1,3-tiazol-4-il]-2-fluorfenil}-2,6-difluorbenzensulfonamidas, kuris yra formulės (Ia) junginys




(Ia),

arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

2. N-{3-[5-(2-amino-4-pirimidinil)-2-(1,1-dimetiletil)-1,3-tiazol-4-il]-2-fluorfenil}-2,6-difluorbenzensulfonamido farmaciniu požiūriu priimtina druska, kuri yra formulės (Ia) junginys




(Ia).

3. N-{3-[5-(2-amino-4-pirimidinil)-2-(1,1-dimetiletil)-1,3-tiazol-4-il]-2-fluorfenil}-2,6-difluorbenzensulfonamido mezilatas.

4. N-{3-[5-(2-amino-4-pirimidinil)-2-(1,1-dimetiletil)-1,3-tiazol-4-il]-2-fluorfenil}-2,6-difluorbenzensulfonamidas.

5. Farmacinė kompozicija, apimanti junginį, kurio formulė (Ia), arba farmaciniu požiūriu priimtiną jo druską pagal bet kurį iš 1-4 punktą, ir, pasirinktinai, papildomai apimanti vieną arba daugiau farmaciniu požiūriu priimtinų nešiklių, skiediklių arba užpildų.

6. Farmacinė kompozicija pagal 5 punktą vienetinės vaisto formos pavidale.

7. Farmacinė kompozicija pagal 6 punktą, kur vienetinė vaisto forma turi nuo 1 mg iki 700 mg junginio, turinčio formulę (Ia) arba farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos pagal bet kurį iš 1-4 punktą.

8. Farmacinė kompozicija pagal 7 punktą, kur vienetinė vaisto forma turi nuo 5 mg iki 100 mg junginio, turinčio formulę (Ia) arba farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos.

9. Derinys, apimantis junginį, kurio formulė (Ia), arba farmaciniu požiūriu priimtiną jo druską pagal bet kurį iš 1-4 punktą, ir bent vieną antineoplazinį agentą.

10. Derinys pagal 9 punktą, kur antineoplazinis agentas yra serino (treonino) kinazių inhibitorius.

11. Derinys pagal 10 punktą, kur serino (treonino) kinazių inhibitorius yra mitogeno arba ląstelės išorėje reguliuojamų kinazių (MEK) inhibitorius.

12. Junginys, kurio formulė (Ia), arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska pagal bet kurį iš 1-4 punktą, arba derinys pagal bet kurį iš 9-11 punktą, skirti naudoti terapijoje.

13. Junginys, kurio formulė (Ia), arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska pagal bet kurį iš 1-4 punktą, arba farmacinė kompozicija pagal bet kurį iš 5-8 punktą, arba derinys pagal bet kurį iš 9-11 punktą, skirti naudoti žmogaus jautrios vaistams neoplazmos gydymui.

14. Junginio, kurio formulė (Ia), arba farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos pagal bet kurį iš 1-4 punktą, arba farmacinės kompozicijos pagal bet kurį iš 5-8 punktą, arba derinio pagal bet kurį iš 9-11 punktą panaudojimas gamyboje medikamento, skirto žmogaus jautrios vaistams neoplazmos gydymui.

15. Junginys, farmacinė kompozicija arba derinys, skirti naudoti pagal 13 punktą, arba junginio, farmacinės kompozicijos arba derinio panaudojimas pagal 14 punktą, kur minėta jautri vaistams neoplazma yra parinkta iš krūties vėžio, cholangiokarcinomos, gaubtinės žarnos vėžio, melanomos, ne-smulkiųjų ląstelių plaučių vėžio, kiaušidžių vėžio ir skydliaukės vėžio.

16. Junginys, farmacinė kompozicija arba derinys, skirti naudoti pagal 13 punktą, arba junginio, farmacinės kompozicijos arba derinio panaudojimas pagal 14 punktą, kur minėta jautri vaistams neoplazma yra melanoma.

17. Junginys, farmacinė kompozicija arba derinys, skirti naudoti, arba junginio, farmacinės kompozicijos arba derinio panaudojimas pagal 16 punktą, kur minėta melanoma yra metastazinė melanoma.

18. Junginys, farmacinė kompozicija arba derinys, skirti naudoti pagal 13 punktą, arba junginio, farmacinės kompozicijos arba derinio panaudojimas pagal 14 punktą, kur minėta jautri vaistams neoplazma yra neoplazma, demonstruojanti mutaciją BRaf.

19. Junginys, farmacinė kompozicija arba derinys, skirti naudoti, arba junginio, farmacinės kompozicijos arba derinio panaudojimas pagal 18 punktą, kur mutacija pasireiškia BRaf, turinčiame V600E aminorūgšties pakeitimą.

---

*(51)* Int.Cl. ***A01N 43/56*** (2006.01)
***A01N 43/58*** (2006.01)
***C07D 401/14*** (2006.01)
***C07D 403/12*** (2006.01)
***C07D 405/14*** (2006.01)
***C07D 411/14*** (2006.01)
***C07D 417/14*** (2006.01)
***C07D 409/14*** (2006.01)
*(11)* **2699563**
*(96)* 12713758.6
*(96)* 2012-04-16
*(97)* 2014-02-26
*(97)* 2016-04-06
*(86)* PCT/EP2012/056875
*(86)* 2012-04-16
*(87)* WO 2012/143317
*(87)* 2012-10-26
*(30)* 201161477620 P, 2011-04-21, US
*(72)* DEFIEBER, Christian, DE
SÖRGEL, Sebastian, DE
SÄLINGER, Daniel, DE
LE VEZOUET, Ronan, DE
KÖRBER, Karsten, DE
GROß , Steffen, DE
CULBERTSON, Deborah L., US
GUNJIMA, Koshi, US

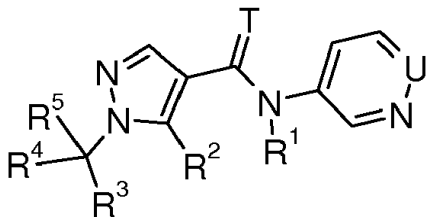
*(73)* BASF SE, 67056 Ludwigshafen am Rhein, DE

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

*(54)* Naujieji pesticidiniai pirazolo junginiai

Apibrėžties punktai: 17, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Naujieji pirazolo junginiai, kurių formulė I:



I

kurioje:

U yra N arba CH;

T yra O arba S;

$R^1$ yra H, $C_1$-$C_2$-alkilas arba $C_1$-$C_2$-alkoksi-$C_1$-$C_2$-alkilas;

$R^2$ yra $CH_3$ arba halometilas;

$R^3$ yra $C_2$-$C_6$-alkilas, $C_1$-$C_6$-haloalkilas, $C_1$-$C_2$-alkoksi-$C_1$-$C_2$-alkilas, $C_2$-$C_6$-alkenilas ir $C_2$-$C_6$-alkinilas, $C_3$-$C_6$-cikloalkilas, $C_5$-$C_6$-cikloalkenilas, $C_1$-$C_6$-alkoksi, CN, $NO_2$, $S(O)_nR^b$, kur C atomai gali būti nepakeisti, arba iš dalies arba pilnai pakeisti $R^a$;

$R^a$ yra halogenas, CN, $NO_2$, $C_1$-$C_2$-alkilas, $C_1$-$C_2$-haloalkilas, $C_1$-$C_4$-alkoksi, $C_1$-$C_2$-halo-alkoksi arba $S(O)_nR^b$;

n yra 0, 1 arba 2;

$R^b$ yra vandenilis, $C_1$-$C_2$-alkilas, $C_1$-$C_2$-haloalkilas, $C_3$-$C_6$-cikloalkilas arba $C_1$-$C_4$-alkoksi,

$R^4$ yra $C_1$-$C_4$-alkilas arba kaip $R^3$ aprašyta grupė;

$R^5$ yra H arba kaip $R^4$ aprašyta grupė;

$R^3$ ir $R^4$ kartu gali sudaryti nuo tri- iki šešianario karbo- arba heterociklą, kuris gali turėti 1 arba 2 heteroatomus, parinktus iš N-Rc, O ir S, kur S gali būti oksiduota, kur karbo- arba heterociklas gali būti pakeistas $R^a$;

$R^c$ yra vandenilis, $C_1$-$C_2$-alkilas, $C_1$-$C_2$-haloalkilas, $C_1$-$C_2$-alkilkarbonilas arba $C_1$-$C_2$-alkoksi-karbonilas;

ir jų stereoizomerai, druskos, tautomerai ir N-oksidai.

2. I formulės junginiai pagal 1 punktą, kur U yra CH.

3. I formulės junginiai pagal 1 punktą, kur U yra N.

4. I formulės junginiai pagal 1 punktą, kur T yra O.

5. I formulės junginiai pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kur $R^1$ yra H, $C_1$-$C_2$-alkilas arba $C_1$-$C_2$-alkoksimetilas.

6. I formulės junginiai pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kur $R^2$ yra $CH_3$, $CHF_2$ arba $CF_3$.

7. I formulės junginiai pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kur $R^3$ yra CN, $C_2$-$C_6$-alkilas, $C_1$-$C_2$-haloalkilas, $C_1$-$C_2$-alkoksi-$C_1$-$C_2$-alkilas arba $C_3$-$C_6$-cikloalkilas, kur C atomai gali būti pakeisti.

8. I formulės junginiai pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kur $R^4$ yra $C_1$-$C_4$-alkilas, $C_1$-$C_4$-haloalkilas arba $C_3$-$C_6$-cikloalkilas, kur C-atomai gali būti pakeisti.

9. I formulės junginiai pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kur $R^5$ yra H arba $CH_3$.

10. I formulės junginiai pagal 1 punktą, kurie yra parinkti iš šio sąrašo:

| Nr. | T | U | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | $R^4$ | $R^5$ |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1. | O | N | H | $CH_3$ | $-CH_2CH_2-$ | | H |
| 2. | O | N | H | $CH_3$ | $CH_2S(O)_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 3. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2S(O)_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 4. | O | N | H | $CH_3$ | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 5. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 6. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_4-$ | | H |
| 7. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_4-$ | | H |
| 8. | O | N | H | $CH_3$ | $-(CH_2)_4-$ | | H |
| 9. | O | N | H | $CH_3$ | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | H |
| 10. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | H |
| 11. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | H |
| 12. | O | N | H | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | H |
| 13. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | H |
| 14. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | H |
| 15. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_3-$ | | H |
| 16. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_3-$ | | H |
| 17. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2C(CH_3)_2OCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 18. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2C(CH_3)_2OCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 19. | O | N | H | $CH_3$ | $-(CH_2)_3-$ | | H |
| 20. | O | N | H | $CH_3$ | $CH_2C(CH_3)_2OCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 21. | O | N | H | $CH_3$ | $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ | | H |
| 22. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ | | H |
| 23. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ | | H |
| 24. | O | N | $CH_2OCH_2CH_3$ | $CH_3$ | $c\text{-}C_3H_5$ | $CH_3$ | H |

| Nr. | T | U | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | $R^4$ | $R^5$ |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 25. | O | N | H | $CH_3$ | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 26. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 27. | O | N | $CH_2OCH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 28. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_2CHFCF_3$ | $CH_3$ | H |
| 29. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_2CHF_2$ | $CH_3$ | H |
| 30. | O | N | H | $CH_3$ | $CF_2CHFCF_3$ | $CH_3$ | H |
| 31. | O | N | H | $CH_3$ | $CF_2CHF_2$ | $CH_3$ | H |
| 32. | O | N | H | $CH_3$ | CN | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 33. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | CN | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 34. | O | N | H | $CH_3$ | $CF_3$ | $CF_3$ | H |
| 35. | O | N | H | $CH_3$ | CN | $CH_3$ | H |
| 36. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | CN | $CH_3$ | H |
| 37. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CF_3$ | H |
| 38. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CF_3$ | H |
| 39. | O | N | H | $CH_3$ | 1-F-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 40. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | 1-F-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 41. | O | N | H | $CH_3$ | $C(CH_3)_3$ | $CH_3$ | H |
| 42. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $C(CH_3)_3$ | $CH_3$ | H |
| 43. | O | N | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | $C(CH_3)_3$ | $CH_3$ | H |
| 44. | O | C | H | $CH_3$ | $C(CH_3)_3$ | $CH_3$ | H |
| 45. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $C(CH_3)_3$ | $CH_3$ | H |
| 46. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $C(CH_3)_3$ | $CH_3$ | H |
| 47. | O | N | H | $CH_3$ | $CH_2CH_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 48. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CH_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 49. | O | N | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CH_3$ | $CH_2CH_3$ | H |

| Nr. | T | U | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | $R^4$ | $R^5$ |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 50. | O | C | H | $CH_3$ | $CH_2CH_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 51. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CH_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 52. | O | N | H | $CF_3$ | $CH_2CH_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 53. | O | N | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_2CH_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 54. | O | N | $CH_2OCH_3$ | $CF_3$ | $CH_2CH_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 55. | O | C | H | $CF_3$ | $CH_2CH_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 56. | O | N | H | $CF_3$ | $C(CH_3)_3$ | $CH_3$ | H |
| 57. | O | N | $CH_3$ | $CF_3$ | $C(CH_3)_3$ | $CH_3$ | H |
| 58. | O | N | $CH_2OCH_3$ | $CF_3$ | $C(CH_3)_3$ | $CH_3$ | H |
| 59. | O | C | H | $CF_3$ | $C(CH_3)_3$ | $CH_3$ | H |
| 60. | O | C | $CH_2OCH_2CH_3$ | $CH_3$ | c-$C_3H_5$ | $CH_3$ | H |
| 61. | S | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 62. | S | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | c-$C_3H_5$ | $CH_3$ | H |
| 63. | S | C | H | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 64. | S | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 65. | O | N | H | $CH_3$ | -$CCl_2CH_2$- | | H |
| 66. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | -$CCl_2CH_2$- | | H |
| 67. | O | C | $CH_2OCH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 68. | O | N | H | $CH_3$ | $CH=CH_2$ | $CH_3$ | H |
| 69. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH=CH_2$ | $CH_3$ | H |
| 70. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH=CH_2$ | $CH_3$ | H |
| 71. | O | N | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | $CH=CH_2$ | $CH_3$ | H |
| 72. | O | C | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_2CH_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 73. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | -$CH_2CH_2N(CH_3)CH_2CH_2$- | | H |
| 74. | O | N | H | $CH_3$ | $CH_2CN$ | $CH_3$ | H |

| Nr. | T | U | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | $R^4$ | $R^5$ |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 75. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CN$ | $CH_3$ | H |
| 76. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CN$ | $CH_3$ | H |
| 77. | O | N | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CN$ | $CH_3$ | H |
| 78. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CN$ | $CH_3$ | H |
| 79. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 80. | O | N | H | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 81. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 82. | O | N | H | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | CN |
| 83. | O | C | H | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 84. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | CN |
| 85. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 86. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 87. | O | N | $CH_2OCH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 88. | O | N | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 89. | O | N | H | $CH_3$ | $-CH_2CH_2N(CH_3)CH_2CH_2-$ | | H |
| 90. | O | C | H | $CH_3$ | $-CH_2CH_2N(CH_3)CH_2CH_2-$ | | H |
| 91. | O | C | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 92. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | 1-CN-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 93. | O | N | H | $CH_3$ | 1-CN-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 94. | O | C | H | $CH_3$ | $CH_2CN$ | $CH_3$ | H |
| 95. | O | N | H | $CH_3$ | $CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 96. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 97. | O | N | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | $CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 98. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 99. | O | C | H | $CH_3$ | $CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |

| Nr. | T | U | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | $R^4$ | $R^5$ |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 100. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 101. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 102. | O | N | H | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 103. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 104. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 105. | O | N | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 106. | O | C | H | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 107. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 108. | O | C | $CH_2CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_2CH_3$ | H |
| 109. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CN$ | $CH_3$ | H |
| 110. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | $CF_3$ |
| 111. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | $CF_3$ |
| 112. | O | N | $H_2OCH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | $CF_3$ |
| 113. | O | N | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | $CF_3$ |
| 114. | O | N | H | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | $CF_3$ |
| 115. | O | C | $CH_2OCH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 116. | O | C | H | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | $CF_3$ |
| 117. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | $CF_3$ |
| 118. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | $CF_3$ |
| 119. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ | | $CF_3$ |
| 120. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ | | $CF_3$ |
| 121. | O | N | H | $CH_3$ | $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ | | $CF_3$ |
| 122. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ | | $CF_3$ |
| 123. | O | C | H | $CH_3$ | $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ | | $CF_3$ |
| 124. | O | N | H | $CH_3$ | $CH_2CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | H |

| Nr. | T | U | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | $R^4$ | $R^5$ |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 125. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 126. | O | C | H | $CH_3$ | $CH_2CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 127. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 128. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 129. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 130. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | CN |
| 131. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | CN |
| 132. | O | N | H | $CH_3$ | $CH_2F$ | $CH_3$ | H |
| 133. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2F$ | $CH_3$ | H |
| 134. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2F$ | $CH_3$ | H |
| 135. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2F$ | $CH_3$ | H |
| 136. | O | C | H | $CH_3$ | $CH_2F$ | $CH_3$ | H |
| 137. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2F$ | $CH_3$ | H |
| 138. | O | C | H | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | CN |
| 139. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-(CH_2)_5-$ | | CN |
| 140. | O | N | H | $CH_3$ | $CHFCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 141. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CHFCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 142. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CHFCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 143. | O | C | H | $CH_3$ | $CHFCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 144. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CHFCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 145. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CHFCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 146. | O | N | H | $CH_3$ | $CHFCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 147. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CHFCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 148. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CHFCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 149. | O | C | H | $CH_3$ | $CHFCH_3$ | $CH_3$ | H |

| Nr. | T | U | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | $R^4$ | $R^5$ |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 150. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ | | $CF_3$ |
| 151. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ | | $CF_3$ |
| 152. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | CN | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 153. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2CH_2-$ | | CN |
| 154. | O | N | H | $CH_3$ | $-CH_2CH_2-$ | | CN |
| 155. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2CH_2-$ | | CN |
| 156. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CHFCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 157. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CHFCH_3$ | $CH_3$ | H |
| 158. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | CN | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 159. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | 1-CN-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 160. | O | N | H | $CH_3$ | $CHF_2$ | $CH_3$ | H |
| 161. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CHF_2$ | $CH_3$ | H |
| 162. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CHF_2$ | $CH_3$ | H |
| 163. | O | C | H | $CH_3$ | $CHF_2$ | $CH_3$ | H |
| 164. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CHF_2$ | $CH_3$ | H |
| 165. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CHF_2$ | $CH_3$ | H |
| 166. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2S(O)_2CH_2-$ | | H |
| 167. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2S(O)_2CH_2-$ | | H |
| 168. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2CH_2N[C(O)CH_3]CH_2CH_2-$ | | H |
| 169. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2S(O)_2CH_2-$ | | H |
| 170. | O | C | H | $CH_3$ | $-CH_2S(O)_2CH_2-$ | | H |
| 171. | O | N | H | $CH_3$ | $-CH_2S(O)_2CH_2-$ | | H |
| 172. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2S(O)_2CH_2-$ | | H |
| 173. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2SCH_2-$ | | H |
| 174. | O | N | H | $CH_3$ | $-CH_2SCH_2-$ | | H |

| Nr. | T | U | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | $R^4$ | $R^5$ |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 175. | O | C | H | $CH_3$ | $-CH_2SCH_2-$ | | H |
| 176. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2SCH_2-$ | | H |
| 177. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2SCH_2-$ | | H |
| 178. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH(CH_3)_2$ | $CH(CH_3)_2$ | H |
| 179. | O | N | H | $CH_3$ | $CH(CH_3)_2$ | $CH(CH_3)_2$ | H |
| 180. | O | C | H | $CH_3$ | $CH(CH_3)_2$ | $CH(CH_3)_2$ | H |
| 181. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH(CH_3)_2$ | $CH(CH_3)_2$ | H |
| 182. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH(CH_3)_2$ | $CH(CH_3)_2$ | H |
| 183. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH(CH_3)_2$ | $CH(CH_3)_2$ | H |
| 184. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2SCH_2-$ | | H |
| 185. | O | N | H | $CH_3$ | $-CH_2S(O)CH_2-$ | | H |
| 186. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2S(O)CH_2-$ | | H |
| 187. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | CN | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 188. | O | C | H | $CH_3$ | CN | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 189. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $-CH_2S(O)CH_2-$ | | H |
| 190. | O | C | H | $CH_3$ | $-CH_2S(O)CH_2-$ | | H |
| 191. | O | N | H | $CH_3$ | $CH(CH_2CH_3)CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 192. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH(CH_2CH_3)CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 193. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH(CH_2CH_3)CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 194. | O | C | H | $CH_3$ | $CH(CH_2CH_3)CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 195. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH(CH_2CH_3)CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 196. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH(CH_2CH_3)CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 197. | O | N | H | $CH_3$ | $CH_2CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 198. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 199. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |

| Nr. | T | U | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | $R^4$ | $R^5$ |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 200. | O | C | H | $CH_3$ | $CH_2CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 201. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 202. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 203. | O | N | H | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH(CH_3)_2$ | H |
| 204. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH(CH_3)_2$ | H |
| 205. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH(CH_3)_2$ | H |
| 206. | O | C | H | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH(CH_3)_2$ | H |
| 207. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH(CH_3)_2$ | H |
| 208. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH(CH_3)_2$ | H |
| 209. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $c\text{-}C_3H_5$ | H |
| 210. | O | N | H | $CH_3$ | $CF_3$ | $c\text{-}C_3H_5$ | H |
| 211. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $c\text{-}C_3H_5$ | H |
| 212. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $c\text{-}C_3H_5$ | H |
| 213. | O | C | H | $CH_3$ | $CF_3$ | $c\text{-}C_3H_5$ | H |
| 214. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $c\text{-}C_3H_5$ | H |
| 215. | O | N | H | $CH_3$ | $1\text{-}S(O)_2CH_3\text{-}c\text{-}C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 216. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $1\text{-}S(O)_2CH_3\text{-}c\text{-}C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 217. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $1\text{-}S(O)_2CH_3\text{-}c\text{-}C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 218. | O | C | H | $CH_3$ | $1\text{-}S(O)_2CH_3\text{-}c\text{-}C_3H_4I$ | $CH_3$ | H |
| 219. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $1\text{-}S(O)_2CH_3\text{-}c\text{-}C_3H_4I$ | $CH_3$ | H |
| 220. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $1\text{-}S(O)_2CH_3\text{-}c\text{-}C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 221. | O | C | $CH_3$ | $CF_3$ | $C(CH_3)_3$ | $CH_3$ | H |
| 222. | O | N | H | $CH_3$ | $1\text{-}CH_3\text{-}c\text{-}C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 223. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $1\text{-}CH_3\text{-}c\text{-}C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 224. | O | C | H | $CH_3$ | $1\text{-}CH_3\text{-}c\text{-}C_3H_4$ | $CH_3$ | H |

| Nr. | T | U | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | $R^4$ | $R^5$ |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 225. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | 1-$CH_3$-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 226. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | 2,2-$Cl_2$-c-$C_3H_3$ | $CH_3$ | H |
| 227. | O | N | H | $CH_3$ | -$CH_2CH_2N[C(O)CH_3]CH_2CH_2$- | | H |
| 228. | O | N | H | $CH_3$ | $C(CH_3)_2CN$ | $CH_3$ | H |
| 229. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $C(CH_3)_2CN$ | $CH_3$ | H |
| 230. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $C(CH_3)_2CN$ | $CH_3$ | H |
| 231. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 232. | O | N | H | $CH_3$ | $CH_2CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 233. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | 1-$CH_3$-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 234. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | 2,2-$Cl_2$-c-$C_3H_3$ | $CH_3$ | H |
| 235. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | 2,2-$Cl_2$-c-$C_3H_3$ | $CH_3$ | H |
| 236. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | 2,2-$Cl_2$-c-$C_3H_3$ | $CH_3$ | H |
| 237. | O | N | H | $CH_3$ | 2,2-$Cl_2$-c-$C_3H_3$ | $CH_3$ | H |
| 238. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CH_2CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 239. | O | N | H | $CH_3$ | 1-$SCH_3$-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 240. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | 1-$SCH_3$-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 241. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | 1-$SCH_3$-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 242. | O | C | H | $CH_3$ | 1-$SCH_3$-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 243. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | 1-$SCH_3$-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 244. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | 1-$SCH_3$-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 245. | O | C | H | $CH_3$ | 2,2-$Cl_2$-c-$C_3H_3$ | $CH_3$ | H |
| 246. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | 1-$CH_3$-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 247. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $C(CH_3)_3$ | H |
| 248. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $C(CH_3)_3$ | H |

| Nr. | T | U | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | $R^4$ | $R^5$ |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 249. | O | N | H | $CH_3$ | $CF_3$ | $C(CH_3)_3$ | H |
| 250. | O | N | H | $CH_3$ | 1-$CF_3$-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 251. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | 1-$CF_3$-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 252. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | 1-$CF_3$-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 253. | O | N | H | $CH_3$ | c-$C_3H_5$ | $CH_3$ | H |
| 254. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | c-$C_3H_5$ | $CH_3$ | H |
| 255. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 256. | O | N | H | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 257. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 258. | O | N | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | c-$C_3H_5$ | $CH_3$ | H |
| 259. | O | N | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 260. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | c-$C_3H_5$ | $CH_3$ | H |
| 261. | O | C | H | $CH_3$ | c-$C_3H_5$ | $CH_3$ | H |
| 262. | O | C | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | c-$C_3H_5$ | $CH_3$ | H |
| 263. | O | C | H | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 264. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 265. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | c-$C_3H_5$ | $CH_3$ | H |
| 266. | O | C | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 267. | O | C | $CH_2OCH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 268. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 269. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |
| 270. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | c-$C_3H_5$ | $CH_3$ | H |
| 271. | O | N | $CH_3$ | $CH_3$ | c-$C_3H_5$ | $CH_3$ | H |

11. I formulės junginiai pagal 1 punktą, kurie yra parinkti iš šio sąrašo:

| Nr. | T | U | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | $R^4$ | $R^5$ |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 32. | O | N | H | $CH_3$ | CN | $CH_3$ | $CH_3$ |
| 98. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | $CH(CH_3)_2$ | $CH_3$ | H |
| 159. | O | N | $CH_2CH_3$ | $CH_3$ | 1-CN-c-$C_3H_4$ | $CH_3$ | H |
| 162. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CHF_2$ | $CH_3$ | H |
| 264. | O | C | $CH_3$ | $CH_3$ | $CF_3$ | $CH_3$ | H |

12. Kompozicija, apimanti mažiausiai vieną junginį pagal bet kurį iš 1 – 11 punktų ir mažiausiai vieną inertinį skystą ir/arba kietą nešiklį.

13. Žemės ūkio kompozicija, skirta kovai su gyvūnų parazitais, apimanti mažiausiai vieną junginį pagal bet kurį iš 1 – 11 punktų ir mažiausiai vieną inertinį skystą ir/arba kietą nešiklį ir, jeigu pageidaujama, mažiausiai vieną paviršiaus aktyvumo medžiagą.

14. Neterapinis būdas, skirtas kovais su arba kontrolei bestuburių parazitų, kur būdas apima minėto parazito arba jo maisto, arealo arba veisimosi vietų kontaktavimą su mažiausiai vieno junginio pagal bet kurį iš 1 – 11 punktų pesticidiniu požiūriu veiksmingu kiekiu.

15. Augančių augalų apsaugos nuo bestuburių parazitų poveikio arba užsikrėtimo būdas, kur būdas apima augalo, dirvožemio arba vandens, kuriame augalas auga, kontaktavimą su junginio pagal bet kurį iš 1 – 11 punktų pesticidiniu požiūriu veiksmingu kiekiu.

16. Sėkla, apimanti junginį pagal bet kurį iš 1 – 11 punktų arba jo enantiomerus, diastereomerus arba druskas nuo 0,1 g iki 10 kg per 100 kg sėklų kiekio.

17. Junginių pagal bet kurį iš 1 – 11 punktų panaudojimas augančių augalų apsaugai nuo bestuburių parazitų poveikio arba užsikrėtimo.

---

*(51)* Int.Cl. ***A23L 33/105*** (2006.01)
***A61K 36/28*** (2006.01)
***A61P 27/02*** (2006.01)
*(11)* **2473065**
*(96)* 10760417.5
*(96)* 2010-09-02
*(97)* 2012-07-11
*(97)* 2016-04-13
*(86)* PCT/IB2010/002188
*(86)* 2010-09-02
*(87)* WO 2011/027209
*(87)* 2011-03-10
*(30)* 256667 P, 2009-10-30, US
MU20082009, 2009-09-02, IN
*(72)* KUMAR T., K., Sunil, IN
P. ABDULKADIR, Sherena, IN
*(73)* OmniActive Health Technologies Ltd., Maharashtra 400 013, IN
*(74)* Genė Ona SRUOGIENĖ, 12, UAB TARPINĖ, A.P.Kavoliuko g. 24-152, LT-04328 Vilnius, LT

*(54)* Ksantofilo kompozicija, turinti makulos pigmentų, ir jos gavimo būdas

Apibrėžties punktai: 6, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Ksantofilo kompozicija, turinti makulos pigmentų, susidedančių iš transliuteino ir zeaksantino izomerų, būtent (R,R)-zeaksantino ir (R,S)-zeaksantino, gaunamų iš augalų ekstrakto/oleorezino, turinčio ksantofilų/ksantofilų esterių, kurie yra saugūs žmogui vartoti ir tinkami maistui ir sveikatos priežiūrai, kurie sudaro bent 80 % bendros ksantofilų masės, kurioje transliuteino ir zeaksantino izomerų santykis yra ribose nuo 4:1 iki 6:1, ir zeaksantino izomerų santykis yra ribose nuo 80 iki 20 : 20 iki 80.

2. Ksantofilo kompozicija kaip pareikšta 1 punkte, kur kompozicija turi bent 85 % bendros ksantofilų masės, kurioje transliuteino kiekis yra bent 85 %.

3. Ksantofilo kompozicija kaip pareikšta 1 punkte, kur kompozicija turi bent 85 % bendros ksantofilų masės, kurioje bent 80 masės % yra transliuteinas, likusieji 15 masės % yra zeaksantino izomerai, būtent (R,R)-zeaksantinas ir (R,S)-zeaksantinas.

4. Ksantofilo kompozicijos, turinčios makulos pigmentų, susidedančių iš transliuteino, zeaksantino izomerų, būtent (R,R)-zeaksantino ir (R,S)-zeaksantino, gaunamų iš augalų ekstrakto/oleorezino, turinčio ksantofilų/ksantofilų esterių, kurie yra saugūs žmogui vartoti ir tinkami maistui bei sveikatos priežiūrai, gavimo būdas, kuris apima:

(a) ksantofilo esterių, esančių augalų ekstrakte/oleorezine, turinčiame ksantofilo esterių, muilinimą ir dalinę izomerizaciją tuo pačiu metu sumaišant ekstraktą/oleorezeiną su 1-propanolio šarminiu tirpalu, esant šarmo ir 1-propanolio masė/tūris santykiui ribose nuo 1:0,5 iki 1:1, gautos masės kaitinimą esant temperatūrai 70-100 °C ribose, geriau esant 95 °C, laiko intervale nuo 1 iki 5 valandų, kad būtų gautas muilintas/izomerizuotas žalias koncentratas;

(b) muilinto/izomerizuoto žalio koncentrato, gauto (a) pakopoje, sumaišymą su vandeniu, naudojamų koncentrato ir vandens tūris/tūris santykis yra ribose nuo 1:2 iki 1:3, kad susidarytų atskiesta aliejinė mikstūra;

(c) atskiestos aliejinės mikstūros, gautos (b) pakopoje, ekstrahavimą etilo acetatu, naudojamų praskiestos aliejinės mikstūros ir etanolio acetato tūris/tūris santykis yra ribose nuo 1:1,5 iki 1:2, kad būtų gautas ekstraktas, turintis ksantofilo kompoziciją;

(d) kompozicijos, gautos (c) pakopoje nugarinimą, kad būtų pašalintas etilo acetatas;

(e) kompozicijos, gautos (d) pakopoje, gryninimą perplaunant iš pradžių poliniu ir po to nepoliniu tirpikliais, ir filtravimą;

(f) gautos kompozicijos džiovinimą vakuume esant temperatūrai ribose nuo 40 iki 45 °C laikotarpio ribose nuo 48 iki 72 valandų;

(g) jeigu norima, (c) pakopoje naudoto etilo acetato regeneravimą įprastiniais būdais ir, jeigu reikia, pakartotinį panaudojimą; ir

(h) gautos kompozicijos laikymą inertinėje atmosferoje esant -20 °C.

5. Būdas, kaip pareikšta 4 punkte, kuriame naudojamas augalų ekstraktas/oleorezinas, turintis ksantofilo esterius, yra gautas iš medetkų žiedų.

6. Būdas, kaip pareikšta 4 ir 5 punktuose, kuriame nepolinis tirpiklis, naudojamas (e) pakopoje, yra parinktas iš angliavandenilio tirpiklio, kuris yra parinktas iš pentano, heksano ir heptano, geriau heksano, ir naudojamas polinis tirpiklis yra parinktas iš žemesniojo alifatinio alkoholio.

---

*(51)* Int.Cl. ***A24D 1/00*** (2006.01)
***A24D 3/04*** (2006.01)
***A24D 3/06*** (2006.01)

*(11)* **2775865**

*(96)* 12795752.0

*(96)* 2012-11-02

*(97)* 2014-09-17

*(97)* 2016-05-04

*(86)* PCT/EP2012/071768

*(86)* 2012-11-02

*(87)* WO 2013/068304

*(87)* 2013-05-16

*(30)* 11250885, 2011-11-07, EP

*(72)* BESSO, Clement, CH

*(73)* Philip Morris Products S.A., 2000 Neuchâtel, CH

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

*(54)* Rūkomasis gaminys su skystį teikiančia medžiaga

Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 2.

*(57)* 1. Rūkomasis gaminys (10), apimantis pailginto atpalaidavimo skystį teikiančią medžiagą (20), b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad skystį teikianti medžiaga (20) sudaryta iš:

uždaros matricos struktūros, sudarančios daugybę domenų; ir

skystos kompozicijos, kuri yra sulaikyta domenuose ir atpalaiduojama iš uždaros matricos struktūros po medžiagos suspaudimo, kuriame skystį tiekianti medžiaga suteikia skystos kompozicijos pailgintą atpalaidavimą suspaudus medžiagą bent 5 Niutonų jėgos diapazone.

2. Rūkomasis gaminys pagal 1 punktą, kuriame skystį teikianti medžiaga suteikia skystos kompozicijos pailgintą atpalaidavimą suspaudžiant medžiagą nuo 10 Niutonų iki 15 Niutonų jėgos diapazone.

3. Rūkomasis gaminys pagal 1 arba 2 punktą, kuriame skystos kompozicijos kiekis, atpalaiduojamas iš skystį tiekiančios medžiagos, spaudžiant medžiagą 5 Niutonų jėga, atitinka bent 2 procentus skystį tiekiančios medžiagos masės iki bet kokio suspaudimo, ir kuriame papildomas skystos kompozicijos kiekis, kuris atpalaiduojamas dėl tolesnio medžiagos suspaudimo 10 Niutonų jėga, atitinka bent 10 procentų skystį tiekiančios medžiagos masės iki bet kokio suspaudimo.

4. Rūkomasis gaminys pagal bet kurį 1 – 3 punktą, kuriame skystos kompozicijos kiekis, atpalaiduojamas iš skystį tiekiančios medžiagos spaudžiant medžiagą 10 Niutonų jėga, atitinka bent 20 procentų skystį tiekiančios medžiagos masės iki bet kokio spaudimo ir kuriame papildomas skystos kompozicijos kiekis, kuris yra atpalaiduojamas dėl tolesnio medžiagos suspaudimo 15 Niutonų jėga, atitinka bent 10 procentų skystį tiekiančios medžiagos masės iki bet kokio suspaudimo.

5. Rūkomasis gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame skystį teikianti medžiaga suteikia skystosios kompozicijos pailgintą atpalaidavimą spaudžiant medžiagą bent 25 procentų deformacijos ribose.

6. Rūkomasis gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame skystos kompozicijos kiekis, atpalaiduotas iš skystį teikiančios medžiagos spaudžiant medžiagą iki 10 procentų deformacijos,atitinka bent 2 procentus skystį teikiančios medžiagos masės prie bet kokio spaudimo, ir kuriame skystosios kompozicijos papildomas kiekis, kuris yra atpalaiduojamas dėl tolesnio medžiagos spaudimo iki 40 procentų deformacijos, atitinka bent 10 procentų skystį teikiančios medžiagos masės iki bet kokio suspaudimo.

7. Rūkomasis gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, turintis pailginto atpalaidavimo aromatą teikiančią medžiagą, apimančią aromatinę kompoziciją.

8. Rūkomasis gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame skystį teikianti medžiaga yra aromatą teikianti medžiaga, kuriame uždara matricos struktūra yra polimero matrica, apimanti vieną arba daugiau matricą formuojančių polimerų arba plastifikatorių, ir kuriame skysta kompozicija, sukaupta daugybėje domenų, apibrėžtų polimerine matrica, yra aromatinė kompozicija, aromatinė kompozicija apima kvapniąją medžiagą, sumaišytą su vienu arba daugiau riebalų, kurie yra skysti prie kambario temperatūros (22°C).

9. Rūkomasis gaminys pagal 8 punktą, kuriame aromatą teikiančios medžiagos aromatinė kompozicija apima riebalus, turinčius bent 30 procentų vidutinės grandies trigliceridų, turinčių bent vieną karboksirūgštį, turinčią grandinės ilgį tarp 6 ir 12.

10. Rūkomasis gaminys pagal 8 arba 9 punktą, kuriame plastifikatorius aromatą teikiančios medžiagos polimero matricoje apima bent vieną polietilenglikolį ir glicerolį.

11. Rūkomasis gaminys pagal bet kurį 8 – 10 punktą, kuriame plastifikatorių kiekis polimero matricoje atitinka bent 5 procentus matricą formuojančių polimerų masės.

12. Rūkomasis gaminys pagal bet kurį 8 – 11 punktą, kuriame matricą formuojantys polimerai aromatą teikiančios medžiagos polimero matricoje turi bent vieną alginatą ir pektiną.

13. Rūkomasis gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame skystoji kompozicija turi mentolio.

14. Rūkomasis gaminys pagal bet kurį ankstesnį punktą, apimantis filtrą (12), turintį skystį teikiančią medžiagą (20).

15. Filtras (12) rūkomajam gaminiui, apimantis pailginto atpalaidavimo aromatą teikiančią skystą medžiagą (20), b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad aromatą teikianti medžiaga (20) apima:
uždaros matricos struktūrą, sudarančią daugybę domenų; ir
aromatinę kompoziciją, kuri yra sulaikyta domenuose ir atpalaiduojama iš uždaros matricos struktūros po medžiagos suspaudimo, kuriame aromatą tiekianti skysta medžiaga suteikia aromatinės kompozicijos pailgintą atpalaidavimą suspaudus medžiagą bent 5 Niutonų jėgos diapazone.

---

*(51)* Int.Cl. ***A24F 47/00*** (2006.01)
***A61M 15/06*** (2006.01)
*(11)* **2770860**
*(96)* 12808691.5
*(96)* 2012-10-25
*(97)* 2014-09-03
*(97)* 2016-04-27
*(86)* PCT/EP2012/071169
*(86)* 2012-10-25
*(87)* WO 2013/060784
*(87)* 2013-05-02
*(30)* 11250874, 2011-10-27, 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)* Elektra valdoma aerozolį generuojanti sistema, turinti aerozolio gamybos valdymą
Apibrėžties punktai: 10, brėžiniai: 5.
*(57)* 1. Būdas valdyti aerozolio gamybą aerozolį generuojančiame įrenginyje (100), įrenginys apimantis:
aerozolį generuojantį elementą (119);
srauto kanalą, suformuotą taip, kad leistų oro srautui tekėti pro aerozolį generuojantį elementą; ir
srauto daviklį (111), suformuotą pajusti oro srautą srauto kanale, apimantis šiuos žingsnius:
pirmojo parametro dydžio, susijusio su oro srauto srauto greičio kaita, nustatymą; ir
energijos tiekimo į aerozolį generuojantį elementą keitimą priklausomai nuo palyginimo tarp pirmojo parametro dydžio ir ribinio dydžio rezultatų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad pirmasis parametras yra gaunamas iš antrojo parametro, kuris yra srovės greičio matas, detektuotas srauto davikliu, ir trečiojo parametro, priklausančio srauto greičiui, derinio, ir kuriame trečiasis parametras yra temperatūra, energija, tiekiama į aerozolį generuojantį elementą, maksimalus detektuotas srauto greitis, arba srauto greičio pasikeitimo greitis, arba yra gautas iš derinio dviejų arba daugiau parametrų, kurie yra temperatūra, energija, tiekiama į aerozolį generuojantį elementą, maksimalus nustatytas srauto greitis ir srauto greičio pasikeitimo greitis.

2. Būdas pagal 1 punktą, kuriame trečiasis parametras yra temperatūra arba maksimalus srauto greitis, ir apimantis pirmojo parametro gavimo žingsnį apskaičiuojant santykį tarp antrojo ir trečiojo parametrų.

3. Būdas pagal 1 punktą, kuriame trečiasis parametras yra energija, tiekiama į aerozolį generuojantį elementą, arba srauto greičio pasikeitimo greitis, ir dar apimantis pirmojo parametro gavimo žingsnį per antrojo ir trečiojo parametrų produkto apskaičiavimą.

4. Būdas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame pirmasis parametras yra srauto greičio pasikeitimo greitis.

5. Būdas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame aerozolį generuojantis elementas yra elektra šildomas kaitinimo elementas (119) ir pirmasis parametras yra proporcingas kaitinimo elemento temperatūrai, padalintai iš srauto greičio, detektuoto srauto davikliu.

6. Būdas pagal bet kurį ankstesnį punktą, dar apimantis energijos pertiekimo žingsnį į aerozolio generavimo elementą, besiremiantį srauto greičiu, detektuotu srauto davikliu.

7. Elektra veikiantis aerozolį generuojantis įrenginys, įrenginys, apimantis: bent vieną elektrinį aerozolį generuojantį elementą (119), skirtą formuoti aerozolio formos substratą; energijos šaltinį (107), skirtą energiją tiekti bent į vieną aerozolį generuojantį elementą, elektros schemą (109), skirtą kontroliuoti energijos tiekimą iš energijos šaltinio į bent vieną aerozolį generuojantį elementą, elektros schema apima daviklį (111), skirtą detektuoti oro srautą per aerozolį generuojantį elementą, ir elektros schema yra sukonstruota:

nustatyti pirmojo parametro dydį priklausomai nuo pasikeitimo oro srauto srauto greityje; ir

sumažinti arba sustabdyti energijos tiekimą į aerozolį generuojantį elementą iki nulio, priklausomai nuo palyginimo rezultato tarp pirmojo parametro dydžio ir ribinio dydžio, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad pirmasis parametras yra gaunamas iš antrojo parametro, kuris yra srovės greičio matas, detektuotas srauto davikliu, ir trečiojo parametro, priklausančio srauto greičiui, derinio,

ir kuriame trečiasis parametras yra temperatūra, energija, tiekiama į aerozolį generuojantį elementą, maksimalus detektuotas srauto greitis, arba srauto greičio pasikeitimo greitis, arba yra gautas iš derinio dviejų arba daugiau parametrų, kurie yra temperatūra, energija, tiekiama į aerozolį generuojantį elementą, maksimalus nustatytas srauto greitis ir srauto greičio pasikeitimo greitis.

8. Elektra veikiantis aerozolį generuojantis įrenginys pagal 7 punktą, kuriame aerozolį generuojantis elementas yra elektriškai kaitinamas šildymo elementas (119) ir pirmasis parametras yra proporcingas kaitinimo elemento temperatūrai, padalintai iš srauto greičio, detektuoto srauto davikliu.

9. Kompiuterinė programa, kuri, kai veikia programuojamoje elektros schemoje elektra varomam aerozolį generuojančiam įrenginiui, įtakoja elektros schemą įgyvendinti būdą pagal 1 punktą.

10. Kompiuteriu nuskaitoma laikmena turi joje saugomą kompiuterinę programą pagal 9 punktą.

---

*(51)* Int.Cl. ***A24F 47/00*** (2006.01)
*(11)* **2797445**
*(96)* 12818790.3
*(96)* 2012-12-28
*(97)* 2014-11-05
*(97)* 2016-05-04
*(86)* PCT/EP2012/077062
*(86)* 2012-12-28
*(87)* WO 2013/098395
*(87)* 2013-07-04
*(30)* 11196232, 2011-12-30, EP
*(72)* PLOJOUX, Julien, CH
GREIM, Olivier, 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 įrenginys su pagerintu temperatūros paskirstymu
Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 6.
*(57)* 1. Aerozolį generuojantis įrenginys apimantis:

substratą talpinančią ertmę, suformuotą priimti aerozolį formuojantį substratą (2);

vidaus šildytuvą (22), patalpintą ertmėje, talpinančioje substratą; ir

išorės šildytuvą (24, 26), patalpintą ant substratą talpinančios ertmės perimetro; b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kontroleris (30), suformuotas valdyti energijos tiekimą į vidaus šildytuvą (22) arba išorės šildytuvą (24, 26), arba į abu vidaus šildytuvą ir išorės šildytuvą taip, kad išorinis šildytuvas turėtų žemesnę temperatūrą nei vidaus šildytuvas.

2. Aerozolį generuojantis įrenginys pagal 1 punktą, kuriame išorinis šildytuvas (24, 26) yra suformuotas arba valdomas suteikti, sąsajoje su vidaus šildytuvu (22), iš esmės pastovų temperatūros paskirstymą aplink ertmės perimetrą.

3. Aerozolį generuojantis įrenginys pagal 1 arba 2 punktą, kuriame kontroleris (30) yra sukonfigūruotas valdyti išorės šildytuvą (24, 26) tam, kad turėtų tarp 100 ir 200 laipsnių Celsijaus.

4. Aerozolį generuojantis įrenginys pagal 1 arba 2 punktą, kuriame kontroleris (30) yra sukonfigūruotas valdyti vidaus šildytuvą (22) tam, kad turėtų tarp 320 ir 420 laipsnių Celsijaus.

5. Aerozolį generuojantis įrenginys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame išorės šildytuvas (24, 26) yra patalpintas iš esmės simetriškai aplink substratą talpinančios ertmės perimetrą.

6. Aerozolį generuojantis įrenginys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame išorės šildytuvas (24, 26) apima daugybę išorės šildymo elementų.

7. Aerozolį generuojantis įrenginys pagal 6 punktą, kuriame išorės šildytuvas apima du šildymo elementus (24, 26), kiekvieną nusitęsusį iš dalies aplink ertmės perimetrą.

8. Aerozolį generuojantis įrenginys pagal bet kurį ankstesnį punktą, sukonfigūruotas taip, kad panaudojant, išorės šildytuvas (24, 26) turi temperatūrą žemesnę už aerozolį formuojantį formatą (2), bet aukštesnę už aplinkos temperatūrą.

9. Aerozolį generuojantis įrenginys pagal bet kurį ankstesnį punktą, dar apimantis atraminę struktūrą (50) aplink išorės šildytuvą (24, 26), atraminė struktūra apima vidaus paviršių, turintį vieną arba daugiau briaunų (56) arba išsikišimų, briaunos arba išsikišimai talpina išorės šildytuvą.

10. Aerozolį generuojantis įrenginys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame išorės šildytuvas (24, 26) yra patalpintas ant arba formuoja ertmės vidinį paviršių taip, kad naudojant išorės šildytuvas kontaktuotų su aerozolį formuojančiu substratu (2).

11. Aerozolį generuojantis įrenginys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame išorės šildytuvas (24, 26) yra numatytas ant įvorės (73), kuri yra judri įrenginio korpuso atžvilgiu.

12. Aerozolį generuojantis įrenginys pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame įrenginys yra elektra kaitinamas rūkymo įrenginys.

13. Būdas aerozolį formuojančiam substratui kaitinti, apimantis:
pirmojo šildytuvo (22), galinčio kontaktuoti su aerozolį formuojančio substrato vidaus sritimi, numatymą;
antrojo šildytuvo (24, 26), galinčio kontaktuoti su substrato išorės paviršiumi, numatymą; ir
kontrolerio (30), pasižyminčio tuo, kad kontroleris yra sukonfigūruotas valdyti pirmojo šildytuvo ir antrojo šildytuvo temperatūrą taip, kad antrasis šildytuvas būtų žemesnės temperatūros, nei pirmasis šildytuvas, numatymą.

14. Būdas pagal 13 punktą, kuriame išorės šildytuvas (24, 26) yra valdomas taip, kad palaikytų temperatūrą tarp 100 ir 200 laipsnių Celsijaus.

15. Būdas pagal 13 arba 14 punktą, kuriame vidaus šildytuvas (22) yra valdomas taip, kad palaikytų temperatūrą tarp 320 ir 420 laipsnių Celsijaus.

---

*(51)* Int.Cl. ***A45C 5/03*** (2006.01)
***A45C 13/10*** (2006.01)
*(11)* **2117372**
*(96)* 08717164.1
*(96)* 2008-02-27
*(97)* 2009-11-18
*(97)* 2016-04-13
*(86)* PCT/EP2008/052357
*(86)* 2008-02-27
*(87)* WO 2008/104558
*(87)* 2008-09-04
*(30)* 202007002966 U, 2007-02-27, DE
*(72)* MORSZECK, Dieter, DE
*(73)* RIMOWA GmbH, 50829 Köln, DE

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

*(54)* Bagažas

Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 2.

*(57)* 1. Bagažas, konkrečiai – lagaminas (1), apimantis bagažo dalis, sujungtas viena su kita užtrauktuku (10), kur bagažas apima standųjį rėmo elementą (6) ir

kur rėmo elementas (6), bent viena išorine briauna einantis palei rėmo elementą (6), apima minėto užtrauktuko (10) briaunos profilio (22) priėmimo profilį (28), kur briaunos profilis (22) savo skersinio pjūvio forma yra pritaikytas prie priėmimo profilio (28) bei pritvirtintas prie užtrauktuko (10) pirmosios šoninės dalies (18), o užtrauktuko (10) antroji šoninė dalis (16) yra pritvirtinta prie bagažo dalies (2,4), b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad briaunos profilis (22) yra sandariai įspaustas į priėmimo profilį (28) ir tuo, kad tarp priėmimo profilio išorinių briaunų yra paliktas mažesnis tarpas arba vėliau, įstačius briaunos profilį (22), tarpo dydis yra sumažinamas presavimo būdu.

2. Bagažas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad briaunos profilis (22) yra pritvirtintas, konkrečiai – prisiūtas, prie užtrauktuko (10) šoninės dalies (18) išilginės briaunos.

3. Bagažas pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 2, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad briaunos profilis (22) yra suformuotas neatskiriamai nuo užtrauktuko (10) šoninės dalies (16,18) ir įtaisytas ant užtrauktuko laisvosios briaunos.

4. Bagažas 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 briaunos profilis (22) yra sudarytas iš užtrauktuko (10) dantukų arba plastikinės spiralės.

5. Bagažas pagal 4 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad pirmojo užtrauktuko (10) šoninės dalys (16,18) yra sujungtos su atskirto antrojo užtrauktuko komponento šonine dalimi (20) ir kad minėto antrojo užtrauktuko komponento dantukai arba plastikinė spiralė (22) sukimba su priėmimo profiliu (28) kaip briaunos profilis.

6. Bagažas 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 rėmo elementas (6) sudaro uždarą bagažo profilį.

7. Bagažas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad briaunos profilis (22) yra sudarytas iš lagamino karkasą (2,4) juosiančios briaunos.

8. Bagažas 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 užtrauktuko (10) pusė, nukreipta nuo rėmo elemento (6), yra prijungta prie bagažo dalies, sudarytos iš karkaso elemento.

9. Bagažas pagal 8 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad bagažo dalis yra lagamino karkasas (2,4), pagamintas iš plastiko.

10. Bagažas pagal 8 arba 9 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad karkaso elementas yra sudarytas iš polikarbonato lakšto.

11. Bagažas pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 10, b e s i s k i r i a n t i s yra du rėmo elementai (6) ir tuo, kad užtrauktukas(10) yra įtaisytas tarp minėtų dviejų rėmo elementų (6).

12. Bagažas pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 11, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad ant rėmo elemento (6) priėmimo profilis (28) yra tik iš vienos pusės, o priešinga priėmimo profiliui (28) jo pusė yra pritvirtinta, pageidautina – neatskiriamai, prie lagamino karkaso (2,4).

13. Bagažas pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 12, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad rėmo elementas (6) yra pagamintas iš metalo.

14. Bagažas pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 13, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad užtrauktuko (10) pusė, priešinga priėmimo profiliui (28), apsiuvimo juosta (26) yra prijungta prie bagažo dalies, konkrečiai – karkaso elemento.

15. Bagažas pagal 14 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad apsiuvimo juosta (26) yra neatskiriamai pritvirtinta prie užtrauktuko šoninės dalies (16).

*(51)* Int.Cl. ***A47B 96/20*** (2006.01)
***A47B 81/06*** (2006.01)
*(11)* **2823732**
*(96)* 14175922.5
*(96)* 2014-07-07
*(97)* 2015-01-14
*(97)* 2016-04-13
*(30)* 102013213451, 2013-07-09, DE
*(72)* Neskelbiamas
*(73)* MAJA-WERK Manfred Jarosch GmbH & Co. KG, 95359 Kasendorf, DE
*(74)* Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Baldų sistema su baldų elementais
Apibrėžties punktai: 12, brėžiniai: 6.

*(57)* 1. Baldų sistema (1), apimanti bent vieną baldo elementą (4, 7, 39; 40), sudarytą iš plokštelės pavidalo pagrindinės dalies (14) su

a. pirmuoju šoniniu paviršiumi (19),

b. antruoju šoniniu paviršiumi (20), priešingu pirmajam šoniniam paviršiui (19),

c. galiniu paviršiumi (21), jungiančiu šoninius paviršius (19, 20) vieną su kitu,

d. kabelio kanalu (25; 42), įtaisytu pagrindinėje dalyje (14), kuris apima bent

i. vieną pirmąją angą (27) ir

ii. antrąją angą (29),

kur angos (27; 29) yra pasiekiamos per šoninius paviršius (19, 20) ir (arba) galinį paviršių (21), bei

e) sluoksniuotos pagrindinės dalies (14) konstrukcijos su vidiniu struktūriniu sluoksniu (15), pirmąja šonine dengiamąja plokšte (16), antrąja šonine dengiamąja plokšte (17), kur

f) struktūrinis sluoksnis (15) apima atsparumą didinantį struktūrinį elementą ir korėtos konstrukcijos (24) sutvirtinamąjį struktūrinį elementą bei

g) kabelio kanalas (25; 42) yra integruotas į struktūrinį sluoksnį (15),

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

stovo elementas (4), sujungtas su pagrindine dalimi (14), yra naudojamas baldų sistemai (1) apibrėžtai uždėti ant pagrindo (6).

2. Baldų sistema pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad kabelio kanalas (25) yra suprojektuotas kaip profilinis elementas, konkrečiai – kaip plastikinis profilinis elementas.

3. Baldų sistema pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad kabelio kanalas (42) yra apribotas bent vienu sutvirtinamuoju elementu (41) struktūrinio sluoksnio (15) atžvilgiu, konkrečiai – korėtosios konstrukcijos (24) atžvilgiu.

4. Baldų sistema pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad bent dvi pirmosios angos (27), yra išdėstytos poromis, konkrečiai – ant kabelio kanalo (25, 42) priešingų šoninių sienelių (35), ir yra pasiekiamos per šoninius paviršius (19, 20).

5. Baldų sistema pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad kabelio kanalas (25; 42) turi tiesinę kabelio kanalo išilginę ašį (26).

6. Baldų sistema pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad yra dangtelis (30), kurį galima įstatyti į pagrindinę dalį (14) ir kurį naudojant, galima uždengti pirmąją angą (27) dangtelio anga (32), atvira iš briaunos pusės.

7. Baldų sistema pagal 6 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad dangtelis (30) turi savo sukimosi ašį (33), esančią priešais dangtelio angą (32).

8. Baldų sistema pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad yra bent vienas pagrindinės dalies (14) jungiamasis elementas, skirtas prijungti prie bent vieno papildomo elemento (2, 4, 5, 7, 8).

9. Baldų sistema pagal 8 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad bent vienas jungiamasis elementas yra įtaisytas šalia pirmosios angos (27).

10. Baldų sistema pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad kiekvienos šoninės dengiamosios plokštės (16, 17) šoniniame paviršiuje yra bent po vieną angą (28), suprojektuotą kaip pailgoji kiaurymė.

11. Baldų sistema (1) pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad stovo elemento (4) padėtis yra horizontali, kur baldo elementas (7, 39; 40) yra įtaisytas taip, kad kabelio kanalas (25; 42) būtų nukreiptas iš esmės vertikaliai.

12. Baldų sistema (1) pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad kiaurai per stovo elementą (4) eina kanalas (36) su pirmąja stovo elemento anga (37), atitinkančia antrąją angą (29) ir antrąją stovo elemento angą (38).

---

*(51)* Int.Cl. ***A61J 1/14*** (2006.01)
***B65B 3/00*** (2006.01)
***B65D 23/08*** (2006.01)
***B65D 25/24*** (2006.01)
***B65D 51/00*** (2006.01)
***G21F 5/015*** (2006.01)
***G21F 5/08*** (2006.01)
***G21F 5/12*** (2006.01)
***A61J 1/05*** (2006.01)

*(11)* **2731577**

*(96)* 12735524.6

*(96)* 2012-07-12

*(97)* 2014-05-21

*(97)* 2016-03-16

*(86)* PCT/EP2012/063747

*(86)* 2012-07-12

*(87)* WO 2013/007806

*(87)* 2013-01-17

*(30)* 102011079031, 2011-07-12, DE

*(72)* JAKOBSEN, Jan Borge, NO
BORRETZEN, Peer, NO
HAUGSETER, Bjorn, NO

*(73)* Bayer AS, 0283 Oslo, NO

*(74)* Jelena GERASIMOVIČ, 52, IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius, LT

*(54)* Konteineris skysčiui
Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 6.

*(57)* 1. Konteineris skysčiui, apimantis:
- ertmę (4) skysčio laikymui, kur ertmė yra apribota sienelėmis iš šonų (3) ir iš apačios (2);
- angą (5), skirtą ertmės užpildymui skysčiu;
- dangtį (40 ir 43), skirtą ertmės uždengimui, kur dangtis turi praduriamą sritį kaniulės įterpimui į ertmę;
- dugno aptaisą (20), apimantį ertmės sieneles prie pagrindo;
- viršutinį aptaisą (10); ir
- plėvę (30), besitęsiančią nuo viršutinio aptaiso (10) iki apatinio aptaiso (20);
- b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad plėvė (30) apsupa tas ertmės sienelių zonas, kurios nėra jau apsuptos viršutiniu aptaisu arba apatiniu aptaisu; ir

viršutinis aptaisas apsupa praduriamą dangtį, išskyrus pradūrimo sritį.

2. Konteineris pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad sienelės, ribojančios ertmę, yra pagamintos iš stiklo.

3. Konteineris pagal 1 arba 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad viršutinis aptaisas yra frikciniu būdu sujungtas su dangčiu arba apatinis aptaisas yra frikciniu būdu sujungtas su pagrindo sienelėmis.

4. Konteineris pagal bet kurį iš 1-3 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad viršutinis aptaisas ir/arba apatinis aptaisas susideda iš elastinio polimero.

5. Konteineris pagal bet kurį iš 1-4 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad plėvė yra prilipinta prie viršutinio aptaiso, apatinio aptaiso ir sienelių ir/arba plėvė iš dalies yra prilipinta pati prie savęs.

6. Konteineris pagal bet kurį iš 1-5 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad sienelės, kurios supa ertmę, sudaro pirminį indą, kuris yra tuščiavidurio cilindro formos jo pagrindo ir vidurio srityje, kuris smailėja aukštyn link angos taip, kad sudarytų petukus ir kaklą, ir tuo, kad apie angą yra padarytas antbriaunis.

7. Konteineris pagal 6 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad dangtis turi pajuostę, kuri yra pritvirtinta prie pirminio indo antbriaunio.

8. Konteineris pagal bet kurį iš 1-7 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad viršutinis aptaisas turi viršutinę sritį, kurios skerspjūvis yra aukštyn siaurėjantis, ir apatinę sritį, kurios skerspjūvis yra platėjantis teleskopinio cilindro būdu, kur viršutinė sritis yra padaryta prijungimui prie dangčio, ir apatinė sritis yra padaryta viename lygyje su sienelėmis, kurios apima ertmę.

9. Konteineris pagal bet kurį iš 1-8 punktų, apimantis bent vieną radionuklidą.

10. Konteinerio pagal bet kurį iš 1-9 punktų panaudojimas radioaktyvių medžiagų laikymui ir saugojimui, ypatingai, radioaktyvių medžiagų, kurios yra naudojamos terapijos ir/arba diagnostikos tikslais, kur minėta radioaktyvi medžiaga optimaliai apima bent vieną alfa spinduliuotės radionuklidą.

11. Panaudojimas pagal 10 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad konteineris turi vieną radioaktyvios medžiagos dozę.

12. Konteinerio užpildymo skysčiu būdas, apimantis bent tokias stadijas, kur:
- pirminį indą užpildo skysčiu;
- užpildytą pirminį indą uždaro;
- pirminio indo pirmo dalyje sudaro apatinį aptaisą;
- ant dangčio padaro viršutinį aptaisą;
- pirminio indo dalis, kurios dar nėra jau apgaubtos apatiniu aptaisu arba viršutiniu aptaisu, apsupa plėve, besitęsiančia nuo apatinio aptaiso iki viršutinio aptaiso, ir sujungiančią juos vieną su kitu.

13. Būdas pagal 12 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad skystis yra viena vaisto, ypatingai radioterapinio agento, dozė.

14. Būdas pagal vieną iš 12 arba 13 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad plėvė iš vienos pusės turi lipnų sluoksnį, ir prijungimui prie apatinio aptaiso, viršutinio aptaiso ir pirminio indo plėvelę apvynioja aplink nurodytus komponentus.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 8/27*** (2006.01)
***A61K 8/35*** (2006.01)
***A61K 8/49*** (2006.01)
***A61K 8/67*** (2006.01)
***A61K 8/73*** (2006.01)
***A61Q 17/04*** (2006.01)
*(11)* **2257266**
*(96)* 09734893.2
*(96)* 2009-03-23
*(97)* 2010-12-08
*(97)* 2016-03-16
*(86)* PCT/EP2009/002122
*(86)* 2009-03-23
*(87)* WO 2009/129904
*(87)* 2009-10-29

*(30)* MI20080560, 2008-04-01, IT
*(72)* Braguti, Lodovico Gianluca, IT
Varani, Loretta, IT
*(73)* Braguti, Lodovico Gianluca, 23900 Lecco, IT
Varani, Loretta, 40020 Casalfiumanese (BO), IT
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Kompozicijos, sukurtos fotoalerginių ir fototoksinių odos reakcijų prevencijai ir apsaugai nuo jų
Apibrėžties punktai: 10, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Derinio iš:
a) UV-A fotoabsorbento sistemų;
b) karboksimetil-beta-gliukano ir ektoino, kaip citoapsauginių agentų;
c) antioksidantų, parinktų iš vitaminų C ir (arba) E ir (arba) jų darinių;
d) ir, galimai, bioflavonoidų, proantocianidinų, polifenolių, verbaskozidų, ksilogliukanų arba juos turinčių augalų ekstraktų;
panaudojimas gamybai vietinių kompozicijų, skirtų fotoalerginių ir fototoksinių odos reakcijų, kurias sukelia vaistai, vietiniu būdu vartojami produktai ir (arba) maistas, arba jos kyla dėl subjektyvių polinkių, prevencijai ir apsaugai nuo jų.

2. Panaudojimas pagal 1 punktą, kur
UV-A fotoabsorbento komponentai yra parinkti iš dietilaminohidroksibenzoilheksilbenzoato, cinko oksido, butilmetoksidibenzoilmetano, benzofenonų.

3. Panaudojimas pagal 2 punktą, kur fotoabsorbento komponentai yra šiose koncentracijų ribose:
i) dietilaminohidroksibenzoilheksilbenzoatas: nuo 0,5 iki 10 %;
ii) cinko oksidas: nuo 1 iki 10 %;
iii) butilmetoksidibenzoilmetanas: nuo 0,5 iki 5 %;
iv) benzofenonai: nuo 0,5 iki 10 %;
ir dietilaminohidroksibenzoilheksilbenzoato ir cinko oksido koncentracijų suma patenka į intervalą tarp 1 ir 10 %, kur koncentracijos yra išreikštos kaip dalis nuo visų kompozicijos komponentų.

4. Panaudojimas pagal 3 punktą, kur butilmetoksidibenzoilmetanas naudojamas derinyje su oktokrilenu arba dar vienu stabilizuojančiu agentu, charakterizuojamu tripleto ir singleto veikimo mechanizmu, santykiu 1:1 arba 1:1.5, kur koncentracijų suma patenka į intervalą tarp 1 ir 10 % (nuo visų kompozicijos komponentų).

5. Panaudojimas pagal 1 punktą, kur cinko oksidas naudojamas laisvame pavidale arba mikronizuotas tarp 20 ir 200 mikronų, kaip milteliai arba iš anksto disperguotas tirpikliuose, parinktuose iš vandens, C12-C15 alkilbenzoatų, mineralinės alyvos, dimetikono arba trigliceridų C8-C12.

6. Panaudojimas pagal 1 punktą, kur karboksimetil-beta-gliukano ir ektoino koncentracija yra nuo 0,001 iki 2 % ir nuo 0,001 iki 2 %, atitinkamai, o jų suma patenka į intervalą tarp 0,002 ir 2 %, kur koncentracijos yra išreikštos kaip dalis nuo visų kompozicijos komponentų.

7. Panaudojimas pagal 1 punktą, kur vitaminas E yra natūralaus arba sintetinio tokoferolio arba jo darinių pavidale, koncentracijomis, lygiomis arba didesnėmis nei 2 %, ir vitaminas C yra askorbo rūgšties arba jos darinių, parinktų iš askorbilmagnio fosfato, askorbiltetraizopalmitato ir natrio askorbilfosfato, pavidale, koncentracijomis, bent jau didesnėmis nei 0,1 %, ir vitamino E ir vitamino C koncentracijų suma yra bent jau didesnė nei 1 %, kur koncentracijos yra išreikštos kaip dalis nuo visų kompozicijos komponentų.

8. Panaudojimas pagal bet kurį iš 1-7 punktą, taip pat turintis augalų ekstraktus, tokius, kaip ekstraktai iš *Vitis vinifera*, *Prunella vulgaris*, *Uncaria tormentosa*, *Paeonia ir Camellia Sinensis.*

9. Panaudojimas pagal bet kurį iš 1-8 punktą, taip pat turintis medžiagų, tokių, kaip bioflavonoidų, proantocianidinų, polifenolių, verbaskozidų, ksilogliukanų arba juos turinčių augalų ekstraktų.

10. Panaudojimas pagal bet kurį iš 1-9 punktą, emulsijos su aliejinga arba vandenine esterio faze pavidale, arba gelio arba emulgelio pavidale.

*(51)* Int.Cl. ***A61K 9/00*** (2006.01)
***A61K 31/4427*** (2006.01)
***A61K 31/4439*** (2006.01)
***A61P 27/06*** (2006.01)
***A61K 45/06*** (2006.01)
***A61K 9/08*** (2006.01)
***C07D 413/12*** (2006.01)
***C07D 417/12*** (2006.01)
***C07D 417/14*** (2006.01)

*(11)* **2611415**

*(96)* 11752517.0

*(96)* 2011-08-29

*(97)* 2013-07-10

*(97)* 2016-02-24

*(86)* PCT/EP2011/064829

*(86)* 2011-08-29

*(87)* WO 2012/028585

*(87)* 2012-03-08

*(30)* 10175151, 2010-09-02, EP

*(72)* KLAR, Jürgen, DE
VON DEGENFELD, Georges, DE
LERCHEN, Hans-Georg, DE
ALBRECHT-KÜPPER, Barbara, DE
KNORR, Andreas, DE
SANDNER, Peter, DE
MEIBOM, Daniel, DE

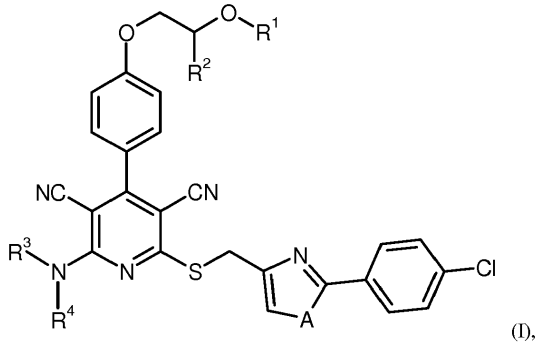
*(73)* Bayer Intellectual Property GmbH, 40789 Monheim, DE

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

*(54)* Adenozino A1 agonistai glaukomos ir akių hipertenzijos gydymui

Apibrėžties punktai: 12, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Junginys, kurio formulė (I)

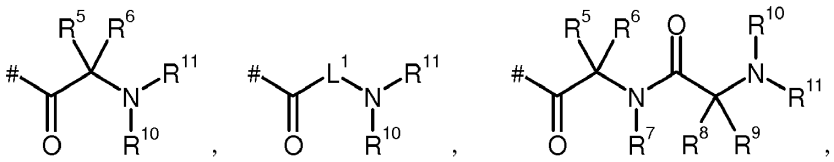


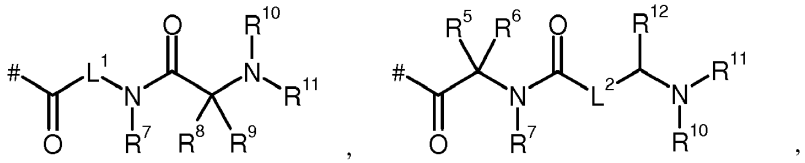
(I),

kur

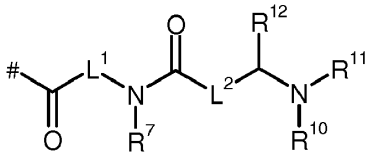
A yra deguonis arba siera;

$R^1$ yra vandenilis arba grupė, kurios formulė





arba



kur

# yra prisijungimo prie deguonies atomo vieta;

$L^1$ yra linijinės grandinės ($C_2$-$C_4$)alkandiilas;

$L^2$ yra linijinės grandinės ($C_1$-$C_3$)alkandiilas;

$R^5$ ir $R^8$ yra vienodi arba skirtingi ir nepriklausomai pasirinkti iš grupės, susidedančios iš vandenilio, metilo, propan-2-ilo, propan-1-ilo, 2-metilpropan-l-ilo, 1-metilpropan-1-ilo, butan-1-ilo, *tret*-butilo, fenilo, benzilo, p-hidroksibenzilo, indol-3-ilmetilo, imidazol-4-ilmetilo, hidroksimetilo, 2-hidroksietilo, 1-hidroksietilo, merkaptometilo, metiltiometilo, 2-merkaptoetilo, 2-metiltioetilo, karbamoilmetilo, 2-karbamoiletilo, karboksimetilo, 2-karboksietilo, 4-aminobutan-1-ilo, 4-amino-3-hidroksibutan-1-ilo, 3-aminopropan-1-ilo, 2-aminometilo, aminometilo, 3-guanidinopropan-1-ilo, 3-ureidopropan-1-ilo;

$R^6$ ir $R^9$ nepriklausomai yra pasirinkti iš vandenilio atomo arba metilo;

$R^7$ yra vandenilis arba ($C_1$-$C_4$)alkilas; arba

$R^7$ ir $R^5$ kartu su atomu, prie kurio jie yra prijungti sudaro, pirolidinono arba piperidino žiedą;

$R^{10}$ ir $R^{11}$ yra vienodi arba skirtingi ir nepriklausomai pasirinkti iš vandenilio arba ($C_1$-$C_4$)alkilo, kur ($C_1$-$C_4$)alkilas gali turėti pakaitu vieną grupę, pasirinktą iš hidroksi, ($C_1$-$C_4$)alkoksi, amino, mono-($C_1$-$C_4$)alkilamino arba di-($C_1$-$C_4$)alkilamino; arba

$R^{10}$ ir $R^8$ kartu su atomu, prie kurio jie yra prijungti, sudaro pirolidino arba piperidino žiedą; ir

$R^{12}$ yra vandenilis arba hidroksikarbonilas;

$R^2$ yra vandenilis arba grupė, kurios formulė -$CH_2OR^1$, kur $R^1$ yra kaip nurodyta aukščiau;

$R^3$ yra vandenilis, metilas arba etilas;

$R^4$ yra vandenilis, metilas arba etilas; arba

$R^3$ ir $R^4$ kartu su azoto atomu, prie kurio jie yra prijungti, sudaro azetidino, pirolidino arba piperidino žiedą, kur azetidino, pirolidino arba piperidino žiedas gali turėti vieną arba du pakaitus, nepriklausomai pasirinktus iš grupės, susidedančios iš fluoro, trifluormetilo, metilo, etilo, metoksi ir etoksi;

arba jo druskos, solvatai arba druskų solvatai,

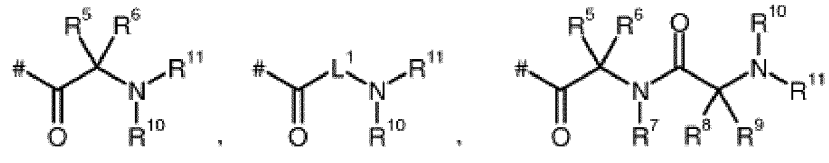
skirti naudoti glaukomos, normotenzinės glaukomos, akių hipertenzijos ir/arba jų derinių gydymo ir/arba profilaktikos būde.

2**.** Junginys, kurio formulė (I) pagal 1 punktą,

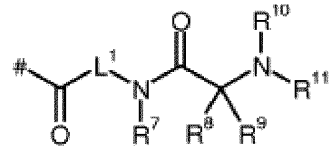
kur

A yra siera;

$R^1$ yra grupė, kurios formulė



arba



kur

# yra prisijungimo prie deguonies atomo vieta;

$L^1$ yra etan-1,2-diilas;

$R^5$ yra vandenilis, metilas, propan-2-ilas, 1-metilpropan-1-ilas, 2-metilpropan-1-ilas, hidroksimetilas vai 1-hidroksimetilas;

$R^6$ yra vandenilis;

$R^7$ yra vandenilis;

$R^8$ yra vandenilis, metilas, propan-2-ilas, 1-metilpropan-1-ilas, 2-metilpropan-l-ilas, imidazol-4-ilmetilas, hidroksimetilas, hidroksietilas, 2-karboksietilas, 4-aminobutan-1-ilas arba 2-aminoetilas;

$R^9$ yra vandenilis;

$R^{10}$ yra vandenilis;

$R^{11}$ yra vandenilis; arba

$R^{10}$ ir $R^8$ kartu su atomu, prie kurio jie yra prijungti, sudaro pirolidino žiedą;

$R^2$ yra vandenilis;

$R^3$ yra vandenilis;

$R^4$ yra vandenilis; arba

$R^3$ ir $R^4$ kartu su azoto atomu, prie kurio jie yra prijungti, sudaro azetidino, pirolidino arba piperidino žiedą;

arba jo druskos, solvatai arba druskų solvatai,

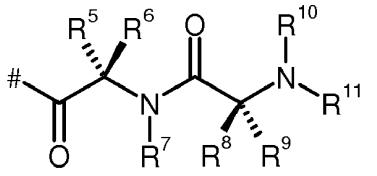
skirti naudoti glaukomos, normotenzinės glaukomos, akių hipertenzijos ir/arba jų derinių gydymo ir/arba profilaktikos būde.

3. Junginys, kurio formulė (I) pagal 1 punktą,

kur

A yra siera;

$R^1$ yra grupė, kurios formulė



,

kur:

# yra prijungimo prie deguonies atomo vieta;

$R^5$ yra vandenilis, metilas, propan-2-ilas, 2-metilpropan-l-ilas, benzilas, hidroksimetilas arba 1-hidroksietilas;

$R^6$ yra vandenilis;

$R^7$ yra vandenilis;

$R^8$ yra vandenilis, metilas, propan-2-ilas, 1-metilpropan-1-ilas, 2-metilpropan-l-ilas, imidazol-4-ilmetilas, 4-aminobutan-1-ilas, 2-aminometilas, 3-aminopropan-1-ilas, aminometilas arba 3-guanidinopropan-1-ilas;

$R^9$ yra vandenilis;

$R^{10}$ yra vandenilis;

$R^{11}$ yra vandenilis;

$R^2$ yra vandenilis;

$R^3$ yra vandenilis;

$R^4$ yra vandenilis;

arba jo druskos, solvatai arba druskų solvatai,

skirti naudoti glaukomos, normotenzinės glaukomos, akių hipertenzijos ir/arba jų derinių gydymo ir/arba profilaktikos būde.

4. Junginys, kurio formulė (I) pagal bet kurį iš 1-3 punktų, pasirinktas iš:

2-{4-[2-amino-6-({[2-(4-chlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-dicianopiridin-4-il]-fenoksi}etil-L-lizil-D-alaninato dihidrochlorido;

2-{4-[2-amino-6-({[2-(4-chlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-dicianopiridin-4-il]-fenoksi}etil-L-arginil-D-alaninato dihidrochlorido;

2-{4-[2-amino-6-({[2-(4-chlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-dicianopiridin-4-il]-fenoksi}etil-L-lizil-D-valinato dihidrochlorido;

2-{4-[2-amino-6-({[2-(4-chlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-dicianopiridin-4-il]-fenoksi}etil-L-arginil-D-valinato trihidrochlorido;

2-{4-[2-amino-6-({[2-(4-chlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-dicianopiridin-4-il]-fenoksi}etil-L-lizil-D-fenilalaninato dihidrochlorido;

2-{4-[2-(azetidin-1-il)-6-({[2-(4-chlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-dicianopiridin-4-il]fenoksi}etil-beta-alaninato trifluoracetato;

2-{4-[2-(azetidin-1-il)-6-({[2-(4-chlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-dicianopiridin-4-il]fenoksi}etil-L-ornitinato bis(triflouracetato);

2-{4-[2-(azetidin-1-il)-6-({[2-(4-chlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-dicianopiridin-4-il]fenoksi}etil-L-lizil-L-alaninato bis(trifluoracetato);

2-{4-[2-({[2-(4-chlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-diciano-6-(pirolidin-1-il)piridin-4-il]fenoksi}etil-L-alanil-L-alaninato hidrochlorido;

2-{4-[2-({[2-(4-chlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-diciano-6-(pirolidin-1-il)piridin-4-il]fenoksi}etil-L-izoleucil-L-alaninato hidrochlorido;

2-{4-[2-({[2-(4-chorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-diciano-6-(pirolidin-1-il)piridin-4-il]fenoksi}etilglicil-L-leucinato hidrochlorido;

(2*S*)-3-{4-[2-amino-6-({[2-(4-chlorfenil)-1,3-oksazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-dicianopiridin-4-il]fenoksi}propan-1,2-diil-(2*S*,2'*S*)-bis-(2-{[(2*S*)-2-aminopropanoil]amino}-propanoato) dihidrochlorido;

arba jo druskos, solvatai arba druskų solvatai,

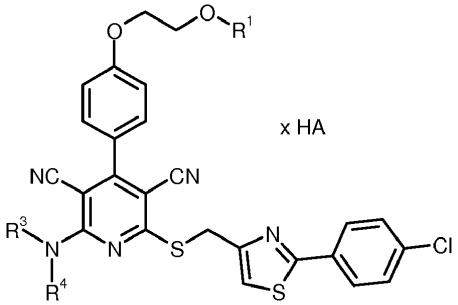
skirti naudoti glaukomos, normotenzinės glaukomos, akių hipertenzijos ir/arba jų derinių gydymo ir/arba profilaktikos būde.

5. Junginys, kurio formulė (I) pagal bet kurį iš 1-4 punktų, kuris yra:

2-{4-[2-amino-6-({[2-(4-chlorfenil)-1,3-tiazol-4-il]metil}sulfanil)-3,5-dicianopiridin-4-il]fenoksi}etil-L-lizil-D-alaninato dihidrochloridas;

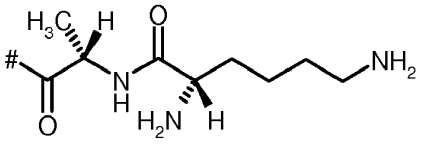
skirtas naudoti glaukomos, normotenzinės glaukomos, akių hipertenzijos ir/arba jų derinių gydymo ir/arba profilaktikos būde.

6. Junginys, kurio formulė (I) pagal bet kurį iš 1-3 punktų, kuris yra




kur

$R^1$ yra




$R^3$ yra vandenilis;

$R^4$ yra vandenilis;

HA yra 2 HCl;

skirtas naudoti glaukomos, normotenzinės glaukomos, akių hipertenzijos ir/arba jų derinių gydymo ir/arba profilaktikos būde.

7. Junginys, kurio formulė (I), pagal bet kurį iš 1-6 punktų, skirtas naudoti glaukomos, normotenzinės glaukomos, akių hipertenzijos ir/arba jų derinių gydymo ir/arba profilaktikos būde be chemodinaminio poveikio, ypatingai kraujo spaudimo ir širdies susitraukimo dažnio atžvilgiu.

8. Junginys, kurio formulė (I), pagal bet kurį iš 1-6 punktų, skirtas naudoti glaukomos, normotenzinės glaukomos, akių hipertenzijos ir/arba jų derinių gydymo ir/arba profilaktikos būde, kur junginys formulės (I) yra skirtinas vietiškai į akį.

9. Junginys, kurio formulė (I) pagal bet kurį iš 1-6 punktų, skirtas naudoti glaukomos, normotenzinės glaukomos, akių hipertenzijos ir/arba jų derinių gydymo ir/arba profilaktikos būde, be chemodinaminio poveikio, ypatingai kraujo spaudimo ir širdies susitraukimo dažnio atžvilgiu, kur junginys formulės (I) yra skirtinas vietiškai į akį.

10. Junginys pagal 8 arba 9 punktą, kur junginys formulės (I) yra skirtinas vietiškai derinyje su bent vienu papildomu veikliuoju junginiu, pasirinktu iš grupės, susidedančios iš alfa adrenerginių agonistų, beta blokatorių ir karboninės anhidrazės slopiklių.

11. Junginys, kurio formulė (I) pagal bet kurį iš 1-6 punktų, skirtas žmonių ir gyvūnų glaukomos ir akių hipertenzijos gydymui ir/arba profilaktikai vietiškai skiriant terapiškai veiksmingą kiekį bent vieno junginio pagal bet kurį iš 1-6 punktų arba vaisto, apimančio bent vieną junginį pagal bet kurį iš 1-6 punktų, derinyje su inertiniu, netoksišku, farmaciniu požiūriu priimtinu priedu.

12. Junginys, skirtas naudoti pagal 11 punktą, kur vaistas papildomai apima bent vieną papildomą veikliųjį junginį, pasirinktą iš grupės, susidedančios iš alfa adrenerginių agonistų, beta blokatorių ir karboninės anhidrazės slopiklių.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 9/00*** (2006.01)
***A61K 31/167*** (2006.01)
***A61K 31/573*** (2006.01)

*(11)* **2727582**

*(96)* 14153337.2

*(96)* 2010-09-27

*(97)* 2014-05-07

*(97)* 2016-03-16

*(30)* 09172083, 2009-10-02, EP

*(72)* Brambilla, Gaetano, IT

*(73)* CHIESI FARMACEUTICI S.p.A., 43100 Parma, IT

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

*(54)* Formoterolio ir beklometazono dipropionato farmacinės aerozolinės kompozicijos

Apibrėžties punktai: 20, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Farmacinė aerozolinė kompozicija, skirta panaudoti suspausto oro fiksuotos dozės aerozoliniame inhaliatoriuje, apimanti:

(a) nuo 0,001 iki 0,05 masės % formoterolio fumarato dihidrato;

(b) nuo 0,05 iki 0,16 masės % beklometazono dipropionato;

(c) nuo 2,0 iki 4,8 masės % etanolio;

(d) 1,1,1,2-tetrafluoretano (HFA 134a); ir

(e) nuo 0,002 iki 0,05 masės % lecitino arba oleino rūgšties, kaip paviršiaus aktyvios medžiagos;

b e s i s k i r i a n t i tuo, kad HFA 134a yra vienintelis propelentas ir formoterolio fumarato dihidratas kompozicijoje yra suspenduotas mikronizuotoje formoje, o beklometazono dipropionatas yra pilnai ištirpęs.

2. Kompozicija pagal 1 punktą, kuri apima kaip aktyvius ingredientus tik formoterolio fumarato dihidrato ir beklometazono dipropionato derinį.

3. Kompozicija pagal bet kurį iš 1-2 punktų, kurioje formoterolio fumarato dihidrato koncentracija yra tarp 0,002 ir 0,03 masės %.

4. Kompozicija pagal 3 punktą, kurioje formoterolio fumarato dihidrato koncentracija yra tarp 0,0025 ir 0,01 masės %.

5. Kompozicija pagal bet kurį iš 1-4 punktų, kurioje beklometazono dipropionato koncentracija yra tarp 0,06 ir 0,12 masės %.

6. Kompozicija pagal 5 punktą, kurioje beklometazono dipropionato koncentracija yra tarp 0,07 ir 0,1 masės %.

7. Kompozicija pagal bet kurį ankstesnį punktą, kurioje etanolio kiekis yra tarp 2,2 ir 4,5 masės %.

8. Kompozicija pagal 7 punktą, kurioje minėtas kiekis yra tarp 2,5 ir 4,0 masės %.

9. Kompozicija pagal 8 punktą, kurioje minėtas kiekis yra tarp 2,6 ir 3,5 masės %.

10. Kompozicija pagal 9 punktą, kurioje minėtas kiekis yra tarp 3,0 ir 3,5 masės %.

11. Kompozicija pagal 1 punktą, kurioje oleino rūgšties kiekis yra tarp 0,002 ir 0,05 masės %.

12. Kompozicija pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuri per suaktyvinimą yra pajėgi patiekti 6 arba 12 μg formoterolio fumarato dihidrato ir 50 arba 100 μg beklometazono dipropionato.

13. Kompozicija pagal 12 punktą, kuri per suaktyvinimą yra pajėgi patiekti 6 μg formoterolio fumarato dihidrato ir 100 μg beklometazono dipropionato.

14. Farmacinė aerozolinė kompozicija pagal 1 punktą, skirta panaudoti suspausto oro fiksuotos dozės aerozoliniame inhaliatoriuje, kuris per suaktyvinimą yra pajėgus patiekti 6 μg formoterolio fumarato dihidrato ir 100 μg beklometazono dipropionato, kur minėta kompozicija apima:
(a) nuo 0,001 iki 0,05 masės % formoterolio fumarato dihidrato;
(b) nuo 0,05 iki 0,16 masės % beklometazono dipropionato;
(c) nuo 2,0 iki 4,8 masės % etanolio;
(d) 1,1,1,2-tetrafluoretano (HFA 134a); ir
(e) nuo 0,002 iki 0,05 masės % oleino rūgšties;
b e s i s k i r i a n t i tuo, kad HFA 134a yra vienintelis propelentas ir formoterolio fumarato dihidratas kompozicijoje yra suspenduotas mikronizuotoje formoje, o beklometazono dipropionatas yra pilnai ištirpęs.

15. Suspausto oro fiksuotos dozės aerozolinis inhaliatorius, apimantis kanistrą, užpildytą farmacine aerozoline kompozicija pagal bet kurį iš 1-14 punktų ir matavimo vožtuvą, skirtą aktyvių ingredientų terapiniu požiūriu efektyvių dozių tiekimui.

16. Suspausto oro fiksuotos dozės aerozolinis inhaliatorius pagal 15 punktą, kurio kanistras yra pagamintas iš aliuminio.

17. Suspausto oro fiksuotos dozės aerozolinis inhaliatorius pagal 15 arba 16 punktą, kurio matavimo vožtuvas yra pajėgus patiekti tarp 50 ir 100 μl tūrį.

18. Suspausto oro fiksuotos dozės aerozolinis inhaliatorius pagal 17 punktą, kurio matavimo vožtuvas yra pajėgus patiekti tarp 50 ir 63 μl tūrį.

19. Farmacinė aerozolinė kompozicija pagal bet kurį iš 1-14 punktų, skirta panaudoti prevencijai ir/arba gydymui lengvų, vidutinio sunkumo ar sunkių, ūmių arba lėtinių simptomų arba profilaktiniam respiratorinių ligų gydymui.

20. Kompozicija pagal 19 punktą, kur liga yra astma arba lėtinė obstrukcinė plaučių liga.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 9/10*** (2006.01)
***A61K 31/122*** (2006.01)
***A61P 3/00*** (2006.01)
*(11)* **2723320**
*(96)* 12802262.1
*(96)* 2012-06-20
*(97)* 2014-04-30
*(97)* 2016-01-13

*(86)* PCT/SE2012/050681
*(86)* 2012-06-20
*(87)* WO 2012/177214
*(87)* 2012-12-27
*(30)* 1150585, 2011-06-23, SE
*(72)* SVENSSON, Lennart, SE
SIDÉN, Hans, SE
*(73)* Swedish Orphan Biovitrum International AB, 112 76 Stockholm, SE
*(74)* Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
*(54)* Skysta farmacinė kompozicija, apinati nitizinoną
Apibrėžties punktai: 18, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Skysta farmacinė kompozicija, tinkama vartoti per burną, apimanti:
(a) mikronizuoto 2-(2-nitro-4-trifluormetilbenzoil)-1,3-cikloheksandiono (nitizinonas) veiksmingo kiekio suspensiją; ir
(b) citrinų rūgšties buferį, kurio pH yra intervale nuo 2,5 iki 3,5, geriau pH 3,0.

2. Kompozicija pagal 1 punktą, kur nitrozinono kiekis yra nuo 1 iki 10 mg/ml, geriau 4 mg/ml.

3. Kompozicija pagal 1 punktą, papildomai apimanti vieną arba daugiau farmaciniu požiūriu priimtinas sudedamąsias dalis, parinktas iš grupės, susidedančios iš suspenduojančių agentų, saldiklių, konservantų, paviršiaus aktyvumo medžiagų ir aromatinių agentų.

4. Kompozicija pagal 3 punktą, kur suspenduojantis agentas yra hidroksipropilmetilceliuliozė.

5. Kompozicija pagal 4 punktą, kur suspenduojantis agentas yra hidroksipropilmetilceliuliozė nuo 1 iki 20 mg/ml, geriau 5 mg/ml kiekio.

6. Kompozicija pagal 3 punktą, kur saldiklis yra glicerolis.

7. Kompozicija pagal 6 punktą, kur saldiklis yra glicerolis nuo 100 iki 500 mg/ml, geriau 500 mg/ml kiekio.

8. Kompozicija pagal 3 punktą, kur konservantas yra metilo parabenas ir/arba propilo parabenas.

9. Kompozicija pagal 8 punktą, kur konservantai yra metilo parabenas nuo 1 iki 2 mg/ml, geriau 1.4 mg/ml kiekio ir propilo parabenas nuo 0,1 iki 0,2 mg/ml, geriau 0,14 mg/ml kiekio.

10. Kompozicija pagal 3 punktą, kur konservantas yra natrio benzoatas nuo 0,2 iki 5 mg/ml, geriau 1 mg/ml kiekio.

11. Kompozicija pagal 3 punktą, kur paviršiaus aktyvumo medžiaga yra polisorbatas 80.

12. Kompozicija pagal 11 punktą, kur paviršiaus aktyvumo medžiaga yra polisorbatas 80 nuo 0,1 iki 20 mg/ml, geriau nuo 0,10 iki 0,15 mg/ml kiekio.

13. Kompozicija pagal bet kurį iš 1-9, 11 arba 12 punktų, apimanti:
(a) nitizinoną (4 mg/ml);
(b) citrinų rūgšties monohidratą (9 mg/ml);
(c) trinatrio citrato dihidratą (2,1 mg/ml)
(d) hidroksipropilmetilceliuliozę (5 mg/ml);
(e) glicerolį (500 mg/ml);
(f) metilo parabeną (1,4 mg/ml);
(g) propilo parabeną (0,14 mg/ml); ir
(h) polisorbatą 80 (0,14 mg/ml).

14. Kompozicija pagal bet kurį iš 1-7 arba 10-12 punktų, apimanti:
(a) nitizinoną (4 mg/ml);

(b) citrinų rūgšties monohidratą (9 mg/ml);
(c) trinatrio citrato dihidratą (2,1 mg/ml)
(d) hidroksipropilmetilceliuliozę (5 mg/ml);
(e) glicerolį (500 mg/ml);
(f) natrio benzoatą (1,0 mg/ml); ir
(g) polisorbatą 80 (0,14 mg/ml).

15. Kompozicija pagal 13 arba 14 punktą, papildomai apimanti aromatinį agentą.

16. Kompozicija pagal bet kurį iš 1 – 15 punktų, skirta panaudoti medicininės būsenos, parinktos iš tirozinemijos, Parkinsono ligos, depresijos, pavargusių kojų sindromo ir alkaptonurijos gydymui.

17. Kompozicija pagal 16 punktą, skirta panaudoti 1 tipo paveldimos tirozinemijos (HT-1) gydymui.

18. Kompozicija pagal 17 punktą, skirta panaudoti pediatrinių pacientų 1 tipo paveldimos tirozinemijos (HT-1) gydymui.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 9/10*** (2006.01)
***A61K 31/343*** (2006.01)
***A61K 31/352*** (2006.01)
***A61K 31/4709*** (2006.01)
***A61K 31/497*** (2006.01)
***A61K 31/7048*** (2006.01)
***A61K 47/32*** (2006.01)
***A61K 47/34*** (2006.01)
***A61K 47/36*** (2006.01)
*(11)* **1731138**
*(96)* 05727436.7
*(96)* 2005-03-28
*(97)* 2006-12-13
*(97)* 2016-03-23
*(86)* PCT/JP2005/005736
*(86)* 2005-03-28
*(87)* WO 2005/094788
*(87)* 2005-10-13
*(30)* 2004102780, 2004-03-31, JP
*(72)* KUBO, Yoshiko, JP
YAMAKAWA, Tetsumi, JP
YAMASAKI, Yasuomi, JP
*(73)* TOYAMA CHEMICAL CO., LTD., Tokyo 160-0023, JP
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Ribotai tirpstančio vaisto smulki dispersija ir jos gavimo būdas
Apibrėžties punktai: 10, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Prastai tirpstančio vaisto smulkios dispersijos gavimo būdas, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad apima šias pakopas:
- prastai tirpstančio vaisto suspendavimas skystyje, neturinčiame deflokuliantų, siekiant gauti suspensiją;
- suspensijos įvedimas į aukšto slėgio homogenizatorių, po to veikiant suspensiją aukštu slėgiu, kad gautų dispersiją; ir
- deflokulianto pridėjimas į dispersiją, siekiant deaglomeruoti joje esančias sukibusias daleles;
kur
prastai tirpastantis vaistas yra vaistas, pasižymintis tirpumu vandenyje 20 °C temperatūroje, mažesniu nei 1 mg/ml;
deflokuliantas yra sintetinis polimeras arba gamtinis polisacharidas;
90 tūrio % arba daugiau dalelių smulkioje dispersijoje turi mažesnį nei 1000 nm dalelės diametrą; ir aukštas slėgis reiškia 100 MPa arba aukštesnį.

2. Būdas pagal 1 punktą, kur sintetinis polimeras yra gamtinio polisacharido darinys, vinilo polimero darinys arba polialkilenglikolio kopolimeras.

3. Būdas pagal bet kurį iš 1-2 punktą, kur prastai tirpstantis vaistas yra sintetinis antibakterinis agentas, priešgrybelinis agentas, antireumatinis agentas, priešuždegiminis agentas arba virškinimo agentas.

4. Būdas pagal bet kurį iš 1-2 punktą, kur prastai tirpstantis vaistas yra sintetinis antibakterinis agentas, antireumatinis agentas arba priešgrybelinis agentas.

5. Būdas pagal bet kurį iš 3-4 punktą, kur priešgrybelinis agentas yra triazolo arba polieno priešgrybelinis agentas.

6. Būdas pagal bet kurį iš 1-2 punktą, kur prastai tirpstantis vaistas yra sintetinis antibakterinis agentas.

7. Būdas pagal bet kurį iš 1-2 punktą, kur prastai tirpstantis vaistas yra 1-ciklopropil-8-metil-7-[5-metil-6-(metilamino)-3-piridinil]-4-okso-1,4-dihidro-3-chinolinkarboksirūgštis, itrakonazolas, amfotericinas B, griseofulvinas arba iguratimodas.

8. Būdas pagal bet kurį iš 1-2 punktą, kur prastai tirpstantis vaistas yra iguratimodas.

9. Būdas pagal bet kurį iš 1-2 punktą, kur prastai tirpstantis vaistas yra 1-ciklopropil-8-metil-7-[5-metil-6-(metilamino)-3-piridinil]-4-okso-1,4-dihidro-3-chinolinkarboksirūgštis.

10. Būdas pagal bet kurį iš 1-6 punktą, kur prastai tirpstantis vaistas yra vaistas, pasižymintis tirpumu vandenyje 20 °C temperatūroje, mažesniu nei 0,1 mg/ml.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 9/107*** (2006.01)
***A61K 31/4745*** (2006.01)
***A61P 35/00*** (2006.01)
***A61K 9/48*** (2006.01)

*(11)* **1814520**

*(96)* 05807851.0

*(96)* 2005-11-17

*(97)* 2007-08-08

*(97)* 2016-04-13

*(86)* PCT/EP2005/012334

*(86)* 2005-11-17

*(87)* WO 2006/053755

*(87)* 2006-05-26

*(30)* 629757 P, 2004-11-19, US

*(72)* OTTINGER, Isabel, DE

*(73)* SIGMA-TAU Industrie Farmaceutiche Riunite S.p.A., 00144 Roma, IT

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

*(54)* Farmacinės kompozicijos, apimančios kamptotecino darinį

Apibrėžties punktai: 16, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Savaimingai besidisperguojanti farmacinė kompozicija, apimanti 7-t-butoksiiminometilkamptoteciną, kur savaimingai besidisperguojanti farmacinė kompozicija yra mikroemulsijos prekoncentratas, apimantis nešiklio terpę, apimančią lipofilinę komponentę, parinktą iš grupės, susidedančios iš C8-C10 riebalų rūgšties monogliceridų ir digliceridų, rafinuoto gliceroliu peresterinto kukurūzų aliejaus, acetiltrietilcitrato ir ricinos aliejaus; paviršiuje aktyvių medžiagų komponentę, parinktą iš grupės, susidedančios iš polietilenglikolio-hidrinto ricinos aliejaus ir vitamino E TPGS; ir hidrofilinę komponentę, parinktą iš grupės, susidedančios iš propilenglikolio, PEG400 ir etilacetato.

2. Savaimingai besidisperguojanti farmacinė kompozicija pagal 1 punktą, papildomai apimanti kotirpiklį, susidedantį iš etanolio.

3. Savaimingai besidisperguojanti farmacinė kompozicija pagal 2 punktą, papildomai apimanti vieną arba daugiau priedų, parinktų iš grupės, susidedančios iš askorbilo palmitato, butilhidroksianizolo, butilhidroksitolueno ir citrinų rūgšties.

4. Savaimingai besidisperguojanti farmacinė kompozicija pagal 3 punktą, kur antioksidantas yra askorbilo palmitatas.

5. Savaimingai besidisperguojanti farmacinė kompozicija pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuri yra pavidale, tinkamame peroraliniam įvedimui.

6. Savaimingai besidisperguojanti farmacinė kompozicija pagal bet kurį ankstesnį punktą, apimanti nuo 0,05 iki 20 masės % 7-t-butoksiiminometilkamptotecino, nuo 5 iki 85 masės % lipofilinės komponentės, nuo 5 iki 90 masės % paviršiuje aktyvios medžiagos, nuo 0,00 iki 20 masės % kotirpiklio ir nuo 5 iki 60 masės % hidrofilinės komponentės, kur visi masės procentai skaičiuojami nuo visos kompozicijos.

7. Savaimingai besidisperguojanti farmacinė kompozicija pagal 6 punktą, papildomai apimanti vieną arba daugiau priedų.

8. Savaimingai besidisperguojanti farmacinė kompozicija pagal 7 punktą, kur vienas arba daugiau priedų yra parinkti iš antioksidantų, antimikrobinių agentų, fermentų inhibitorių, stabilizatorių, konservantų, kvapiklių ir saldiklių.

9. Savaimingai besidisperguojanti farmacinė kompozicija pagal 15 punktą, kur antioksidantas yra askorbilo palmitatas.

10. Savaimingai besidisperguojanti farmacinė kompozicija pagal bet kurį ankstesnį punktą vienetinės vaisto formos pavidale.

11. Savaimingai besidisperguojanti farmacinė kompozicija pagal 10 punktą minkštos arba kietos želatinos kapsulės pavidale.

12. Savaimingai besidisperguojanti farmacinė kompozicija pagal 10 punktą geriamojo tirpalo pavidale.

13. Savaimingai besidisperguojančios farmacinės kompozicijos pagal 1 punktą gavimo būdas, kur būdas apima pristatymą aktyvaus agento ir nešiklio terpės, apimančios (1) minėtą lipofilinę komponentę, (2) minėtą paviršinio aktyvumo medžiagą, (3) minėtą hidrofilinę komponentę, į homogenišką mišinį ir (4) pasirinktinai, kotirpiklio.

14. Savaimingai besidisperguojančios farmacinės kompozicijos gavimo būdas pagal 13 punktą, kur nešiklio terpė dar apima vieną arba daugiau priedų.

15. Savaimingai besidisperguojančios farmacinės kompozicijos gavimo būdas pagal 14 punktą, kur vienas arba daugiau priedų yra parinkti iš antioksidantų, antimikrobinių agentų, fermentų inhibitorių, stabilizatorių, konservantų, kvapiklių ir saldiklių.

16. Savaimingai besidisperguojančios farmacinės kompozicijos gavimo būdas pagal 15 punktą, kur antioksidantas yra askorbilo palmitatas.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 31/122*** (2006.01)
***A61P 25/00*** (2006.01)
***A61P 25/16*** (2006.01)
***A61P 25/28*** (2006.01)
***A61P 21/00*** (2006.01)

*(11)* **2051706**

*(96)* 07801511.2

*(96)* 2007-08-03

*(97)* 2009-04-29

*(97)* 2016-05-11

*(86)* PCT/EP2007/006895

*(86)* 2007-08-03
*(87)* WO 2008/019769
*(87)* 2008-02-21
*(30)* 06016935, 2006-08-14, EP
837496 P, 2006-08-14, US
*(72)* DUBACH-POWELL, Judith, CH
HAUSMANN, Rudolf, CH
VANCAN, Pierre, CH
*(73)* Santhera Pharmaceuticals (Schweiz) AG, 4410 Liestal, CH
*(74)* Irena Milda SRĖBALIENĖ, 24, Patentinių paslaugų centras, UAB, J. Basanavičiaus g. 11/1, LT-03108 Vilnius, LT
*(54)* Per gleivinę veikiantis 2-(10-hidroksidecil)-5,6-dimetoksi-3-metil-2,5-cikloheksadieno-1,4-dionas (idebenonas)
Apibrėžties punktai: 8, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Idebenonas, skirtas vartoti per gleivinę, kur idebenonas skiriamas vartoti doze nuo 0.01 mg/kg per dieną iki mažiau nei 5 mg/kg per dieną.

2. Idebenonas pagal apibrėžties 1 punktą, skirtas mitochondrinių, neurologinių, nervų ir raumenų ligų gydymui.

3. Idebenonas pagal apibrėžties 2 punktą, skirtas Friedricho ataksijos (FRDA), Leber paveldimos regos nervo neuropatijos (LHON), mitochondrijų miopatijos, encefalopatijos, pieno rūgšties acidozės su į insultą panašiais požymiais (MELAS) ir mitochondrijų miopatijomis ligų gydymui.

4. Idebenonas pagal apibrėžties 2 punktą, skirtas Diušeno raumenų distrofijos (DMD) ir Bekerio raumenų distrofijos (BMD) gydymui.

5. Idebenonas pagal apibrėžties 2 punktą, skirtas gydyti Alzheimerio ligą arba Parkinsono ligą.

6. Idebenonas pagal bet kurį iš apibrėžties nuo 1 iki 5 punktų, kur vaistas, kurio sudėtyje yra idebenonas, yra žvakučių, lašų, kramtomosios gumos, greitai ištirpstančios tabletės arba purškalo formoje.

7. Idebenonas pagal bet kurį iš apibrėžties nuo 1 iki 6 punktų, kur vaistas, kurio sudėtyje yra idebenonas, skiriamas vartoti per nosies gleivinę, burnos gleivinę arba per gaubtinės žarnos gleivinę.

8. Idebenonas pagal bet kurį iš apibrėžties nuo 1 iki 7 punktų, kur vaistas, kurio sudėtyje yra idebenonas, apima antrą terapinį agentą.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 31/167*** (2006.01)
***A61K 31/57*** (2006.01)
***A61P 11/06*** (2006.01)
*(11)* **2146704**
*(96)* 08748930.8
*(96)* 2008-04-16
*(97)* 2010-01-27
*(97)* 2016-03-23
*(86)* PCT/EP2008/003012
*(86)* 2008-04-16
*(87)* WO 2008/128685
*(87)* 2008-10-30
*(30)* 07007930, 2007-04-19, EP
*(72)* CHIESI, Paolo, IT
RONDELLI, Ivano, IT
ACERBI, Daniela, IT
POLI, Gianluigi, IT
*(73)* CHIESI FARMACEUTICI S.p.A., 43100 Parma, IT
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT

*(54)* Kompozicijos, apimančios formoterolį ir beklometazoną, panaudojimas paūmėjusios astmos gydymui

Apibrėžties punktai: 18, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Kompozicijos, apimančios fiksuotą derinį

a) formoterolio, jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos arba solvato, arba tokio solvato druskos;

ir

b) beklometazono propionato;

panaudojimas gamybai vaisto, skiriamo inhaliacijomis sausų miltelių inhaliatoriumi, sukomponuoto sausų miltelių kompozicijos, apimančios vieną arba daugiau skiediklių arba nešiklių, pavidale, arba suslėgto išmatuotos dozės inhaliatoriumi, kuriame abu aktyvieji ingredientai a) ir b) yra pilnai ištirpinti skysto propelento mišinyje, skirto naudoti astmos ūmaus priepuolio atveju kaip pagalbinės priemonės, kai to reikia, kaip papildymas prie astmos palaikomojo gydymo tuo pačiu vaistu.

2. Panaudojimas pagal 1 punktą, kur a) su b) molinis santykis, išskaičiuotas kaip formoterolio su beklometazono dipropionatu, yra nuo 1:1 iki 1:500.

3. Panaudojimas pagal 2 punktą, kur a) su b) molinis santykis, išskaičiuotas kaip formoterolio su beklometazono dipropionatu, yra nuo 1:1 iki 1:100.

4. Panaudojimas pagal 3 punktą, kur a) su b) molinis santykis, išskaičiuotas kaip formoterolio su beklometazono dipropionatu, yra nuo 1:3 iki 1:30.

5. Panaudojimas pagal 4 punktą, kur a) su b) molinis santykis, išskaičiuotas kaip formoterolio su beklometazono dipropionatu, yra 1:12.8.

6. Panaudojimas pagal 4 punktą, kur a) su b) molinis santykis, išskaičiuotas kaip formoterolio su beklometazono dipropionatu, yra 1:25.6.

7. Panaudojimas pagal bet kurį iš nuo 1 iki 6 punktų, kur aktyvusis ingredientas a) yra formoterolio fumarato dihidratas.

8. Panaudojimas pagal bet kurį iš nuo 1 iki 6 punktų, kur aktyvusis ingredientas a) yra formoterolio R,R-enantiomeras arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska arba solvatas, arba tokios druskos solvatas.

9. Panaudojimas pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kur vaistas apima formoterolio kasdieninę dozę suaugusiems, įskaitant palaikomąją terapiją, kuri yra 72 mikrogramai.

10. Panaudojimas pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kur vaistas apima beklometazono dipropionato kasdieninę dozę suaugusiems, įskaitant palaikomąją terapiją, kuri yra 1200 mikrogramų.

11. Panaudojimas pagal bet kurį nuo 1 iki 10 punktų, kuriame vaistas yra sukomponuotas sausų miltelių kompozicijos pavidale, kai vienas arba daugiau tinkamų skiediklių arba nešiklių yra parinkti iš laktozės, dekstrano, manitolio ir gliukozės.

12. Panaudojimas pagal 11 punktą, kuriame derinio abu aktyvieji ingredientai a) ir b) ir skiediklis/nešiklis yra mikronizuotame pavidale.

13. Panaudojimas pagal 12 punktą, kuriame į kompoziciją gali būti pridėtas rupus skiediklis/nešiklis, kad sudarytų sutvarkytos struktūros mišinį.

14. Panaudojimas pagal 13 punktą, kuriame minėtas sutvarkytos struktūros mišinys gali turėti priedą, skatinantį aktyviųjų ingredientų atpalaidavimą, parinktą iš medžiagų su nesulipimo, slidumo arba sutepimo savybėmis.

15. Panaudojimas pagal bet kurį iš nuo 1 iki 10 punktų, kuriame vaistas yra sukomponuotas suslėgto išmatuotos dozės inhaliatoriaus pavidale, kai skystas propelento mišinys apima HFA 134a (1,1,1,2-tetrafluoretaną), HFA 227 (1,1,1,2,3,3,3-heptafluorpropaną) arba jų mišinį, derinyje su vienu arba daugiau kotirpiklių, paviršinio aktyvumo medžiagų, tepiklių, antioksidantų, stabilizatorių ir (arba) konservantų.

16. Panaudojimas pagal 15 punktą, kuriame propelento mišinys apima HFA 134a (1,1,1,2-tetrafluoretaną), etanolį kaip konservantą ir vandeninę mineralinę rūgštį kaip stabilizuojantį agentą.

17. Panaudojimas pagal 16 punktą, kuriame vandeninė mineralinė rūgštis yra 1M druskos rūgštis.

18. Panaudojimas pagal bet kurį iš nuo 16 iki 17 punktų, kuriame nuspaudus suslėgtos išmatuotos dozės inhaliatorių, propelento mišinio garavimo metu dviejų aktyviųjų ingredientų vidutinės dalelės dydžio požymiai lygūs arba mažesni už 1,1 mikrometrą.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 31/195*** (2006.01)
***A61K 9/06*** (2006.01)
***A61K 41/00*** (2006.01)
***A61K 47/10*** (2006.01)
***A61K 47/14*** (2006.01)
***A61K 47/44*** (2006.01)
***A61K 47/12*** (2006.01)
***A61K 47/24*** (2006.01)
***A61K 47/26*** (2006.01)
***A61K 31/221*** (2006.01)

*(11)* **2440199**
*(96)* 10724715.7
*(96)* 2010-06-11
*(97)* 2012-04-18
*(97)* 2016-04-13
*(86)* PCT/EP2010/003532
*(86)* 2010-06-11
*(87)* WO 2010/142457
*(87)* 2010-12-16
*(30)* 09251537, 2009-06-11, EP
*(72)* STENSRUD, Gry, NO
*(73)* Photocure ASA, 0275 Oslo, NO
*(74)* Marija LENKUTIENĖ, 6, Patentinių paslaugų centras, UAB, J. Basanavičiaus g. 11/1, LT-03108 Vilnius, LT
*(54)* Pusiau kietos kompozicijos ir farmaciniai produktai
Apibrėžties punktai: 26, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Pusiau kietas farmacinis produktas, skirtas naudoti vėžio, priešvėžinių būklių, infekcijų arba uždegimo moters reprodukcinėje sistemoje, išangės arba varpos fotodinaminiam gydymui, susideda iš:

a) aktyvios sudedamosios dalies, parinktos iš 5-ALA esterio ir farmaciniu požiūriu priimtinų jo druskų;
b) vieno arba daugiau trigliceridų; ir
c) pasirinktinai vieno arba daugiau klampumo stipriklių.

2. Pusiau kietas farmacinis produktas, skirtas naudoti pagal apibrėžties 1 punktą, kur minėta aktyvi sudedamoji dalis yra junginys, turintis formulę I, arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska

$R^2{}_2N\text{-}CH_2COCH_2\text{-}CH_2CO\text{-}OR^1$ (I)
kur

$R^1$ reiškia pakeistą arba nepakeistą alkilo grupę; ir
$R^2$ reiškia vandenilio atomą.

3. Pusiau kietas farmacinis produktas, skirtas naudoti pagal apibrėžties 1 arba 2 punktą, kur vienas arba daugiau trigliceridų yra glicerolio ir 3 identiškų arba skirtingų $C_2$-$C_{22}$ riebalų rūgščių, geriau – 3 identiškų arba skirtingų $C_4$-$C_{18}$ riebalų rūgščių, dar geriau – 3 identiškų arba skirtingų $C_6$-$C_{18}$ riebalų rūgščių ir geriausiai – 3 identiškų arba skirtingų $C_6$-$C_{12}$ riebalų rūgščių trigliceridai.

4. Pusiau kietas farmacinis produktas, skirtas naudoti pagal bet kurį vieną iš ankstesnių apibrėžties punktų, kur vienas arba daugiau trigliceridų yra skysti trigliceridai, ir jame yra vienas arba daugiau klampumo stipriklių.

5. Pusiau kietas farmacinis produktas, skirtas naudoti pagal apibrėžties 4 punktą, kur vienas arba daugiau klampumo stipriklių yra parinkti iš celiuliozės ir jos darinių, sintetinių polimerų, polietilenglikolių, augalų dervų, krakmolo ir krakmolo darinių, karagenino, agaro, želatinos, vaško ir vaško sausojo likučio, geriau – parinktų iš vaško arba vaško sausojo likučio, geriausiai – parinkti iš sočiųjų riebiųjų alkoholių arba riebalų rūgšties.

6. Pusiau kietas farmacinis produktas, skirtas naudoti pagal bet kurį vieną iš apibrėžties nuo 1 iki 5 punktų, kur vieno arba daugiau trigliceridų koncentracija yra ribose nuo 60 iki 96 masės% bendros produkto masės, jei jame yra vienas arba daugiau klampumo stipriklių, arba ribose nuo 70 iki 99,5 masės% bendros produkto masės, jei vieno arba daugiau klampumo stipriklių jame nėra.

7. Pusiau kietas farmacinis produktas, skirtas naudoti pagal bet kurį vieną iš apibrėžties nuo 1 iki 6 punktų, kur aktyvi sudedamoji dalis yra 5-ALA heksilo esteris arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

8. Pusiau kietas farmacinis produktas, skirtas naudoti pagal apibrėžties 1 punktą, susideda iš:

5-ALA heksilo esterio arba farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos;
oktano/dekano trigliceridо; ir
stearino rūgšties.

9. Pusiau kietas farmacinis produktas, skirtas naudoti pagal apibrėžties 1 punktą, kuris susideda iš:

5 masės% 5-ALA heksilo esterio jo hidrochlorido druskos formoje;
77 masės% oktano/dekano trigliceridо; ir
18 masės% stearino rūgšties.

10. Pusiau kietas farmacinis produktas, skirtas naudoti pagal bet kurį vieną iš ankstesnių apibrėžties punktų, talpinamas į vaistų įvedimo sistemą, geriausiai – talpinamas į vaistų įvedimo sistemą, parinktą iš pesarų, plėvelių, gaubtelių, lipnių tvarsčių arba pleistrų.

11. Pusiau kietas farmacinis produktas pagal apibrėžties 10 punktą, kur vaisto įvedimo priemonė yra suformuota taip, kad užtikrintų pilną ir saugų įvedimą į vaginą ir apima apšvitinimo priemones.

12. Pusiau kietas farmacinis produktas, skirtas naudoti pagal bet kurį vieną iš apibrėžties nuo 1 iki 11 punktų, naudojamas displazijos arba HPV infekcijų moters reprodukcinėje sistemoje, išangėje arba varpoje, geriau – endometriumo, gimdos kaklelio, vaginos, vulvos, išangės arba varpos displazijos arba gimdos, gimdos kaklelio, vaginos, vulvos, išangės arba varpos HPV infekcijų fotodinaminiam gydymui

13. Pusiau kietas farmacinis produktas, skirtas naudoti pagal apibrėžties 12 punktą, gimdos kaklelio displazijos arba gimdos kaklelio HPV infekcijų fotodinaminiam gydymui.

14. Pusiau kietas farmacinis produktas, skirtas naudoti pagal bet kurį vieną iš apibrėžties nuo 1 iki 11 punktų, naudojamų vėžio, priešvėžinių būklių, infekcijų arba uždegimo moters reprodukcinėje sistemoje, išangėje arba varpoje fotodinaminiam gydymui, kur minėtas gydymas apima šiuos etapus:

(a) paskiria minėtą pusiau kietą farmacinį produktą vartoti subjektui, nepridėjus vandens;
(b) laukia laiko tarpą, būtiną kol aktyvi sudedamoji dalis minėtame farmaciniame produkte pavirs į fotosensibilizatorių ir kad būtų pasiekta efektyvi audinio koncentracija pageidaujamoje vietoje; ir
(c) fotoaktyvina fotosensibilizatorių.

15. Pusiau kietas farmacinis produktas, skirtas naudoti pagal apibrėžties 14 punktą, kur minėtas produktas yra patalpintas į vaisto įvedimo priemonę, kuri yra suformuota taip, kad užtikrintų pilną ir saugų įvedimą į vaginą ir kuri apima apšvitinimo priemonę, galinčią spinduliuoti fotoaktyvinimui tinkamą šviesą.

16. Rinkinys, apimantis pusiau kietą farmacinį produktą pagal bet kurį vieną iš apibrėžties nuo 1 iki 9 punktų ir vaisto įvedimo sistemą, geriausiai – vaisto įvedimo sistemą, parinktą iš pesarų, plėvelių, gaubtelių, lipnių tvarsčių arba pleistrų.

17. Rinkinys pagal apibrėžties 16 punktą, kur vaisto įvedimo priemonė yra suformuota taip, kad užtikrintų pilną ir saugų įvedimą į vaginą ir apima apšvitinimo priemones.

18. Rinkinys pagal apibrėžties 16 arba 17 punktą, skirtas naudoti vėžio, priešvėžinių būklių, infekcijų arba uždegimo moters reprodukcinėje sistemoje, išangėje arba varpoje fotodinaminiam gydymui.

19. Pusiau kieta kompozicija, susidedanti iš:

a) aktyvios sudedamosios dalies, parinktos iš 5-ALA esterio ir farmaciniu požiūriu priimtinų jo druskų;
b) vieno arba daugiau trigliceridų; ir
c) pasirinktinai vieno arba daugiau klampumo stipriklių.

20. Pusiau kieta kompozicija pagal apibrėžties 19 punktą, kur vienas arba
daugiau trigliceridų yra skystas trigliceridas, geriausiai parinktas iš glicerolio ir 3 identiškų arba skirtingų $C_2$-$C_{22}$ riebalų rūgščių, dar geriau iš 3 identiškų arba skirtingų $C_4$-$C_{18}$ riebalų rūgščių, netgi dar geriau iš 3 identiškų arba skirtingų $C_6$-$C_{18}$ riebalų rūgščių, ir visų geriausiai iš 3 identiškų arba skirtingų $C_6$-$C_{12}$ riebalų rūgščių trigliceridų, ir joje yra vienas arba daugiau klampumo stipriklių.

21. Pusiau kieta kompozicija pagal apibrėžties 20 punktą, kur minėtas vienas arba daugiau klampumo stipriklių yra parinkti iš vaško arba vaško sausojo likučio, geriausiai – parinkti iš sočiųjų riebiųjų alkoholių arba riebalų rūgšties.

22. Pusiau kieta kompozicija pagal bet kurį vieną iš apibrėžties nuo 19 iki 21 punktų, kur vieno arba daugiau trigliceridų koncentracija yra ribose nuo 60 iki 96 masės% bendros produkto masės, jei jame yra vienas arba daugiau klampumo stipriklių, arba ribose nuo 70 iki 99,5 masės% bendros produkto masės, jei vieno arba daugiau klampumo stipriklių jame nėra.

23. Pusiau kieta kompozicija pagal bet kurį vieną iš apibrėžties nuo 19 iki 22 punktų, kur aktyvi sudedamoji dalis yra 5-ALA heksilo esteris arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

24. Pusiau kieta kompozicija pagal apibrėžties 19 punktą, kuri susideda iš:

5-ALA heksilo esterio arba farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos;
oktano/dekano trigliceridо; ir
stearino rūgšties.

25. Pusiau kieta kompozicija pagal apibrėžties 19 punktą, kuri susideda iš:

5 masės% 5-ALA heksilo esterio jo hidrochlorido druskos formoje;
77 masės% oktano/dekano trigliceridо; ir
18 masės% stearino rūgšties.

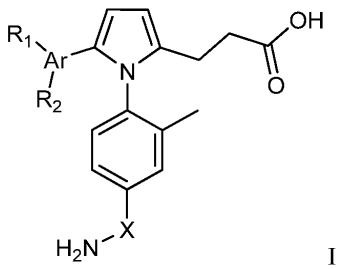
26. Pusiau kieta kompozicija pagal bet kurį vieną iš apibrėžties nuo 19 iki 25 punktų, skirta naudoti kaip medikamentas.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 31/4025*** (2006.01)
***C07D 403/10*** (2006.01)
***C07D 207/333*** (2006.01)
***C07D 207/335*** (2006.01)
***C07D 409/14*** (2006.01)
***A61P 11/06*** (2006.01)

*(11)* **2315591**

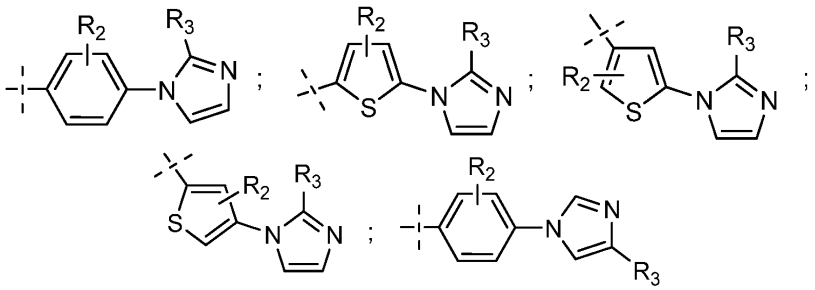
*(96)* 09807383.6
*(96)* 2009-08-14
*(97)* 2011-05-04
*(97)* 2016-03-16
*(86)* PCT/US2009/053931
*(86)* 2009-08-14
*(87)* WO 2010/019910
*(87)* 2010-02-18
*(30)* 89313 P, 2008-08-15, US
116982 P, 2008-11-21, US
*(72)* WASLEY, Jan, US
ROSENTHAL, Gary, J., US
SUN, Xicheng, US
STRONG, Sarah, US
QIU, Jian, US
*(73)* Nivalis Therapeutics, Inc., Boulder CO 80301, US
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Naujieji S-nitrozoglutationreduktazės pirolo inhibitoriai, kaip terapiniai agentai
Apibrėžties punktai: 12, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Junginys, kurio formulė (I) arba farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos:



I

kurioje:
Ar yra parinktas iš grupės, susidedančios iš fenilo ir tiofenilo;
$R_1$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš nepakeisto imidazolilo ir pakeisto imidazolilo, kur pakeista imidazolilo grupė yra pakeista $C_1$-$C_6$ alkilu;
$R_2$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, metilo, chloro, fluoro, hidroksi, metoksi, etoksi, propoksi, karbamoilo, dimetilamino, amino, formamido, ir trifluormetilo; ir
X yra parinktas iš grupės susidedančios iš CO ir $SO_2$,

2. Junginys arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska pagal 1 punktą, kur $ArR_1R_2$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:




kur $R_3$ yra parinktas iš H, metilo ir etilo.

3. Junginys arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska pagal 1 punktą, parinktas iš grupės, susidedančios iš:
3-(5-(4-(1H-imidazol-1-il)fenil)-1-(4-karbamoil-2-metilfenil)-1H-pirol-2-il) propiono rūgšties;
3-(5-(5-(1H-imidazol-1-il)tiofen-2-il)-1-(4-karbamoil-2-metilfenil)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties;

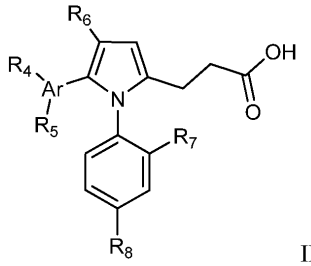
3-(1-(4-karbamoil-2-metilfenil)-5-(4-(2-metil-1H-imidazol-1-il)fenil)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties;
3-(1-(4-karbamoil-2-metilfenil)-5-(4-(4-metil-1H-imidazol-1-il)fenil)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties;
3-(1-(4-karbamoil-2-metilfenil)-5-(4-(2-etil-1H-imidazol-1-il)fenil)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties;
3-(5-(4-(1H-imidazol-1-il)tiofen-2-il)-1-(4-karbamoil-2-metilfenil)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties;
3-(1-(4-karbamoil-2-metilfenil)-5-(5-(2-metil-1H-imidazol-1-il)tiofen-2-il)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties;
3-(1-(4-karbamoil-2-metilfenil)-5-(3-fluor-4-(1H-imidazol-1-il)fenil)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties;
3-(1-(4-karbamoil-2-metilfenil)-5-(3-fluor-4-(2-metil-1H-imidazol-1-il)fenil)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties;
3-(1-(4-karbamoil-2-metilfenil)-5-(4-(2-metil-1H-imidazol-1-il)tiofen-2-il)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties;
3-(1-(4-karbamoil-2-metilfenil)-5-(2-metoksi-4-(2-metil-1H-imidazol-1-il)fenil)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties
3-(5-(4-(1H-imidazol-1-il)-2-metoksifenil)-1-(4-karbamoil-2-metilfenil)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties;
3-(1-(4-karbamoil-2-metilfenil)-5-(5-(2-metil-1H-imidazol-1-il)tiofen-3-il)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties;
3-(1-(4-karbamoil-2-metilfenil)-5-(5-(2-etil-1H-imidazol-1-il)tiofen-2-il)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties;
ir
3-(5-(5-(2-metil-1H-imidazol-1-il)tiofen-2-il)-1-(2-metil-4-sulfamoilfenil)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties;
ir jo farmaciniu požiūriu priimtinų druskų.

4. Farmacinė kompozicija, apimanti terapiniu požiūriu efektyvų kiekį junginio arba farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos pagal 1 punktą, kartu su farmaciniu požiūriu priimtinu nešikliu arba pagalbine medžiaga.

5. Junginys, kurio formulė (I) arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, kaip apibrėžta 1 punkte, skirtas naudoti gydymo būde.

6. Farmacinės kompozicijos pagal 4 punktą gamybos būdas, kur būdas apima formulės (I) junginio arba jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos, kaip apibrėžta 1 punkte, sumaišymą su farmaciniu požiūriu priimtinu nešikliu arba pagalbine medžiaga.

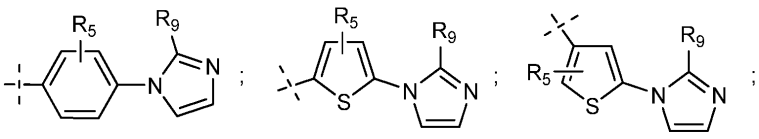
7. Junginys, kurio formulė (II) arba farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos:

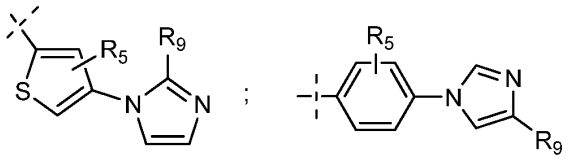



II

kur:
Ar yra parinktas iš grupės, susidedančios iš fenilo ir tiofenilo;
$R_4$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš nepakeisto imidazolilo ir pakeisto imidazolilo, kur pakeista imidazolilo grupė yra pakeista $C_1$-$C_6$ alkilu;
$R_5$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, fluoro, hidroksi ir metoksi,
$R_6$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, chloro, bromo ir fluoro;
$R_7$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio ir metilo; ir
$R_8$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš $CONH_2$, $SO_2NH_2$, ir $NHSO_2CH_3$.

8. Junginys arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska pagal 7 punktą, kur $ArR_4R_5$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:





kur $R_9$ yra parinktas iš H, metilo ir etilo.

9. Junginys arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska pagal 7 punktą parinktas iš grupės susidedančios iš 3-(5-(5-(2-metil-1H-imidazol-1-il)tiofen-2-il)-1-(4-sulfamoilfenil)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties; 3-(5-(5-(2-metil-1H-imidazol-1-il)tiofen-2-il)-1-(2-metil-4-(metilsulfonamido)fenil)-1H-pirol-2-il) propiono rūgšties; 3-(5-(4-(1H-imidazol-1-il)fenil)-1-(2-metil-4-(metilsulfonamido)fenil)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties; 3-(5-(4-(2-metil-1H-imidazol-1-il)fenil)-1-(2-metil-4-(metilsulfonamido)fenil)-1H-pirol-2-il) propiono rūgšties; 3-(5-(4-(2-metil-1H-imidazol-1-il)tiofen-2-il)-1-(2-metil-4-(metilsulfonamido)fenil)-1H-pirol-2-il) propiono rūgšties; 3-(5-(5-(2-metil-1H-imidazol-1-il)tiofen-2-il)-1-(2-metil-4-(metilsulfonamido)fenil)-1H-pirol-2-il) propiono rūgšties; 3-(5-(4-(2-metil-1H-imidazol-1-il)tiofen-2-il)-1-(4-(metilsulfonamido)fenil)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties; 3-(5-(2-metoksi-4-(2-metil-1H-imidazol-1-il)fenil)-1-(4-(metilsulfonamido)fenil)-1H-pirol-2-il) propiono rūgšties; ir 3-(5-(4-(2-metil-1H-imidazol-1-il)fenil)-1-(4-(metilsulfonamido)fenil)-1H-pirol-2-il)propiono rūgšties; ir jų farmaciniu požiūriu priimtinų druskų.

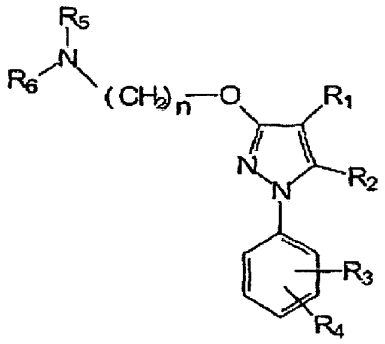
10. Farmacinė kompozicija, apimanti terapiniu požiūriu efektyvų junginio kiekį arba farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos pagal 7 punktą kartu su farmaciniu požiūriu priimtinu nešikliu arba pagalbine medžiaga.

11. Junginys, kurio formulė (II) arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, kaip apibrėžta 7 punkte, skirtas naudoti gydymo būde.

12. Farmacinės kompozicijos pagal 10 punktą gamybos būdas, kur būdas apima junginio, kurio formulė (II), arba farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos, kaip apibrėžta 7 punkte, sumaišymą su farmaciniu požiūriu priimtinu nešikliu arba pagalbine medžiaga.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 31/415*** (2006.01)
***A61K 31/416*** (2006.01)
***A61K 31/4196*** (2006.01)
***A61P 29/00*** (2006.01)
*(11)* **2531191**
*(96)* 11702057.8
*(96)* 2011-02-04
*(97)* 2012-12-12
*(97)* 2016-03-30
*(86)* PCT/EP2011/051643
*(86)* 2011-02-04
*(87)* WO 2011/095584
*(87)* 2011-08-11
*(30)* 10382024, 2010-02-04, EP
*(72)* VELA HERNANDEZ, José Miguel, ES
ZAMANILLO- CASTANEDO, Daniel, ES
PUIG-RIERA de CONIAS, Margarita, ES
*(73)* Laboratorios del Dr. Esteve, S.A., 08041 Barcelona, ES
*(74)* Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
*(54)* Sigma ligandai, skirti panaudoti pooperacinio skausmo prevencijai ir/arba gydymui
Apibrėžties punktai: 9, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Sigma ligandas, skirtas panaudoti skausmo, atsiradusio kaip chirurginės operacijos pasekmė, prevencijai ir/arba gydymui, kur sigma ligandas turi bendrą formulę (I):



(I)

kur:

$R_1$ yra parinkta iš grupės, sudarytos iš vandenilio, pakeisto arba nepakeisto alkilo, pakeisto arba nepakeisto cikloalkilo, pakeisto arba nepakeisto alkenilo, pakeisto arba nepakeisto arilo, pakeisto arba nepakeisto arilalkilo, pakeisto arba nepakeisto nearomatinio heterociklilo, pakeisto arba nepakeisto aromatinio heterociklilo, pakeisto arba nepakeisto heterociklilalkilo, $-COR_8$, $-C(O)OR_8$,$-C(O)NR_8R_9$, $-CH=NR_8$, -CN, $-OR_8$, $-OC(O)R_8$, $-S(O)_t-R_8$, $-NR_8R_9$, $-NR_8C(O)R_9$, $-NO_2$, $-N=CR_8R_9$ ir halogeno;

$R_2$ yra parinkta iš grupės, sudarytos iš vandenilio, pakeisto arba nepakeisto alkilo, pakeisto arba nepakeisto cikloalkilo, pakeisto arba nepakeisto alkenilo, pakeisto arba nepakeisto arilo, pakeisto arba nepakeisto arilalkilo, pakeisto arba nepakeisto, aromatinio arba nearomatinio heterociklilo, pakeisto arba nepakeisto heterociklilalkilo, $-COR_8$, $-C(O)OR_8$, $-C(O)NR_8R_9$, $-CH=NR_8$, -CN, $-OR_8$, $-OC(O)R_8$, $-S(O)_t-R_8$ , $-NR_8R_9$, $-NR_8C(O)R_9$, $-NO_2$, $-N=CR_8R_9$ ir halogeno;

$R_3$ ir $R_4$ nepriklausomai yra parinktos iš grupės, sudarytos iš vandenilio, pakeisto arba nepakeisto alkilo, pakeisto arba nepakeisto cikloalkilo, pakeisto arba nepakeisto alkenilo, pakeisto arba nepakeisto arilo, pakeisto arba nepakeisto arilalkilo, pakeisto arba nepakeisto, aromatinio arba nearomatinio heterociklilo, pakeisto arba nepakeisto heterociklilalkilo, $-COR_8$, $-C(O)OR_8$, $-C(O)NR_8R_9$, $-CH=NR_8$, -CN, $-OR_8$,$-OC(O)R_8$, $-S(O)_t-R_8$, $-NR_8R_9$, $-NR_8C(O)R_9$, $-NO_2$, $-N=CR_8R_9$ ir halogeno, arba kartu jos sudaro pasirinktinai pakeistą kondensuotų žiedų sistemą;

$R_5$ ir $R_6$ nepriklausomai yra parinktos iš grupės, sudarytos iš vandenilio, pakeisto arba nepakeisto alkilo, pakeisto arba nepakeisto cikloalkilo, pakeisto arba nepakeisto alkenilo, pakeisto arba nepakeisto arilo, pakeisto arba nepakeisto arilalkilo, pakeisto arba nepakeisto, aromatinio arba nearomatinio heterociklilo, pakeisto arba nepakeisto heterociklilalkilo, $-COR_8$, $-C(O)OR_8$, $-C(O)NR_8R_9$, $-CH=NR_8$, -CN, $-OR_8$,$-OC(O)R_8$, $-S(O)_t$-R8, $-NR_8R_9$, $-NR_8C(O)R_9$, $-NO_2$, $-N=CR_8R_9$ ir halogeno, arba kartu su azoto atomu, prie kurio jos yra prisijungusios, sudaro pakeistą arba nepakeistą, aromatinę arba nearomatinę heterociklilo grupę;

n yra parinkta iš 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 ir 8;

t yra 1,2 arba 3;

$R_8$ ir $R_9$ kiekviena nepriklausomai yra parinkta iš vandenilio, pakeisto arba nepakeisto alkilo, pakeisto arba nepakeisto cikloalkilo, pakeisto arba nepakeisto alkenilo, pakeisto arba nepakeisto arilo, pakeisto arba nepakeisto, aromatinio arba nearomatinio heterociklilo, pakeistos arba nepakeistos alkoksi grupės, pakeistos arba nepakeistos ariloksi grupės ir halogeno;

arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, stereoizomeras arba solvatas.

2. Sigma ligandas, skirtas panaudoti pagal 1 punktą, kur skausmas yra parinktas iš ūmaus ir/arba lėtinio skausmo, atsiradusio kaip chirurginės operacijos pasekmė.

3. Sigma ligandas, skirtas panaudoti pagal 2 punktą, kur skausmas yra parinktas iš paviršutiniškais ir/arba gilus skausmas po chirurginio audinių pažeidimo ir/arba neuropatinis skausmas, neuralgija, alodinija, kauzalgija, hiperalgezija, hiperestezija, hiperpatija, neuritas ir neuropatija po chirurginės procedūros.

4. Sigma ligandas, skirtas panaudoti pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kuris yra parinktas iš sigma receptoriaus antagonisto, geriau parinktas iš neutralaus antagonisto, atvirkštinio agonisto arba dalinio antagonisto.

5. Sigma ligandas, skirtas panaudoti pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kur $R_1$ yra parinkta iš H, $-COR_8$ ir pakeisto arba nepakeisto alkilo.

6. Sigma ligandas, skirtas panaudoti pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kur $R_2$ yra H arba alkilas.

7. Sigma ligandas, skirtas panaudoti pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kur $R_3$ ir $R_4$ kartu sudaro kondensuotų naftilo žiedų sistemą.

8. Sigma ligandas, skirtas panaudoti pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kur $R_5$ ir $R_6$ kartu sudaro morfolin-4-ilo grupę.

9. Sigma ligandas, skirtas panaudoti pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kur sigma ligandas yra 4-{2-[5-metil-1-(naftalen-2-il)-1H-pirazol-3-iloksi]etil}morfolinas arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, stereoizomeras arba solvatas.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 31/4995*** (2006.01)
***A61K 31/69*** (2006.01)
***A61K 45/06*** (2006.01)
***A61K 38/15*** (2006.01)
***A61P 35/00*** (2006.01)
***A61P 35/02*** (2006.01)
***A61K 31/513*** (2006.01)
***A61K 31/519*** (2006.01)
***A61K 31/7068*** (2006.01)
***A61K 31/706*** (2006.01)
***A61K 31/7072*** (2006.01)
***A61K 31/517*** (2006.01)

*(11)* **2637663**
*(96)* 11781807.0
*(96)* 2011-11-11
*(97)* 2013-09-18
*(97)* 2016-02-24
*(86)* PCT/EP2011/069976
*(86)* 2011-11-11
*(87)* WO 2012/062920
*(87)* 2012-05-18
*(30)* 10382300, 2010-11-12, EP
*(72)* MONEO OCANA, Victoria, ES
SANTAMARIA NUNEZ, Gema, ES
GARCIA FERNANDEZ, Luis Francisco, ES
GALMARINI, Carlos Maria, ES
GUILLÉN NAVARRO, Maria José, ES
AVILÉS MARIN, Pablo Manuel, ES
*(73)* Pharma Mar S.A., 28770 Colmenar Viejo Madrid, ES
*(74)* Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
*(54)* Derinių terapija su antinavikiniu alkaloidu
Apibrėžties punktai: 10, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. PM01183 arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti vėžio gydymui, apimantis PM01183 arba jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos terapiniu požiūriu veiksmingo kiekio sinergistiniame derinyje su antimetabolito terapiniu požiūriu veiksmingu kiekiu skyrimą, kur antimetabolitas yra parinktas iš 5-fluoruracilo, gemcitabino, citarabino, kapecitabino, decitabino, floksuridino, aminopterino, metotreksato, pemetreksedo ir raltitreksedo.

2. PM01183 arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti antimetabolito terapinio veiksmingumo padidinimui gydant vėžį, kuris apima pacientui, kuriam reikalingas toks gydymas, PM01183 arba jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos terapiniu požiūriu veiksmingo kiekio sinergistiniame derinyje su antimetabolito terapiniu požiūriu veiksmingu kiekiu skyrimą, kur antimetabolitas yra parinktas iš 5-fluoruracilo, gemcitabino, citarabino, kapecitabino, decitabino, floksuridino, aminopterino, metotreksato, pemetreksedo ir raltitreksedo.

3. PM01183 arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti pagal 1 arba 2 punktą, kur PM01183 arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska ir antimetabolitas sudaro to paties vaisto dalį.

4. PM01183 arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti pagal 1 arba 2 punktą, kur PM01183 arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska ir antimetabolitas yra paruošti kaip skirtingi vaistai, skiriami tuo pačiu metu arba skirtingu metu.

5. PM01183 arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti pagal 4 punktą, kur PM01183 arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska ir antimetabolitas yra paruošit kaip skirtingi vaistai, skiriami skirtingu metu.

6. PM01183 arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kur antimetabolitas yra parinktas iš 5-fluoruracilo, kapecitabino, gemcitabino, citarabino ir metotreksato.

7. PM01183 arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti pagal 6 punktą, kur antimetabolitas yra parinktas iš 5-fluoruracilo, gemcitabino, citarabino ir metotreksato.

8. PM01183 arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kur gydomas vėžys yra parinktas iš plaučių vėžio, sarkomos, piktybinės melanomos, šlapimo pūslės karcinomos, prostatos vėžio, kasos karcinomos, skydliaukės vėžio, skrandžio karcinomos, kiaušidžių vėžio, hepatomos, krūties vėžio, kolorektalinio vėžio, inkstų vėžio, ezofaginio vėžio, neuroblastomos, smegenų vėžio, gimdos kaklelio vėžio, analinio vėžio, sėklidžių vėžio, leukemijos, išsėtinės mielomos ir limfomos.

9. PM01183 arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti pagal 8 punktą, kur gydomas vėžys yra parinktas iš plaučių vėžio, sarkomos, piktybinės melanomos, prostatos vėžio, kasos karcinomos, skrandžio karcinomos, kiaušidžių vėžio, hepatomos, krūties vėžio, kolorektalinio vėžio, inkstų vėžio, leukemijos ir limfomos.

10. Rinkinys, skirta panaudoti vėžio gydymui, kuris apimaPM01183 arba jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos vaisto formą; ir

antimetabolito vaisto formą, kur antimetabolitas yra parinktas iš 5-fluoruracilo, gemcitabino, citarabino, kapecitabino, decitabino, floksuridino, aminopterino, metotreksato, pemetreksedo ir raltitreksedo; ir

instrukcijas abiejų vaistų naudojimui sinergistiniame derinyje pagal bet kurį iš ankstesnių punktų.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 31/655*** (2006.01)
***A61K 31/33*** (2006.01)
***C07C 279/20*** (2006.01)
***C07C 277/02*** (2006.01)
***A61P 5/24*** (2006.01)
***A61P 5/48*** (2006.01)

*(11)* **2399583**

*(96)* 10743433.4

*(96)* 2010-02-16

*(97)* 2011-12-28

*(97)* 2016-01-27

*(86)* PCT/ES2010/000067

*(86)* 2010-02-16

*(87)* WO 2010/094821

*(87)* 2010-08-26

*(30)* 200900448, 2009-02-18, ES

*(72)* MOSCOSO DEL PRADO, Jaime, ES
BANFI TOSI, Beatriz, ES

*(73)* ITF Research Pharma, S.L.U., 28108 Alcobendas Madrid, ES

*(74)* Tatjana STERLINA, 37, UAB „Intels“, Naugarduko g. 32/2, LT-03225 Vilnius, LT

*(54)* Per makštį vartojamų jautrumą insulinui didinančių agentų panaudojimas

Apibrėžties punktai: 11, brėžiniai: 2.

*(57)* 1. Ne mažiau kaip vieno jautrumą insulinui didinančio agento panaudojimas gamybai farmacinės kompozicijos, skirtos hiperandrogenizmo ir/arba policistinių kiaušidžių sindromo, ir/arba ne mažiau kaip vieno susijusio sutrikimo, pasirinkto iš grupės, susidedančios iš hirsutizmo, aknės, plaukų slinkimo, viršsvorio, nutukimo, nereguliarių, atsitiktinių ar menstruacijų nebuvimo, didesnių ir/arba policistinių kiaušidžių, ir nevaisingumo sutrikimų prevencijai ir/arba gydymui, kuriame minėta kompozicija yra įvedama per makštį.

2. Panaudojimas pagal 1 punktą policistinių kiaušidžių sindromo prevencijai ir/ arba gydymui.

3. Panaudojimas pagal 1 punktą nereguliarių, atsitiktinių arba menstruacijų nebuvimo, didesnių ir/arba policistinių kiaušidžių, ir/arba nevaisingumo, susijusio su policistinių kiaušidžių sindromu, prevencijai ir/ arba gydymui.

4. Panaudojimas pagal 1 punktą hirsutizmo, aknės ir/arba plaukų slinkimo, susijusio su hiperandrogeninėmis sąlygomis, prevencijai ir/arba gydymui.

5. Panaudojimas pagal bet kurį iš 1-4 punktų, kuriame insulino jautrumą didinantis agentas yra metforminas arba viena iš jo farmaciniu požiūriu priimtinų druskų, hidratų, arba polimorfų.

6. Panaudojimas pagal 5 punktą, kuriame metformino dozė svyruoja tarp 0,01-1000 mg/per dieną.

7. Panaudojimas pagal 6 punktą, kuriame metformino dozė svyruoja tarp 0,1-100 mg/per dieną.

8. Panaudojimas pagal 7 punktą, kuriame metformino dozė svyruoja tarp 0,5-50 mg/per dieną.

9. Panaudojimas pagal 8 punktą, kuriame metformino dozė svyruoja tarp 1-10 mg/per dieną.

10. Panaudojimas pagal bet kurį iš 1-4 punktų, kuriame insulino jautrumą didinantis agentas yra tiazolidindionas arba viena iš jo farmaciniu požiūriu priimtinų druskų, hidratų, arba polimorfų.

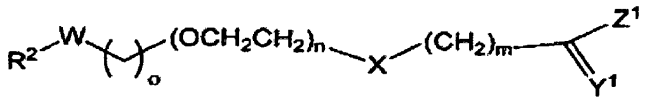
11. Farmacinė kompozicija, apimanti bent vieną insulino jautrumą didinantį agentą, skirtą panaudojimui hiperandrogenizmo ir/arba policistinių kiaušidžių sindromo, ir/arba ne mažiau kaip vieno susijusio sutrikimo, parinkto iš grupės, susidedančios iš hirsutizmo, aknės, plaukų slinkimo, antsvorio, nutukimo, nereguliarių, atsitiktinių arba menstruacijų nebuvimo, didesnių ir/ar policistinių kiaušidžių, ir nevaisingumo sutrikimo prevencijai ir/arba gydymui, kuriame minėta farmacinė kompozicija yra įvedama per makštį.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 38/16*** (2006.01)
*(11)* **2586456**
*(96)* 12155003.2
*(96)* 2005-10-31
*(97)* 2013-05-01
*(97)* 2016-01-20
*(30)* 623342 P, 2004-10-29, US
*(72)* Defrees, Shawn, US
*(73)* ratiopharm GmbH, 89079 Ulm, DE
*(74)* Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Fibroblastų augimo faktoriaus (FGF) pertvarkymas ir glikopegiliacija
Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 0.
*(57)* Fibroblastų augimo faktoriaus (FGF) konjugatas, apimantis:
mutantinį FGF-21 peptidą, turintį naujai įvestą su N arba O susietą glikozilinimo vietą, kuri neegzistuoja atitinkamame laukinio tipo fibroblastų augimo faktoriuje, kur atitinkamas laukinio tipo fibroblastų augimo faktorius turi aminorūgščių seką, kuri yra ne mažiau kaip 95% homologinė sekai SEQ ID NO: 146; ir
naujai įvesta su N arba O susieta glikozilinimo vieta yra mažiau nei 4 amino rūgščių atstumu nuo prolino liekanos C- arba N- galo, pvz., prolino liekana yra 3, 5, 9, 50, 61, 79, 91, 116, 120, 125, 129, 134, 139, 151, 156, 166, 172, arba 178 padėtyje SEQ ID NO: 146 sekoje; ir
modifikuojančioji grupė, kur minėta grupė yra kovalentiškai prisijungusi prie aprašomo mutantinio FGF-21 peptido iš anksto nustatytoje glikozilo arba amino rūgšties liekanos vietoje per nepakeistą glikozilo jungiančiąją grupę, kurioje sacharido monomeras, jungiantis modifikuojančiąją grupę prie molekulės yra nesuskilęs.

1. FGF konjugatas pagal 1 punktą, kur minėtas mutantinis FGF-21 peptidas apima bent vieną amino rūgščių seką parinktą iš grupės, susidedančios iš SEQ ID NOs: 161-214, 220-320 ir 323-337.

2. FGF konjugatas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur minėta modifikuojančioji grupė yra kovalentiškai prisijungusi prie, iš anksto parinktos, glikozilo liekanos ir, pasirinktinai, ši grupė yra ne-glikozidą modifikuojantį grupė bei, pasirinktinai, minėta glikozido nemodifikuojanti grupė yra parinkta iš linijinių polietilenglikolių (PEG) ir šakotų PEG šeimos; ir, pasirinktinai, minėta linijinė PEG turi tokią struktūrą:



kur

$R^2$ yra junginys, parinktas iš H, pakeisto arba nepakeisto alkilo, pakeisto arba nepakeisto arilo, pakeisto arba nepakeisto heteroarilo, pakeisto arba nepakeisto heterocikloalkilo, pakeisto arba nepakeisto heteroalkilo, pvz., acetalio, OHC-, $H_2N$-$CH_2CH_2$-, HS-$CH_2CH_2$-, ir -$(CH_2)_qC(Y^1)Z^2$; cukraus nukleotidų ar baltymų.

n yra sveikasis skaičius parinktas nuo 1 iki 2500;

m, o ir q yra sveikieji skaičiai nepriklausomai parinkti nuo 0 iki 20;

Z yra junginys parinktas iš OH, $NH_2$, halogenų, S-$R^3$, aktyvuotų esterių alkoholio komponentų, -$(CH_2)_pC(Y^2)V$, -$(CH_2)_pU(CH_2)_sC(Y^2)_v$, cukraus nukleotidų, baltymų, ir atskylančių grupių, pvz., imidazolo, p-nitrofenilo, HOBT, tetrazolo, halido;

X, $Y^1$, $Y^2$, W ir U yra nepriklausomai parinkti iš O, S, N-$R^4$;

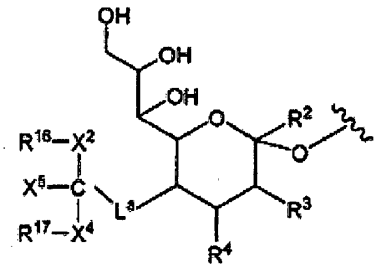
V yra junginys parinktas iš OH, $NH_2$, halogenų, S-$R^5$, aktyvuotų esterių alkoholio komponentų,

aktyvuotų amidų amino komponentų, cukraus nukleotidų ir baltymų;

p, s ir v yra sveikieji skaičiai nepriklausomai parinkti nuo 0 iki 20; ir

$R^3$, $R^4$ ir $R^5$ yra nepriklausomai parinkti iš H, pakeisto arba nepakeisto alkilo, pakeisto arba nepakeisto heteroalkilo, pakeisto arba nepakeisto arilo, pakeisto arba nepakeisto heterocikloalkilo ir pakeisto arba nepakeisto heteroarilo.

1. FGF konjugatas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur minėta glikozilo jungiančioji grupė turi struktūrą, atitinkančią šią formulę:



kur

$R^2$ yra H, $CH_2OR^7$, $COOR^7$ arba $OR^7$

kur

$R^7$ simbolizuoja H, pakeistą arba nepakeistą alkilą arba pakeistą arba nepakeistą heteroalkilą;

$R^3$ ir $R^4$ yra junginiai nepriklausomai parinkti iš H, pakeisto arba nepakeisto alkilo, $OR^8$, $NHC(O)R^9$

kur

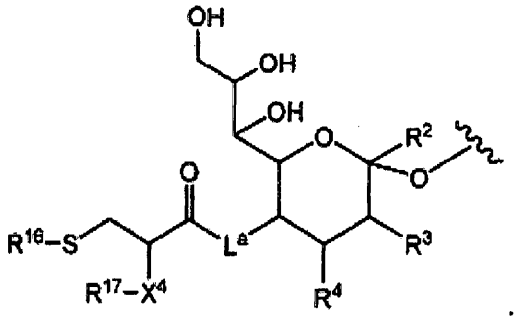
$R^8$ ir $R^9$ yra nepriklausomai parinkti iš H, pakeisto arba nepakeisto alkilo, pakeisto arba nepakeisto heteroalkilo arba sialo rūgšties;

$L^a$ yra jungiamoji dalis, pasirinkta iš jungčių, pakeisto arba nepakeisto alkilo ir pakeisto arba nepakeisto heteroalkilo

$R^{16}$ ir $R^{17}$ yra nepriklausomai parinktos polimerinės „rankos“;

$X^2$ ir $X^4$ yra nepriklausomai parinkti jungiamieji fragmentai jungiantys polimerines liekanas $R^{16}$ ir $R^{17}$ su C, ir

$X^5$ nereaktyvioji grupė; pasirinktinai ši glikozilą jungianti grupė turi struktūrą, atitinkančią formulę:



1. Izoliuota nukleino rūgštis, apimanti polinukleotido seką, koduojančią mutantinį fibroblastų augimo faktorių-21, kur mutantinis fibroblastų augimo faktorius-21 apima naujai įvestą su N arba O susijusią glikozilinimo vietą, kuri neegzistuoja atitinkamame laukinio tipo fibroblastų augimo faktoriuje, kur atitinkama laukinio tipo fibroblastų augimo faktoriaus amino rūgščių seka yra ne mažiau kaip 95% homologinė SEQ ID NO: 146 sekai; ir kur naujai įvesta glikozilinimo vieta yra mažiau nei 4 amino rūgščių atstumu nuo prolino liekanos C- arba N- galo, pvz., prolino liekana yra 3, 5, 9, 50, 61, 79, 91, 116, 120, 125, 129, 134, 139, 151, 156, 166, 172 arba 178 padėtyje SEQ ID NO:146 sekoje.

2. Nukleino rūgštis pagal 5 punktą, kur mutantinis fibroblastų augimo faktorius-21 apima bent vieną aminorūgščių seką, parinktą iš grupės, susidedančios iš SEQ ID NOs: 161-214, 220-320 ir 323-337, ir/arba kur mutantinis fibroblastų augimo faktorius-21 turi daugiau nei vieną naujai įvestą glikozilinimo vietą.

3. Raiškos kasetė arba ląstelė, apimanti nukleorūgštį pagal 5 arba 6 punktą.

4. Mutantinis fibroblastų augimo faktorius-21, apimantis naujai įvestą su N- arba O- susijusią glikozilinimo vietą, kuri neegzistuoja atitinkamame laukinio tipo fibroblastų augimo faktoriuje, kur atitinkamas laukinio tipo fibroblastų augimo faktorius turi aminorūgščių seką, kuri yra ne mažiau kaip 95% homologinė SEQ ID NO: 146 sekai; ir kur naujai įvesta glikozilinimo vieta yra mažiau nei 4 amino rūgščių atstumu nuo prolino liekanos C- arba N- galo, pvz., prolino liekana yra 3, 5, 9, 50, 61, 79, 91, 116, 120, 125, 129, 134, 139, 151, 156, 166, 172, arba 178 padėtyje SEQ ID NO: 146 sekoje.

5. Mutantinis fibroblastų augimo faktorius-21 pagal 8 punktą, kur minėtas mutantas FGF-21 apima bent vieną aminorūgščių seką, parinktą iš grupės, susidedančios iš SEQ ID NOs: 161-214, 220-320 ir 323-337, ir/arba kur mutantinis fibroblastų augimo faktorius-21 turi daugiau nei vieną naujai įvestą glikozilinimo vietą.

6. Mutantinis fibroblastų augimo faktorius-21 pagal 8 arba 9 punktą, apimantis vandenyje tirpų polimerą, prijungtą prie glikozilinimo vietos per glikozilinį jungiklį, kuris, pasirinktinai, yra nepakeistas glikozilo jungiklis.

7. Mutantinio fibroblastų augimo faktoriaus-21 gamybos būdas, kuris apima naujai įvestą su N- arba O- susijusią glikozilinimo vietą, kuri neegzistuoja atitinkamame laukinio tipo fibroblastų augimo faktoriuje, kuris apima šiuos žingsnius:

a) mutantinio fibroblastų augimo faktoriaus-21 gamyba rekombinantiniu būdu; ir

b) mutantinio fibroblastų augimo faktoriaus-21 glikozilinimas naujai įvestoje glikozilinimo vietoje,

kur

minėtas glikozilinimas yra vykdomas ne ląstelėje, o *in vitro*, kur atitinkamo laukinio tipo fibroblastų augimo faktorius turi aminorūgščių seką, kuri yra ne mažiau kaip 95% homologinė SEQ ID NO: 146 sekai, ir kur naujai įvesta glikozilinimo vieta yra mažiau nei 4 amino rūgščių atstumu nuo prolino liekanos C- arba N- galo, pvz., prolino liekana yra 3, 5, 9, 50, 61, 79, 91, 116, 120, 125, 129, 134, 139, 151, 156, 166, 172, arba 178 padėtyje SEQ ID NO: 146 sekoje.

8. Būdas pagal 11 punktą, kur mutantinis fibroblastų augimo faktorius-21 apima bent vieną amino rūgščių seką parinktą iš grupės, susidedančios iš SEQ ID NOs: 161-214, 220-320 ir 323-337, ir/arba kur mutantinis fibroblastų augimo faktorius turi daugiau nei vieną naujai įvestą glikozilinimo vietą.

9. Farmacinė kompozicija, apimanti efektyvų junginio, pagal bet kurį iš 1-4 ir 8-10 punktų, kiekį.

10. Produktas pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 4 ir nuo 8 iki 10, skirtas fibroblastų augimo faktoriaus trūkumo gydymui.11.

11. Mutantinio fibroblastų augimo faktoriaus-21 glikokonjugato gamybos būdas, kuris apima naujai įvestą su N- arba O- susijusią glikozilinimo vietą, kuri neegzistuoja atitinkamame laukinio tipo fibroblastų augimo faktoriuje, apimantis stadijas, kuriose:

a) gaminamas mutantinis fibroblastų augimo faktorius-21 rekombinantiniu būdu; ir

b) fermentais glikozilinamas mutantinis fibroblastų augimo faktorius-21 su modifikuotu cukrumi naujai įvestoje glikozilinimo vietoje

kur

glikozilinimas yra vykdomas ne ląstelėje, o *in vitro*; kur atitinkamas laukinio tipo fibroblastų augimo faktorius turi aminorūgščių seką SEQ ID NO: 146; ir kur naujai įvesta glikozilinimo vieta yra mažiau nei 4 amino rūgščių atstumu nuo prolino liekanos C- arba N- galo, pvz., prolino liekana yra 3, 5, 9, 50, 61, 79, 91, 116, 120, 125, 129, 134, 139, 151, 156, 166, 172, arba 178 padėtyje SEQ ID NO: 146 sekoje, ir /arba kur mutantinis fibroblastų augimo faktorius-21 apima bent vieną amino rūgščių seką, parinktą iš grupės, susidedančios iš SEQ ID NOs: 161-214, 220-320 ir 323-337, ir/arba mutantinis fibroblastų augimo faktorius-21 turi daugiau nei vieną naujai įvestą glikozilinimo vietą; pasirinktinai pakeistas cukrus yra modifikuotas vandenyje tirpiu polimeru, o, pasirinktinai, vandenyje tirpus polimeras, yra parinktas iš grupės, susidedančios iš poli(etileno glikolio) ir m-poli(etileno glikolio).

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 39/395*** (2006.01)
***A61K 47/18*** (2006.01)
***A61P 35/00*** (2006.01)
***C07K 16/28*** (2006.01)

*(11)* **1865986**

*(96)* 06736812.6

*(96)* 2006-03-02

*(97)* 2007-12-19

*(97)* 2016-02-17

*(86)* PCT/US2006/007555

*(86)* 2006-03-02

*(87)* WO 2006/096491

*(87)* 2006-09-14

*(30)* 659766 P, 2005-03-08, US
728165 P, 2005-10-19, US
752712 P, 2005-12-20, US
762456 P, 2006-01-26, US

*(72)* ABATE, Justin Donald, US
DAS, Tapan Kanti, US
ELLIOTT, Carrie Marie, US
MUTHURANIA, Kevin Wamiti, US
NEMA, Sandeep, US
SINGH, Satish Kumar, US

*(73)* Pfizer Products Inc., Groton, CT 06340, US

*(74)* Tatjana STERLINA, 37, UAB „Intels“, Naugarduko g. 32/2, LT-03225 Vilnius, LT

*(54)* Anti-CTLA-4 antikūnų kompozicijos
Apibrėžties punktai: 17, brėžiniai: 15.

*(57)* 1. Skysta kompozicija, apimanti:
- EDTA arba EDTA druskas, esant koncentracijai nuo 0,01 mM iki 5,0 mM,
- histidiną, esant koncentracijai nuo 1 mM iki 100 mM ir
- bent vieną žmogaus IgG antikūną, esant koncentracijai nuo 1 mg/ml iki 200 mg/ml, kurioje minėtas antikūnas apima:
- amino rūgščių seką, kuri yra bent 90 % identiška sunkiosios grandinės aminorūgščių sekai, parodytai SEQ ID Nr. 2 ir
- amino rūgščių seką, kuri yra bent 90 % identiška lengvosios grandinės aminorūgščių sekai, parodytai SEQ ID Nr. 4,
kurioje antikūnas rišasi prie žmogaus CTLA-4.

2. Kompozicija pagal 1 punktą, kurioje antikūnas yra žmogaus IgG2 antikūnas.

3. Kompozicija pagal 1 punktą, kurioje antikūnas apima sunkiosios grandinės aminorūgščių seką, pasižyminčią bent 99 % sekos identiškumu sekai SEQ ID Nr. 2 ir lengvosios grandinės aminorūgščių seką, pasižyminčią bent 99 % sekos identiškumu sekai SEQ ID Nr. 4.

4. Kompozicija pagal 1 punktą, kurioje antikūnas apima sunkiąją grandinę, kuri apima kintamos srities aminorūgščių seką SEQ ID Nr. 2 ir lengvąją grandinę, kuri apima kintamos srities aminorūgščių seką SEQ ID Nr. 4.

5. Kompozicija pagal 1 punktą, kurioje antikūnas yra monokloninis IgG2 anti-CTLA-4 antikūnas, turintis sunkiosios ir lengvosios grandinės aminorūgščių sekas SEQ ID Nr. 2 ir Nr. 4, atitinkamai.

6. Kompozicija pagal 1 punktą, kurioje kompozicija papildomai apima paviršinio aktyvumo medžiagą.

7. Kompozicija pagal 1 punktą, kurioje kompozicija papildomai apima paviršinio aktyvumo medžiagą ir tonuso agentą.

8. Kompozicija pagal 1 punktą, kurioje kompozicija papildomai apima polisorbatą 80 ir tonuso agentą.

9. Kompozicija pagal 1 punktą, kurioje kompozicija papildomai apima polisorbatą 80 ir trehalozę.

10. Kompozicija pagal 1 punktą, kurioje kompozicija apima:
- antikūną, esant koncentracijai nuo 1 mg/ml iki 200 mg/ml,
- EDTA, esant koncentracijai nuo 0,01 mM iki 5,0 mM ir
- histidiną, esant koncentracijai nuo 1 mM iki 100 mM.

11. Kompozicija pagal 1 punktą, kurioje kompozicija apima:
- antikūną, esant koncentracijai nuo 1 mg/ml iki 100 mg/ml,
- EDTA arba EDTA druskas, esant koncentracijai nuo 0,01 mM iki 1,0 mM,
- histidiną, esant koncentracijai nuo 1 mM iki 100 mM,
- polisorbatą 80, esant koncentracijai nuo 0,01 mg/ml iki 10 mg/ml ir
- tonuso agentą, esant koncentracijai nuo 100 mM iki 300 mM.

12. Kompozicija pagal 1 punktą, kurioje kompozicija apima:
- antikūną, esant koncentracijai nuo 0,1 mg/ml iki 100 mg/ml,
- EDTA arba EDTA druskas, esant koncentracijai nuo 0,001 mg/ml iki 1,0 mg/ml,
- histidiną, esant koncentracijai nuo 1 mM iki 50 mM,
- polisorbatą 80, esant koncentracijai nuo 0,01 mg/ml iki 5 mg/ml ir
- trehalozę, esant koncentracijai nuo 10 mg/ml iki 200 mg/ml.

13. Kompozicija pagal 1 punktą, kurioje kompozicija apima:
- 20 mg/ml antikūno,
- 0,27 mM EDTA arba EDTA druskos,
- 20 mM histidino,
- 0,2 mg/ml polisorbato 80 ir
- 222 mM trehalozės.

14. Kompozicija pagal 1 punktą, kurioje kompozicija apima:
- 20 mg/ml antikūno,
- 0,1 mg/ml EDTA arba EDTA druskos,
- 20 mM histidino,
- 0,2 mg/ml polisorbato 80 ir
- 84 mg/ml trehalozės.

15. Kompozicija pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kurioje bendras chromatogramos smailės plotas po skystos kompozicijos saugojimo maždaug 40 °C temperatūroje, maždaug 24 savaites ir bendras chromatogramos smailės plotas po saugojimo kitaip identiškos kompozicijos, kuri neturi EDTA arba EDTA druskų, maždaug 40 °C temperatūroje, maždaug 24 savaites, sumažėjo bent apie 2 %.

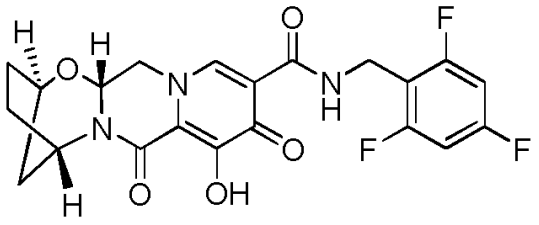
16. Skysta kompozicija pagal bet kurį iš 1-15 punktų, skirta naudoti neoplazijos būsenos gydymui subjekte.

17. Kompozicijos pagal bet kurį iš 1-15 punktų gavimo būdas, apimantis minėto antikūno, kuris rišasi prie žmogaus CTLA-4, sumaišymą tirpale su minėtomis EDTA arba EDTA druskomis.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61K 45/06*** (2006.01)
***A61K 31/498*** (2006.01)
***A61K 31/529*** (2006.01)
***A61K 31/537*** (2006.01)
***A61K 31/551*** (2006.01)
***C07D 471/18*** (2006.01)
***C07D 498/18*** (2006.01)
***C07D 471/22*** (2006.01)

*(11)* **2822954**
*(96)* 13815937.1
*(96)* 2013-12-19
*(97)* 2015-01-14
*(97)* 2016-03-09
*(86)* PCT/US2013/076367
*(86)* 2013-12-19
*(87)* WO 2014/100323
*(87)* 2014-06-26
*(30)* 201261745375 P, 2012-12-21, US
201361788397 P, 2013-03-15, US
201361845803 P, 2013-07-12, US
*(72)* JIN, Haolun, US
LAZERWITH, Scott, E., US
TREJO MARTIN, Teresa, Alejandra, US
BACON, Elizabeth, M., US
COTTELL, Jeromy, J., US
CAI, Zhenhong, R., US
PYUN, Hyung-Jung, US
MORGANELLI, Philip, Anthony, US
JI, Mingzhe, US
TAYLOR, James, G., US
CHEN, Xiaowu, US
MISH, Michael, R., US
DESAI, Manoj, C., 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)* Policikliniai karbamoilpiridino junginiai ir jų farmacinis panaudojimas
Apibrėžties punktai: 7, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Junginys, kurio formulė Ia, turintis šią struktūrą:




arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

2. Farmacinė kompozicija, apimanti junginį pagal 1 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtiną jo druską ir farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį, skiediklį arba užpildą.

3. Farmacinė kompozicija pagal 2 punktą, kur minėta farmacinė kompozicija papildomai apima vieną arba daugiau papildomų terapinių agentų.

4. Farmacinė kompozicija pagal 3 punktą, kur vienas arba daugiau papildomi terapiniai agentai yra agentai prieš ŽIV.

5. Farmacinė kompozicija pagal 4 punktą, kur vienas arba daugiau papildomų terapinių agentų yra parinkti iš grupės, susidedančios iš ŽIV proteazės inhibitorių, ŽIV atvirkštinės transkriptazės nenukleozidinių inhibitorių, ŽIV atvirkštinės transkriptazės nukleozidinių inhibitorių, ŽIV atvirkštinės transkriptazės nukleotidinių inhibitorių ir jų derinių.

6. Junginys arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska pagal 1 punktą arba farmacinė kompozicija pagal bet kurį iš 2-5 punktą, skirti naudoti žmogaus, sergančio arba priklausančio rizikos grupei būti infekuotam, ŽIV infekcijos gydymo būde.

7. Junginys arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska pagal 1 punktą arba farmacinė kompozicija pagal bet kurį iš 2-5 punktą, skirti naudoti medicininėje terapijoje.

---

*(51)* Int.Cl. ***A61M 15/00*** (2006.01)
*(11)* **2496294**
*(96)* 10779467.9
*(96)* 2010-11-05
*(97)* 2012-09-12
*(97)* 2016-01-27
*(86)* PCT/EP2010/006744
*(86)* 2010-11-05
*(87)* WO 2011/054527
*(87)* 2011-05-12
*(30)* 0919465, 2009-11-06, GB
298705 P, 2010-01-27, US
*(72)* BLAIR, Julian, Alexander, IE
BUCK, Daniel, IE
HAZENBERG, Jan, Geert, IE
ZENG, Xian-Ming, GB
*(73)* Norton Healthcare Limited, Castleford, West Yorkshire WF10 5HX, GB
*(74)* Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Kvėpavimui suaktyvinamo sausų miltelių inhaliatoriaus oro srauto adapteris
Apibrėžties punktai: 8, brėžiniai: 7.
*(57)* 1. Kvėpavimu suaktyvinamas sausų miltelių inhaliatorius (600; 700), apimantis oro srauto adapterį (100; 200; 300; 501; 601; 702), kur oro srauto adapteris (100; 200; 300; 501; 601; 702) apima:
pirmą kanalą (101; 202; 302; 507; 602; 703), turintį artimąjį bei tolimąjį galą, kur per artimąjį galą vyksta skysčių susisiekimas tarp degranuliatoriaus išleidžiamosios angos (530) bei tolimojo pirmo kanalo galo (101; 202; 302; 507; 602; 703) ir bent vieną antrą kanalą (102-105; 204-206; 304-306; 502-505; 603-606) oro srautui praleisti iš adapterio artimojo galo (100; 200; 300; 501; 601; 702) į adapterio tolimąjį galą (100; 200; 300; 501; 601; 702) atskirai nuo oro srauto pirmame kanale (101; 202; 302; 507; 602; 703), kai oro srauto adapterio tolimasis galas (100; 200; 300; 501; 601; 702) yra veikiamas kvėpavimu sužadinto žemo slėgio,
b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad bent vieno antro kanalo (102-105; 204-206; 304-306; 502-505; 603-606) bendrojo skerspjūvio ir pirmo kanalo (101; 202; 302; 507; 602; 703) bendrojo skerspjūvio santykis yra toks, jog kvėpavimu sužadinus žemą slėgį oro srauto adapterio tolimajame gale (100; 200; 300; 501; 601; 702) nuo 20% iki 50% susidariusio oro srauto praeina per bent vieną antrą kanalą (102-105; 204-206; 304-306; 502-505; 603-606).

2. Inhaliatorius pagal 1 punktą, kur pirmo kanalo tolimasis galas (101; 202; 302; 507; 602; 703) apima pirmą apskritą jungę (106; 203; 303; 506; 704) ir antras kanalas (102-105; 204-206; 304-306; 502-505; 603-606) yra bent vienos angos pirmoje apskritoje jungėje (106; 203; 303; 506; 704) pavidalo.

3.Inhaliatorius pagal 2 punktą, kur pirma apskrita jungė (106; 203; 303; 506; 704) apima dvi, geriau – keturias angas.

4. Inhaliatorius pagal bet kurį pirmesnį punktą, kur oro srauto adapteris (100; 200; 300; 501; 601; 702) apima antrą apskritą jungę (208; 308; 508; 705) artimajame oro srauto adapterio (100; 200; 300; 501; 601; 702) gale, antra apskrita jungė (208; 308; 508; 705) apima bent vieną, geriau – keturias angas.

5. Inhaliatorius pagal 4 punktą, kur angų antroje apskritoje jungėje (208; 308; 508; 705) skerspjūvio ir pirmo kanalo (101; 202; 302; 507; 602; 703) skerspjūvio santykis yra toks, kad kvėpavimu sužadinus žemą slėgį tolimajame oro srauto adapterio (101; 202; 302; 507; 602; 703) gale, bent 20% susidariusio oro srauto eina per angas.

6. Inhaliatorius pagal bet kurį punktą nuo 1 iki 5, papildomai apimantis degranuliatorių (400; 500; 701), sudarytą iš:
vidinės sienelės (412; 512), ribojančios sūkurinę kamerą (414; 514), besitęsiančią išilgai ašies (A) nuo pirmo galo (418; 518) iki antro galo (420; 520); sausų miltelių tiekimo angos (422; 522) sūkurinės kameros (414; 514) pirmame gale (418; 518), skirtos skysčiams susisiekti tarp inhaliatoriaus sausų miltelių tiekimo kanalo ir sūkurinės kameros (414; 514) pirmo galo (418; 518);
bent vienos įleidimo angos (424, 425; 524, 525) sūkurinės kameros (414; 514) vidinėje sienelėje (412; 512), esančios prie sūkurinės kameros (414; 514) pirmojo galo, per kurią skysčiai susisiekia tarp degranuliatoriaus (400; 500) išorėje esančios srities ir sūkurinės kameros (414; 514) pirmo galo (418; 518);
išleidimo angos (432; 530), per kurią skysčiai susisiekia tarp sūkurinės kameros (414; 514) antrojo galo (420; 520) ir oro srauto adapterio (100; 200; 300; 501; 601; 702); kur nuo kvėpavimu sužadinto žemo slėgio tolimajame oro srauto adapterio (100; 200; 300; 501; 601; 702) gale susidaro oro srautas į sūkurinę kamerą (414; 514) per sausų miltelių tiekimo angą (422; 522) ir įleidimo angą (424, 425; 524, 525).

7. Oro srauto per kvėpavimu suaktyvinamo sausų miltelių inhaliatoriaus degranuliatoriaus išleidimo angą keitimo būdas, apimantis tokius etapus:
a) oro srauto adapterio (100; 200; 300; 501; 601; 702), apimančio pirmą kanalą (101; 202; 302; 507; 602; 703) su artimuoju ir tolimuoju galu, kur oro srauto adapteris (100; 200; 300; 501; 601; 702) papildomai apima bent vieną antrą kanalą (102-105; 204-206; 304-306; 502-505; 603-606) oro srautui praleisti iš adapterio (100; 200; 300; 501; 601; 702) artimojo galo į adapterio (100; 200; 300; 501; 601; 702) tolimąjį galą atskirai nuo oro srauto per pirmąjį kanalą (101; 202; 302; 507; 602; 703), pateikimą;
b) pirmojo kanalo (101; 202; 302; 507; 602; 703) įrengimą taip, kad per jį susisiektų skysčiai tarp degranuliatoriaus išleidimo angos ir pirmojo kanalo (101; 202; 302; 507; 602; 703) tolimojo galo bei
c) kvėpavimu sužadinto žemo slėgio taikymą oro srauto adapterio (100; 200; 300; 501; 601; 702) tolimajame gale taip, kad oro srautas eitų per pirmąjį (101; 202; 302; 507; 602; 703) ir antrąjį kanalą (102-105; 204-206; 304-306; 502-505; 603-606); b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad suminio bent vieno antrojo kanalo (102-105; 204-206; 304-306; 502-505; 603-606) skerspjūvio ploto ir pirmojo kanalo (101; 202; 302; 507; 602; 703) skerspjūvio ploto santykis būtų toks, jog taikant kvėpavimu sužadintą žemą slėgį, oro srauto adapterio (100; 200; 300; 501; 601; 702) tolimajame gale nuo 20% iki 50% susidariusio oro srauto eitų per bent vieną antrąjį kanalą (102-105; 204-206; 304-306; 502-505; 603-606).

8. Būdas pagal 7 punktą, kur tiesinis srauto greitis per išleidimo angą yra sumažintas.

---

*(51)* Int.Cl. ***B01J 20/04*** (2006.01)
***B01J 20/32*** (2006.01)
***C02F 1/28*** (2006.01)
***C02F 11/14*** (2006.01)
***C02F 1/56*** (2006.01)
***C02F 1/66*** (2006.01)
***C02F 103/28*** (2006.01)
*(11)* **2773453**
*(96)* 12778745.5
*(96)* 2012-10-30
*(97)* 2014-09-10
*(97)* 2016-03-16
*(86)* PCT/EP2012/071471
*(86)* 2012-10-30
*(87)* WO 2013/064492

*(87)* 2013-05-10
*(30)* 11187987, 2011-11-04, EP
201161558146 P, 2011-11-10, US
*(72)* GERARD, Daniel E., CH
HARTAN, Hans-Georg, DE
SCHOELKOPF, Joachim, CH
SKOVBY, Michael, CH
GANE, Patrick A. C., CH
*(73)* Omya International AG, 4665 Oftringen, CH
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Apdoroto paviršiaus kalcio karbonato panaudojimas vandens gryninime ir vandens šalinime iš dumblo ir nuosėdų, ir susidariusių mišrių medžiagų
Apibrėžties punktai: 25, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Apdoroto paviršiaus kalcio karbonato panaudojimas vandens gryninimui ir/arba vandens šalinimui iš dumblo ir/arba nuosėdų,
kur bent 1% prieinamo kalcio karbonato paviršiaus ploto yra padengtas danga, apimančia bent vieną katijoninį polimerą, ir kur apdoroto paviršiaus kalcio karbonatas apima modifikuoto paviršiaus kalcio karbonatą, apdorotą katijoniniais polimerais papildomame apdorojimo etape, kur modifikuoto paviršiaus kalcio karbonatas yra gaunamas, reaguojant natūraliam kalcio karbonatui ir/arba kalcio karbonato nuosėdoms su rūgštimi ir su anglies dioksidu, prieš paruošiant apdoroto paviršiaus kalcio karbonatą, kur anglies dioksidas susidaro in situ veikiant rūgštimi ir/arba yra tiekiamas iš išorinio šaltinio.

2. Panaudojimas pagal 1 punktą, kur bent vieno apdoroto paviršiaus kalcio karbonato dalelių vidutinis skersmuo $d_{50}$ yra nuo 0,01 µm iki 250 µm, geriau nuo 0,06 µm iki 225 µm, dar geriau nuo 1 µm iki 200 µm, dar geriau nuo 1 µm iki 150 µm, o geriausiai nuo 1 µm iki 100 µm, ir/arba bent vieno apdoroto paviršiaus kalcio karbonato dalelių specifinis paviršiaus plotas yra nuo 1 iki 250 $m^2/g$, dar geriau nuo 20 iki 200 $m^2/g$, dar geriau nuo 30 iki 150 $m^2/g$, o geriausiai nuo 30 iki 100 $m^2/g$.

3. Panaudojimas pagal bet kurį iš 1 – 2 punktų, kur apdoroto paviršiaus kalcio karbonato danga apima bent vieną katijoninį polimerą, turintį teigiamo krūvio tankį intervale nuo 1 mEq/g iki 15 mEq/g, geriau intervale nuo 2,5 mEq/g iki 12,5 mEq/g, o geriausiai intervale nuo 5 mEq/g iki 10 mEq/g ir/arba apdoroto paviršiaus kalcio karbonato danga apima bent vieną katijoninį polimerą, kuriame ne mažiau kaip 60% monomerų vienetų turi katijoninį krūvį, pageidautina, ne mažiau kaip 70%, geriau ne mažiau kaip 80%, dar geriau ne mažiau kaip 90%, o geriausiai 100%.

4. Panaudojimas pagal bet kurį iš 1 – 3 punktų, kur apdoroto paviršiaus kalcio karbonato danga apima bent vieną katijoninį polimerą, kurio vidutinė molekulinė masė $M_w$ yra mažesnė nei 1 000 000 g/mol, geriau nuo 50 000 iki 750 000 g/mol, dar geriau nuo 50 000 iki 650 000 g/mol, o geriausiai nuo 100 000 iki 300 000 g/mol.

5. Panaudojimas pagal bet kurį iš 1 – 4 punktų, kur apdoroto paviršiaus kalcio karbonato danga apima bent vieną katijoninį polimerą, kuris yra homopolimeras, sudarytas iš monomerų vienetų, parinktų iš grupės, sudarytos iš dialildialkilamonio druskų; tretinių ir ketvirtinių aminų; ketvirtinių iminų, pageidautina, dialildialkilamonio druskų.

6. Panaudojimas pagal bet kurį iš 1 – 4 punktų, kur apdoroto paviršiaus kalcio karbonato danga apima bent vieną katijoninį polimerą, kuris yra kopolimeras, sudarytas iš monomerų vienetų, parinktų iš dialildialkilamonio druskų ir komonomerų vienetų, parinktų iš grupės, sudarytos iš akrilamido; metakrilamido; N,N-dimetil-akrilamido; akrilo rūgšties; metakrilo rūgšties; vinilsulfoninės rūgšties; vinilpirolidono; hidroksilo etilakrilato; stireno; metilmetakrilato; vinilacetato ir jų mišinių.

7. Panaudojimas pagal bet kurį iš 1 – 6 punktų, kur ne mažiau kaip 10% prieinamo kalcio karbonato paviršiaus ploto yra padengta katijoniniu polimeru, geriau bent 20% prieinamo paviršiaus ploto, dar geriau bent 30%, dar geriau bent 40%, o geriausiai 50% prieinamo paviršiaus ploto.

8. Panaudojimas pagal bet kurį iš 1 – 7 punktų, kur apdoroto paviršiaus kalcio karbonatas yra miltelių pavidalo ir/arba granulių pavidalo arba suspensijos pavidalo.

9. Panaudojimas pagal bet kurį iš 1 – 8 punktų, kur apdoroto paviršiaus kalcio karbonatas yra naudojamas kartu su bent vienu polimeriniu flokuliantu.

10. Panaudojimas pagal 9 punktą, kur polimerinio flokulianto vidutinė molekulinė masė $M_w$ yra intervale nuo 100 000 iki 10 000 000 g/mol, geriau intervale nuo 300 000 iki 5 000 000 g/mol, dar geriau intervale nuo 300 000 iki 1 000 000 g/mol, o geriausiai intervale nuo 300 000 iki 800 000 g/mol ir/arba polimerinis flokuliantas yra nejoninis arba anijoninis, geriau katijoninis arba anijoninis polimeras, parinktas iš poliakrilamidų, poliakrilatų, poli(dialildimetilamonio chlorido), polietileniminų, poliaminų, krakmolų ar jų mišinių.

11. Kompozitinė medžiaga, apimanti apdoroto paviršiaus kalcio karbonatą ir priemaišas, gaunamas vandens gryninimo ir/arba vandens šalinimo iš dumblo ir/arba nuosėdų, proceso metu, kai procesas apima tokius etapus:

a) gryninamo vandens ir/arba dumblo ir/arba nuosėdų, iš kurių turi būti pašalintas vanduo, apimantis priemaišas, pateikimas;

b) bent vieno apdoroto paviršiaus kalcio karbonato, kuriame bent 1% prieinamo kalcio karbonato paviršiaus ploto yra padengtas danga, apimančia bent vieną katijoninį polimerą, pateikimas ir

c) vandens ir/arba dumblo ir/arba nuosėdų iš etapo a) kontaktavimas su bent vienu apdoroto paviršiaus kalcio karbonatu iš etapo b), siekiant gauti kompozitinę medžiagą, sudarytą iš apdoroto paviršiaus kalcio karbonato ir priemaišų, kur apdoroto paviršiaus kalcio karbonatas apima modifikuoto paviršiaus kalcio karbonatą, apdorotą katijoniniais polimerais papildomame apdorojimo etape, ir

kur modifikuoto paviršiaus kalcio karbonatas yra gaunamas, reaguojant natūraliam kalcio karbonatui ir/arba kalcio karbonato nuosėdoms su rūgštimi ir su anglies dioksidu, prieš paruošiant apdoroto paviršiaus kalcio karbonatą, kur anglies dioksidas yra gaunamas, apdorojant in situ rūgštimi ir/arba yra tiekiamas iš išorinio šaltinio.

12. Kompozitinė medžiaga pagal 11 punktą, kur vanduo ir/arba dumblas ir/arba nuosėdos iš etapo a) yra parinktos iš pramonės nuotekų, geriamo vandens, miesto nuotekų, dumblo, pavyzdžiui, uostų dumblo, upių dumblo, pakrančių dumblo, suardomo dumblo, nuotekų technologinių procesų paveikto vandens iš alaus daryklų ar kitų gėrimų pramonės įmonių, nuotekų ar technologinių procesų paveikto vandens iš popieriaus pramonės, dažų ar dangų pramonės įmonių, žemės ūkio nuotekų, skerdyklų nuotekų, odos pramonės įmonių nuotekų arba odos rauginimo pramonės įmonių nuotekų.

13. Kompozitinė medžiaga pagal bet kurį iš 11 - 12 punktų, kur bent vieno apdoroto paviršiaus kalcio karbonato dalelių vidutinis skersmuo $d_{50}$ yra nuo 0,01 µm iki 250 µm, geriau nuo 0,06 µm iki 225 µm, dar geriau nuo 1 µm iki 200 µm, dar geriau nuo 1 µm iki 150 µm, o geriausiai nuo 1 µm iki 100 µm, ir/arba bent vieno apdoroto paviršiaus kalcio karbonato dalelių specifinis paviršiaus plotas yra nuo 1 iki 250 $m^2/g$, dar geriau nuo 20 iki 200 $m^2/g$, dar geriau nuo 30 iki 150 $m^2/g$, o geriausiai nuo 30 iki 100 $m^2/g$.

14. Kompozitinė medžiaga pagal bet kurį iš 11 - 13 punktų, kur apdoroto paviršiaus kalcio karbonato danga apima bent vieną katijoninį polimerą, turintį teigiamo krūvio tankį intervale nuo 1 mEq/g iki 15 mEq/g, geriau intervale nuo 2,5 mEq/g iki 12,5 mEq/g, o geriausiai intervale nuo 5 mEq/g iki 10 mEq/g ir/arba apdoroto paviršiaus kalcio karbonato danga apima bent vieną katijoninį polimerą, kuriame ne mažiau kaip 60% monomerų vienetų turi katijoninį krūvį, pageidautina, ne mažiau kaip 70%, geriau ne mažiau kaip 80%, dar geriau ne mažiau kaip 90%, o geriausiai 100%.

15. Kompozitinė medžiaga pagal bet kurį iš 11 – 14 punktų, kur apdoroto paviršiaus kalcio karbonato danga apima bent vieną katijoninį polimerą, kurio vidutinė molekulinė masė $M_w$ yra mažesnė nei 1 000 000 g/mol, geriau nuo 50 000 iki 750 000 g/mol, dar geriau nuo 50 000 iki 650 000 g/mol, o geriausiai nuo 100 000 iki 300 000 g/mol.

16. Kompozitinė medžiaga pagal bet kurį iš 11 – 15 punktų, kur apdoroto paviršiaus kalcio karbonato danga apima bent vieną katijoninį polimerą, kuris yra homopolimeras, sudarytas iš monomerų vienetų, parinktų iš grupės, sudarytos iš dialildialkilamonio druskų; tretinių ir ketvirtinių aminų; ketvirtinių iminų, pageidautina, dialildialkilamonio druskų.

17. Kompozitinė medžiaga pagal bet kurį iš 11 – 15 punktų, kur apdoroto paviršiaus kalcio karbonato danga apima bent vieną katijoninį polimerą, kuris yra kopolimeras, sudarytas iš monomerų vienetų, parinktų iš dialildialkilamonio druskų ir komonomerų vienetų, parinktų iš grupės, sudarytos iš akrilamido; metakrilamido; N,N-dimetil-akrilamido; akrilo rūgšties; metakrilo rūgšties; vinilsulfoninės rūgšties; vinilpirolidono; hidroksilo etilakrilato; stireno; metilmetakrilato; vinilacetato ir jų mišinių.

18. Kompozitinė medžiaga pagal bet kurį iš 11 – 17 punktų, kur ne mažiau kaip 10% prieinamo kalcio karbonato paviršiaus ploto yra padengta katijoniniu polimeru, geriau bent 20% prieinamo paviršiaus ploto, dar geriau bent 30%, dar geriau bent 40%, o geriausiai 50% prieinamo paviršiaus ploto.

19. Kompozitinė medžiaga pagal bet kurį iš 11 – 18 punktų, kur bent vienas apdoroto paviršiaus kalcio karbonatas yra miltelių pavidalo ir/arba granulių pavidalo arba suspensijos pavidalo.

20. Kompozitinė medžiaga pagal bet kurį iš 11 – 19 punktų, kur procesas papildomai apima d) etapą, kur gryninamas vanduo ir/arba dumblas ir/arba nuosėdos iš kurių turi būti pašalintas vanduo iš a) pakopos yra sujungiami su bent vienu polimeriniu flokuliantu.

21. Kompozitinė medžiaga pagal 20 punktą, kur polimerinio flokulianto vidutinė molekulinė masė $M_w$ yra intervale nuo 100 000 iki 10 000 000 g/mol, geriau intervale nuo 300 000 iki 5 000 000 g/mol, dar geriau intervale nuo 300 000 iki 1 000 000 g/mol, o geriausiai intervale nuo 300 000 iki 800 000 g/mol ir/arba polimerinis flokuliantas yra nejoninis arba anijoninis, geriau katijoninis arba anijoninis polimeras, parinktas iš poliakrilamidų, poliakrilatų, poli(dialildimetilamonio chlorido), polietileniminų, poliaminų, krakmolų ar jų mišinių.

22. Kompozitinė medžiaga pagal bet kurį iš 20 - 21 punktų, kur c) etapas ir d) etapas yra atliekami tuo pačiu metu arba atskirai, pageidautina tuo pačiu metu.

23. Kompozitinė medžiaga pagal bet kurį iš 11 - 22 punktų, kur c) etapas ir/arba d) etapas yra atliekami bent iš dalies padengiant vandens ir/arba dumblo ir/arba apdorojamų nuosėdų iš a) etapo, paviršių su bent vienu apdoroto paviršiaus kalcio karbonatu iš b) etapo ir/arba maišant vandenį ir/arba dumblą ir/arba nuosėdas, kurias reikia apdoroti iš a) etapo, su bent vienu apdoroto paviršiaus kalcio karbonatu iš b) etapo.

24. Kompozitinė medžiaga pagal bet kurį iš 11 - 23 punktų, kur c) etapas ir/arba d) etapas yra kartojami vieną arba daugiau kartų.

25. Kompozitinė medžiaga pagal bet kurį iš 11 - 24 punktų, kur kompozitinė medžiaga sudaryta iš bent vieno apdoroto paviršiaus kalcio karbonato ir priemaišų, yra pašalinama iš vandens ir/arba dumblo ir/arba nuosėdų filtruojant, sedimentacijos ir/arba centrifugavimo būdu.

---

*(51)* Int.Cl. ***B29B 9/12*** (2006.01)
***B29K 67/00*** (2006.01)
***C08G 63/183*** (2006.01)
***C08G 63/185*** (2006.01)

*(11)* **1953179**

*(96)* 08005050.3

*(96)* 2005-03-03

*(97)* 2008-08-06

*(97)* 2016-04-27

*(30)* 795783, 2004-03-08, US

*(72)* Colhoun, Frederick Leslie, US
Ekart, Michael Paul, US
Jernigan, Mary Therese, US
Weinhold, Stephen, US

*(73)* GRUPO PETROTEMEX, S.A. DE C.V., San Pedro Garza Garcia, Nuevo Leon 66265, MX

*(74)* Tatjana STERLINA, 37, UAB „Intels“, Naugarduko g. 32/2, LT-03225 Vilnius, LT

*(54)* Poliesterio polimero dalelės, turinčios nuo paviršiaus į centrą nedidelį klampumo gradientą

Apibrėžties punktai: 8, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Talpos iš poliesterio polimero gamybos būdas, apimantis poliesterio dalelių, kurių kristališkumo laipsnis yra ne mažesnis kaip 35%, o vidinė klampa yra ne mažesnė kaip 0,70 dL/g, padavimą į ekstruzijos zoną, dalelių išlydimą ekstruzijos zonoje, kad sudarytų išlydytą poliesterio polimero struktūrą, ir formuojant lakštą arba išlydytą detalę iš išspausto išlydyto poliesterio polimero, papildomai apimantis dalelių džiovinimą, prieš paduodant daleles į ekstruzijos zoną, kuriame dalelės nėra polimerizuojamos kietojoje būsenoje prieš džiovinimą, ir kuriame dalelės turi 10 ppm arba mažesnį acetaldehido lygį iki išlydymo ekstruzijos zonoje, kuriame poliesterio dalelių, paduotų į ekstruzijos zoną, vidinė klampa jų paviršiuje yra mažiau negu 0,25 dL/g didesnė už vidinę klampą jų centre, kai „paviršiumi“ laikoma dalelės išorinė 8–12% masės dalis, o „centru“ – vidinė 8–16% masės dalis aplink dalelės centro tašką, kuriame kristališkumo laipsnis, vidinė klampa ir vidinės klampos skirtumas tarp paviršiaus ir centro yra nustatomas pagal atitinkamus metodus, kaip atskleista aprašyme, ir kuriame minėtos dalelės yra granulių formos.

2. Būdas pagal 1 arba 2 punktus, kuriame vidinė klampa dalelių paviršiuje yra mažiau negu 0,2 dL/g didesnė už vidinę klampą dalelės centre arba kuriame skirtumas tarp dalelių vidinės klampos jų paviršiuje ir centre yra 0,10 dL/g arba mažesnis, arba kuriame tas skirtumas yra 0,05 dL/g arba mažesnis.

3. Būdas pagal 1 arba 2 punktą, kuriame išlydyta detalė yra talpos ruošinys.

4. Būdas pagal 3 punktą, kurio metu tempimu ir pūtimu iš ruošinio yra išliejama gėrimui pritaikyta talpa.

5. Būdas pagal 4 punktą, kuriame talpos tūris yra 3 litrai arba mažiau.

6. Būdas pagal 2 punktą, apimantis dalelių džiovinimą džiovinimo zonoje, esant ne mažesnei kaip 140°C temperatūrai, prieš išlydant daleles ekstruzijos zonoje.

7. Būdas pagal bet kurį vieną iš 1-6 punktų, kuriame dalyvaujančių poliesterio polimero dalelių sudėtyje yra:

(a) karboksirūgšties komponentas, apimantis ne mažiau kaip 90 molinių procentų tereftalio rūgšties liekanų arba tereftalio rūgšties darinių, arba jų mišinio ir

(b) hidroksilo komponentas, apimantis ne mažiau kaip 90 molinių procentų etilenglikolio liekanų,

kai yra 100 molinių procentų karboksirūgšties komponento liekanų ir 100 molinių procentų hidroksilo komponento liekanų poliesterio polimere, ir ne mažiau kaip 75% poliesterio polimero yra grynasis polimeras.

8. Būdas pagal 7 punktą, kuriame dalyvaujančių poliesterio polimero dalelių sudėtyje yra:

(a) karboksirūgšties komponentas, apimantis ne mažiau kaip 92 molinius procentus tereftalio rūgšties liekanų arba tereftalio rūgšties darinių, arba jų mišinio ir

(b) hidroksilo komponentas, apimantis ne mažiau kaip 92 molinius procentus etilenglikolio liekanų,

kai yra 100 molinių procentų karboksirūgšties komponento liekanų ir 100 molinių procentų hidroksilo komponento liekanų poliesterio polimere.

---

*(51)* Int.Cl. ***B29C 57/02*** (2006.01)
***B29B 13/02*** (2006.01)

*(11)* **2614952**

*(96)* 10766300.7

*(96)* 2010-09-06

*(97)* 2013-07-17

*(97)* 2016-03-30

*(86)* PCT/ES2010/070580

*(86)* 2010-09-06

*(87)* WO 2012/032195

*(87)* 2012-03-15

*(72)* MUŃOZ DE JUAN, Ignacio, ES

*(73)* Molecor Tecnologia, S.L., 28840 Mejorada Del Campo, ES

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

*(54)* Įrenginys ir būdas tolygiai dviem kryptimis orientuotų plastikinių vamzdžių kaklelių su integruotais sandarinimo tarpikliais gamybai

Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 5.

*(57)* 1. Tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio kaklelio su integruotu tarpikliu gamybos įrenginys, kuris apima kaitinimo priemonę (21), vėsinimo priemonę (22), ir cilindrinį virbą, kuris apima:

pirmąjį sektorių (5), kurio išorinis diametras lygus arba didesnis už tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio (1) išorinį diametrą, sukonstruotą priimti minėto vamzdžio galo profilį, ir su išoriniu diametru, tinkančiu įvesti tarpiklį (12),

antrąjį cilindrinį sektorių (14), kurio diametras didesnis už aną pirmojo sektoriaus (5), kuris yra sudarytas, kaip tarpiklio (12) stabdis, ir

trečiąjį sektorių (15), koncentrinį ir išorinį antrajam sektoriui (14), b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad pirmasis sektorius (5) yra sukonstruotas bent iš trijų segmentų (6, 7, 8), atskirtų įvorėmis (9, 10, 11), antrasis sektorius (14) taip pat yra atskirtas nuo pirmojo sektoriaus (5) viena iš minėtų įvorių (11), ir kamera (16), atvira antruoju sektoriumi (14) viename iš jo galų, kuri yra apibrėžta tarp antrojo sektoriaus (14) ir trečiojo sektoriaus (15), kur yra nustatyta poveržlė (17), kuri leidžia įeiti kitam galo profiliui ir izoliuoja kamerą (16) nuo išorės,

taip pat tuo, kad bent du pirmojo sektoriaus (5) minėti segmentai (10, 11), antrasis sektorius (14) ir trečiasis sektorius (15) yra sujungti su kaitinimo priemone (21) ir (arba) vėsinimo priemone (22), valdoma kontroliavimo mazgu (20), kuris leidžia sektorių (14, 15) ir minėtų segmentų (10, 11) selektyvias ir nepriklausomas temperatūrines variacijas ir dėl to palaiko movos modeliavimą išvengiant vamzdžio dezorientavimo.

2. Tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio kaklelio su integruotu tarpikliu gamybos įrenginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad apima vakuuminę generavimo priemonę (23), prijungtą prie antgalių (13.1, 13.2, 13.3, 13.4), apibrėžtų kiekviename iš sektorių (5, 14, 15), su nepriklausomu reguliavimu vakuumo, generuojamo minėtuose sektoriuose (5, 14, 15) per kontroliavimo mazgą (20).

3. Tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio kaklelio su integruotu tarpikliu gamybos įrenginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad apima antgalius (13.1, 13.2, 13.3, 13.4) kiekviename iš sektorių (5, 14, 15), prijungtų prie kaitinimo ir (arba) vėsinimo priemonės kaitinimo ir (arba) vėsinimo fluido cirkuliavimui.

4. Tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio kaklelio su integruotu tarpikliu gamybos įrenginys pagal 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad antgaliai (13.1, 13.2, 13.3, 13.4) yra taip pat sujungti su kaitinimo (21) ir (arba) vėsinimo (22) priemone kaitinimo ir (arba) vėsinimo fluido cirkuliavimui ir fluidas yra oras.

5. Tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio kaklelio su integruotu tarpikliu gamybos įrenginys pagal vieną iš 2 – 4 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad pirmojo sektoriaus (5) antgaliai (13.1, 13.2) yra atitinkamai nustatyti antrame segmente (7) ir trečiame segmente (8).

6. Tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio kaklelio su integruotu tarpikliu gamybos įrenginys pagal 4 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad antrojo sektoriaus (14) antgaliai (13.3) yra prijungti prie vakuuminio generavimo mazgo, kai trečiojo sektoriaus (15) antgaliai (13.4) yra prijungti prie kaitinimo priemonės (21) arba priešingai.

7. Tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio kaklelio su integruotu tarpikliu gamybos įrenginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kaitinimo priemonė (21) yra pritaikyta kaitinti iki temperatūros taip, kad ji leistų segmentams (6, 7, 8) ir sektoriams (5, 14, 15) pasiekti plastiko temperatūrą pagal Vicat.

8. Tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio kaklelio su integruotu tarpikliu gamybos įrenginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad trečiasis sektorius (15) inkorporuoja jo priekiniame gale vėsinimo fluido atsikišimą (18), orientuotą link pirmojo sektoriaus (5), kuris leidžia, kad būtų atliekamas lokalizuotas vėsinimas.

9. Tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio kaklelio su integruotu tarpikliu gamybos įrenginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad trečiasis segmentas (8) turi diametrą šiek tiek mažesnį už antrojo segmento (7).

10. Tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio kaklelio su integruotu tarpikliu gamybos būdas, kuris atlieka įrenginio, aprašyto pagal bet kurį vieną ankstesnį punktą, panaudojimą ir kuris remiasi mova, apibrėžta galiniame tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio (1) profilyje, suformuotame per:

įterpimo plotą (3), gretimą daliai su nominaliu vamzdžio diametru (2), kuris didesnis už minėtą nominalų diametrą,

tarpiklio korpuso plotą (4), gretimą įterpimo plotui (3), su varijuojančiu diametru, didesniu už įterpimo ploto (3) diametrą, ir

snapelio plotą, gretimą korpuso plotui (4), sumontuotą su polinkiu aukštyn, geriau mažiau už 60°,

b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis apima šias fazes:

a) tarpiklio (12) įvedimą per pirmąjį virbo sektorių (5) tol, kol pasiekia antrąjį sektorių (14), kuris bus naudojamas kaip stabdis, būdamas patalpintas aplink trečiąjį segmentą (8),

b) virbo kartu su tarpikliu (12) įvedimą į galo profilį tam, kad pradėtų

c) snapelio ploto kaitinimą taip, kad snapelis prarastų diametrą iki tol, kol atsiremtų į antrąjį sektorių (14), kuris tarnauja kaip atrama, garantuojanti reguliarų susitraukimą,

d) virbo ašinį išėmimą tam, kad leistų snapeliui susitraukti ir pasiekti trečiąjį segmentą (8), kai snapelis pritaikytas prie jo išorinio diametro,

e) virbo ašinį išėmimą tam, kad snapelis pasiektų antrąjį segmentą ir kontaktuodama su juo vėstų,

f) visišką virbo pašalinimą tam, kad gautų movą.

11. Tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio kaklelio su integruotu tarpikliu gamybos būdas pagal 10 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad tarpiklio korpuso plotas (4) turi dvi dalis, nukreiptą į viršų nuožulnią pirmąją dalį (10.2,10.3), esančią po įterpimo ploto (3) ir viduje įgaubtos konfigūracijos antrąją dalį (10.3, 10.4, 10.5), kuri driekiasi po pirmosios dalies (10.2,10.3), ir pasibaigia snapelio plote, antroji dalis (10.3, 10.4, 10.5) yra suformuota su didesne viso kaklelio ašine orientacija.

12. Tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio kaklelio su integruotu tarpikliu gamybos būdas pagal bet kurį vieną 10 arba 11 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kaitinimo fazės metu, pirmojo segmento (6) temperatūra T1 yra

aplinkos temperatūra, antrojo segmento (7) temperatūra T2 yra žemiau aplinkos temperatūros ir trečiojo segmento (8) temperatūra T3, antrojo sektoriaus (14) T4, ir trečiojo sektoriaus (15) T5 yra artimos plastiko temperatūrai pagal Vicat'ą.

13. Tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio kaklelio su integruotu tarpikliu gamybos būdas pagal bet kurį vieną 10 arba 11 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad apima papildomą snapelio prikimšimo fazę prieš ašinį pašalinimą, aprašytą fazėje e), apimant virbo judesį link profilio liečiantis prie jo antrojo sektoriaus (14) priešais briauną, kai jis vėsinamas vėsinimo fluidu, kuris išeina iš antrojo segmento (7).

14. Tolygiai dviem kryptimis orientuoto vamzdžio kaklelio su integruotu tarpikliu gamybos būdas pagal 13 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad snapelio vėsinimas yra papildomai verčiamas per aušalo metimą iš briaunos atsikišimo (18).

---

*(51)* Int.Cl. ***B65D 85/804*** (2006.01)
***A47J 31/06*** (2006.01)
*(11)* **2566784**
*(96)* 11720282.0
*(96)* 2011-05-02
*(97)* 2013-03-13
*(97)* 2016-03-23
*(86)* PCT/CH2011/000100
*(86)* 2011-05-02
*(87)* WO 2011/137550
*(87)* 2011-11-10
*(30)* 10405093, 2010-05-04, EP
*(72)* DEUBER, Louis, CH
*(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)* Kapsulė gėrimo ekstrakcijai ir įrenginys gėrimui paruošti
Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 15.

*(57)* 1. Porcijos kapsulė (1), skirta užvirinamam gėrimui, ypatingai kavai, apimanti išorinę sienelę ir ekstrakcijos medžiagos sritį (31), kuri yra sukonstruota kapsulės viduje ir yra užpildyta ekstrakcijos medžiaga, kurioje tuščia sritis (32) yra pateikta kapsulės viduje, minėta tuščia sritis yra atskirta nuo ekstrakcijos medžiagos srities (31) atskyrimo elementu (22), kuris yra taip pat pateiktas kapsulės viduje, ir tuo, kad bent vienas skysčio kanalas (24) yra taip pat pateiktas kapsulės viduje, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad bent vienas skysčio kanalas yra prijungtas prie porcijos kapsulės išorinės sienelės nepralaidžiu skysčiui būdu, kur bent vienas skysčio kanalas susiremia su išorine sienele, ir tuo, kad skystis, kuris yra įvestas į kapsulę injekcijos vietoje, pradeda kontaktuoti su ekstrakcijos medžiaga ir gali būti išleistas iš kapsulės ties tašku, kuris yra ne injekcijos vieta, iš esmės be skysčio įėjimo į tuščią sritį (32).

2. Porcijos kapsulė pagal 1 punktą, kurioje bent vienas skysčio kanalas kerta tuščią sritį.

3. Porcijos kapsulė pagal 2 punktą, kurioje bent vienas skysčio kanalas yra vamzdžio formos.

4. Porcijos kapsulė pagal vieną iš ankstesnių punktų, kurioje atskyrimo elementas (22) yra sukonstruotas per įterpimo dalį (21), kuri yra įterpta į kapsulės korpusą (11), kuri yra uždaryta, pavyzdžiui, dangteliu (12).

5. Porcijos kapsulė pagal 4 punktą, kurioje įterpimo dalis (21) apima bent vieną išsitęsimą (24), kuris išsikiša iš atskyrimo elemento (22) tuščiavidurio elemento forma, kuris driekiasi tiek kiek išorės sienelė ir formuoja bent vieną skysčio kanalą, kurioje išsitęsimas yra geriu, kai sujungtas, pavyzdžiui, priklijuotas arba privirintas prie sienelės.

6. Porcijos kapsulė pagal 4 arba 5 punktą, kurioje įterpimo dalis (21) apima periferinę sienelę (29), kuri kartu su atskyrimo elementu (22) formuoja taurelės formos konstrukciją, kuri yra užpildyta bent kažkokia ekstrakcijos medžiaga.

7. Porcijos kapsulė pagal vieną iš 4 - 6 punktą, kurioje įterpimo dalis apima sandarinimo skirtuką (29,2), kuris yra prispaustas priešais išorinę sienelę padidintu spaudimu ekstrakcijos medžiagos srityje.

8. Porcijos kapsulė pagal 7 punktą, kurioje išorinė sienelė yra suformuota per kapsulės korpusą (11) ir dangtelį (12), uždengiantį minėtą kapsulės korpusą, kurioje sandarinimo skirtukas (29,2) yra įspaustas tarp kapsulės korpuso ir dangtelio.

9. Porcijos kapsulė pagal vieną iš ankstesnių punktų, kurioje tuščia sritis yra tuščiavidurė, išskyrus bent vieną skysčio kanalą ir galimus sutvirtinimus (26).

10. Porcijos kapsulė pagal vieną iš ankstesnių punktų, kurioje atskyrimo elementas (22) apima daugybę praėjimo angų, kurios jungia ekstrakcijos medžiagos sritį prie bent vieno skysčio kanalo, kurioje praėjimo angos (28) geriau smailėja kūginiu būdu link skysčio kanalo.

11. Gėrimo paruošimo sistema, apimanti:

- gėrimo paruošimo aparatą (201) su virimo kamera (202), kurioje gali būti talpinama porcijos kapsulė, kuri gali būti perdurta gėrimo paruošimo aparato įpurškimo pusės perdūrimo priemone (111), ir su skysčio pompa (203), skirta pristatyti karštą vandenį į virimo kamerą ir per įpurškimo pusės perdūrimo priemonę į porcijos kapsulę,
- pirmąją kapsulę (1') su pirmąja ekstrakcijos medžiagos sritimi, kuri yra užpildyta ekstrakcijos medžiaga, kurioje pirmoji ekstrakcijos medžiagos sritis apima pirmąjį talpumą, ir
- antrąją kapsulę (1) su antrąja ekstrakcijos medžiagos sritimi, kuri yra užpildyta ekstrakcijos medžiaga, kurioje antroji ekstrakcijos medžiagos sritis apima antrąjį talpumą,
- kurioje pirmosios kapsulės (1') išoriniai matmenys yra iš esmės identiški antrosios kapsulės (1) išoriniams matmenims, ir kurioje abiejų tipų kapsulių (1, 1') matmenys yra išlygiuoti pagal virimo kamerą,
- kurioje antroji kapsulė (1) yra porcijos kapsulė pagal vieną iš ankstesnių punktų.
- b e s i s k i r i a n t i tuo, kad pirmasis talpumas yra didesnis už antrąjį talpumą.

12. Gėrimo paruošimo sistema, apimanti

- gėrimo paruošimo aparatą (201) su virimo kamera (202), kurioje gali būti talpinama porcijos kapsulė, kuri gali būti perdurta gėrimo paruošimo aparato įpurškimo pusės perdūrimo priemone (111), ir su skysčio pompa (203), skirta pristatyti karštą vandenį į virimo kamerą ir per įpurškimo pusės perdūrimo priemonę į porcijos kapsulę,
- pirmojo tipo kapsulę (1') su pirmąja ekstrakcijos medžiagos sritimi, kuri yra užpildyta ekstrakcijos medžiaga, kurioje pirmoji ekstrakcijos medžiagos sritis apima pirmąjį talpumą, ir
- antrojo tipo kapsulę (1) su antrąja ekstrakcijos medžiagos sritimi, kuri yra užpildyta ekstrakcijos medžiaga, kurioje antroji ekstrakcijos medžiagos sritis apima antrąjį talpumą,
- kurioje pirmojo tipo kapsulės (1') kavos kapsulių išoriniai matmenys yra iš esmės identiški antrojo tipo kapsulės (1) kapsulių išoriniams matmenims, ir kurioje abiejų tipų kapsulių (1, 1') matmenys yra išlygiuoti pagal virimo kamerą,
- b e s i s k i r i a n t i tuo, kad pirmasis talpumas yra didesnis už antrąjį talpumą.

13. Gėrimo paruošimo sistema pagal 12 punktą, kurioje pristatymo pompos pumpavimo slėgis gali būti perjungtas bent tarp dviejų skirtingų eksploatavimo sąlygų.

14. Gėrimo paruošimo sistema pagal 12 arba 13 punktą, kurioje pirmasis talpumas yra bent 25 ml.

---

*(51)* Int.Cl. ***B65F 3/04*** (2006.01)
*(11)* **1955970**
*(96)* 08075089.6
*(96)* 2008-02-05
*(97)* 2008-08-13
*(97)* 2016-04-13
*(30)* 1033366, 2007-02-09, NL
*(72)* Versteeg, Jan Paul, NL
*(73)* Terberg Machines B.V., 3403 NL Ijsselstein, NL
*(74)* Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Krovimo sistemos, kuri skirta konteineriams išversti į transporto priemonę, pvz., atliekų surinkimo transporto priemonę, keliamojo rėmo atraminės dalies gamybos būdas
Apibrėžties punktai: 10, brėžiniai: 6.

*(57)* 1. Krovimo sistemos (40), kuri skirta konteineriams išversti į transporto priemonę, pvz., atliekų surinkimo transporto priemonę, keliamojo rėmo (4) atraminės dalies (8) gamybos būdas, apimantis šiuos etapus:

- lakšto formavimą laikomajai daliai (18), apimančiai jungiamąją laikomąją dalį (28), gauti;
- elastingos medžiagos formavimą kontaktinei daliai (30) tarp laikomosios dalies (18) ir konteinerio (40) gauti;
- atraminės dalies (8) gamybą, sujungiant kontaktinę dalį (30) su jungiamąja laikomąja dalimi (28) tvirtinimo priemonėmis (36,42), b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad
- pateikiama laikomoji dalis (18) su montavimo paviršiumi (20), kuriuo laikomoji dalis (18) jungiama su keliamuoju rėmu (4), naudojant pagalbines tvirtinimo priemones (22,24) laikomajai daliai (18) pritvirtinti prie keliamojo rėmo (4) ir
- formavimo metu yra suformuojamas laikomosios dalies (18) lenkimo taškas (26) tarp minėtos jungiamosios laikomosios dalies (28) ir minėto montavimo paviršiaus (20) jungiamajai laikomajai daliai (28) judėti keliamojo rėmo (4) atžvilgiu.

2. Būdas pagal 1 punktą, kur lakštas yra kaitinamas formuojant ir laikomoji dalis yra papildomai lenkiama tam tikru kampu atsilenkimui aušinimo metu kompensuoti.

3. Būdas pagal 1 arba 2 punktą, kur formuojant kontaktinę dalį, yra padaroma bent viena išėma (32).

4. Būdas pagal 3 punktą, kur bent viena išėma (32) yra daroma krovimo sistemos skersine kryptimi.

5. Būdas pagal 3 arba 4 punktą, kur atraminės dalies formavimas apima bent vienos standumo briaunos (36) sudarymą bent vienoje ar daugiau išėmų bent per dalį jų ilgio.

6. Būdas pagal vieną ar daugiau punktų nuo 2 iki 5, kur lakštui formuoti naudojama lakštinė medžiaga, pagaminta iš didelio tankio polietileno.

7. Būdas pagal vieną ar daugiau punktų nuo 1 iki 6, kur kontaktinės dalies formavimas atliekamas, naudojant gumą.

8. Būdas pagal vieną ar daugiau punktų nuo 1 iki 7, kur kontaktinei daliai suteikiama D raidės forma, kad ji geriau sugertų apkrovas.

9. Krovimo sistema konteineriams išversti (40), apimanti:

- keliamąjį rėmą (4) konteineriui suimti, išversti bei pastatyti į vietą ir - atraminę dalį (8), pagamintą pagal vieną ar daugiau pirmesnių punktų nuo 1 iki 8.

10. Transporto priemonė (2) su krovimo sistema pagal 9 punktą.

---

*(51)* Int.Cl. ***B65G 15/14*** (2006.01)
***B65G 39/06*** (2006.01)
*(11)* **2016010**
*(96)* 07725039.7
*(96)* 2007-05-09
*(97)* 2009-01-21
*(97)* 2016-02-24
*(86)* PCT/EP2007/004117
*(86)* 2007-05-09
*(87)* WO 2007/131690
*(87)* 2007-11-22
*(30)* 202006007637 U, 2006-05-11, DE
*(72)* VERLAGE, Bernhard, DE
*(73)* VHV Anlagenbau GmbH, 48477 Hörstel, DE
*(74)* Liudmila GERASIMOVIČ, 9, IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius, LT
*(54)* Stataus kampo konvejeris birioms medžiagoms
Apibrėžties punktai: 12, brėžiniai: 11.
*(57)* 1. Stataus kampo juostinis konvejeris skirtas birioms medžiagoms (1), apimantis pirmąją konvejerio juostą (3) ir antrąją konvejerio juostą (4), kurios paskirtis yra būti minėtos pirmosios konvejerio juostos dangos juosta, kur biri medžiaga (1), kuri yra paduodama iš esmės į pirmosios konvejerio juostos (3) centrinę dalį, gali būti gaunama

tarp dviejų juostų (3, 4) pereinamosios zonos (Z) srityje, kuri yra išlenkta transportavimo kryptimi (B), ir kur dvi juostos (3, 4) yra prispaustos viena prie kitos skersai judėjimo plokštumos (E), siekiant tokiu būdu transportuoti birią medžiagą (1) į transportavimo trajektorijos (F) statesnę toliau esančią dalį, kur pereinamojoje zonoje (Z) yra numatytas būgnas (6), kur būgnas sugriebia tiek apkrautą konvejerio juostą (3), tiek ir dangos juostos (4) pusę, kuri yra paduodama virš minėtos konvejerio juostos, kur bent viena iš paduodamų juostų (3, 4) dviejų pusių, formuoja birios medžiagos (1) priėmimo kamerą (9), radialinio formavimo priemonėmis, kur būgnas (6) apima gavimo zoną (10) į kurią gali būti įkelta dangos juostos (4) dalis, kuri tęsiasi radialiai į vidų per sugriebtą birią medžiagą (1), kur būgnas (6) turi du palaikančius cilindrus (13, 14), išdėstytus jos išilginės ašies (12) kryptimi, kad palaikytų dvi konvejerio pusės (T) briaunų sritis, kur minėti palaikantys cilindrai apibrėžia gavimo zoną (10), gaunančią nuo konvejerio pusės (T) formavimą radialine kryptimi, ir kur būgnas gavimo zonos (10) srityje turi bent vieną priešpriešiais veikiantį konstrukcijos elementą (15), kuris dengia minėtos gavimo zonos bent dalį ir dėl kurio radialinio formavimo srityje atsiranda radialinė atramos reakcijos jėga (G), veikianti bent daugiasluoksnę padavimo pusę (T), b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad būgnas (6) apima daugybę spyruoklinių elementų (17, 17‘), kurie yra plačiai išdėstomi tarp dviejų palaikančių cilindrų (13, 14), toje gavimo zonos (10) srityje, kaip ir priešpriešiais veikiantis elementas (15‘‘).

2. Stataus kampo juostinis konvejeris pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad būgnas (6) apima gavimo zoną (10), kurį gali būti reguliuojama palaikančiais cilindrais (13, 14), kurie gali judėti išilginės ašies (12) kryptimi (rodyklė D, D‘).

3. Stataus kampo juostinis konvejeris pagal bet kurį 1 arba 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad spyruokliniai elementai (17), padaryti kaip spiralinės spyruoklės (18), veikia palaikančių cilindrų (13, 14) srityje atitinkamus laikiklius, kurie yra sujungti su minėtais palaikančiais cilindrais ir yra padaryti kaip palaikymo žiedai (19, 20).

4. Stataus kampo juostinis konvejeris pagal 3 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad spiralinės spyruoklės (18) yra tvirtinamos atitinkamais reguliuojamais varžtais (21), einančiais per palaikymo žiedą (19, 20), ir gali pasisukti (rodyklė Q), kai ant jų užsideda dangos juosta (4).

5. Stataus kampo juostinis konvejeris pagal bet kurį 3 arba 4 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad spiralinės spyruoklės (18) gali būti įtemptos reguliuojamais varžtais (21, 30, 32) išilgine kryptimi (rodyklė H, H‘).

6. Stataus kampo juostinis konvejeris pagal vieną iš 3-5 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad spiralinių spyruoklių (18) palaikymo žiedas (19, 20) veikia kartu su atramine mova (25), kuri supa išilginę ašį (12) ir savo ruožtu apima įtaisą (27), kuris numatytas spiralinių spyruoklių (18) įtempimui (rodyklė H, H‘).

7. Stataus kampo juostinis konvejeris pagal 6 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad įtaisas (27) turi tvirtinimo plokštę (28) su daugybe radialinį poslinkį kompensuojančių reguliuojamų varžtų (30) ir guli ant palaikančios auselės (29) išilgine ašimi (12), kur tvirtinimo plokštelė veikia kartu su reguliavimo disku (31), kuris laikosi ant judamos atraminės movos (25).

8. Stataus kampo juostinis konvejeris pagal bet kurį iš 3-7 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad spyruokliniai elementai (17‘) numatyti kaip priešpriešiais veikiantys elementai (15‘‘) yra kiekvienas gale prijungti prie laikančiųjų plokštelių (36), kurios apima bent vieną laikantį kabliuką (35) ir yra paskirstytos palaikančio cilindro (13, 14) viduje kaip stipinai.

9. Stataus kampo juostinis konvejeris pagal 8 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kiekvienu atveju du iš laikančių kabliukų (35) yra sujungti su viena iš laikančiųjų plokštelių atitinkamai, per tarpinę (37) dalį, kurios skersinis pjūvis yra U-formos.

10. Stataus kampo juostinis konvejeris pagal bet kurį 8 arba 9 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad laikantis kabliukas (35) turi užkabinimo profilį (42), į kurį patenka spyruoklinio elemento (17‘) priešpriešiais veikiantis elementas (41), padarytas kaip kilpa arba panašiai, tokiu būdu, kad būgno (6) darbinėje padėtyje (rodyklė Q‘, Q‘‘) spyruoklinio elemento (17‘) gale gali būti absorbuotas mažos trinties būdu.

11. Stataus kampo juostinis konvejeris pagal 10 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad palaikymo trajektorija (S), tinkama priešpriešiais veikiančio elemento (41) ritininiam judesiui, gali būti nustatyta iš anksto, pagal užkabinimo profilį (42).

12. Stataus kampo juostinis konvejeris pagal bet kurį iš 3-11 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad spyruoklinio elemento (17‘) ašine ir/arba radialine kryptimi reguliuojama atrama susiformuoja laikančiųjų plokštelių (36) srityje.

*(51)* Int.Cl. ***C03B 3/00*** (2006.01)
***C03B 5/12*** (2006.01)
***C03B 3/02*** (2006.01)
***C03B 5/00*** (2006.01)

*(11)* **2788294**

*(96)* 12791498.4

*(96)* 2012-11-29

*(97)* 2014-10-15

*(97)* 2016-02-24

*(86)* PCT/EP2012/073895

*(86)* 2012-11-29

*(87)* WO 2013/083464

*(87)* 2013-06-13

*(30)* 11192325, 2011-12-07, EP

*(72)* HANSEN, Lars Elmekilde, DK

*(73)* Rockwool International A/S, 2640 Hedehusene, DK

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

*(54)* Būdas medžiagos recirkuliavimui, kai gaminamas mineralinis lydinys

Apibrėžties punktai: 8, brėžiniai: 1.

*(57)* 1. Būdas mineraliniam lydiniui gaminti deginant degiąją medžiagą, esant kietųjų dalelių mineralinei medžiagai ir taip formuojant lydinį, būdas apimantis šiuos žingsnius:

kuro, kietųjų dalelių mineralinės medžiagos, degimo dujų įpurškimą į cirkuliacinę degimo kamerą (1) per įleidimo vamzdį (4) ir kuro deginimą cirkuliacinėje degimo kameroje (1), be to, mineralinės medžiagos lydymą tam, kad formuotų mineralinį lydinį ir generuotų išmetamąsias dujas;

išmetamųjų dujų atskyrimą nuo mineralinio lydinio, mineralinio lydinio (9) surinkimą ir išmetamųjų dujų praėjimą į viršų per išmetamąjį vamzdį (10) į šilumos mainų sistemos vamzdyną (11); ir

kietųjų dalelių mineralinės medžiagos ir mineralinės vatos atliekų pirmosios dalies tiekimą į vamzdyną (11) ir patiektos medžiagos išankstinį pakaitinimą šilumos mainų sistemoje, prieš pradedant jai cirkuliuoti degimo kameroje (1), būdas yra b e s i s k i r i a n t i s

mineralinės vatos atliekų antrosios porcijos tiekimu su vandens kiekiu tarp 5 ir 25 % masės tiesiogiai į įleidimo vamzdį (4).

2. Būdas pagal 1 punktą, kuriame šilumos mainų sistema apima iš ankstinio pakaitinimo cikloną (12), kuris yra maitinamas per minėtą vamzdyną (11) su iš anksto pakaitintos mineralinės medžiagos tiekimu ir mineralinės vatos medžiagos atliekų tiekimu išankstiniam pakaitinimui prieš išeinant iš išankstinio kaitinimo ciklono (12) per tiekimo vamzdį (3) į įleidimo vamzdį (4) įpurškimui į cirkuliacinę degimo kamerą (1), kur medžiagos atliekų trečioji porcija yra tiekiama į tiekimo vamzdį (3).

3. Būdas pagal 2 punktą, kuriame medžiagų atliekos, tiekiamos į trečiąją porciją, yra lakieji pelenai.

4. Būdas pagal 3 punktą, kuriame mineralinės vatos atliekų antroji dalis yra tiekiama tiesiogiai į įleidimo vamzdį (4) pasroviui tiekimo vamzdžiui (3).

5. Būdas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame mineralinės vatos atliekų antroji dalis yra sumaišyta su lakiaisiais pelenais prieš tai, kai jie yra tiekiami tiesiogiai į įleidimo vamzdį (4).

6. Būdas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame mineralinės vatos atliekos yra sumalamos ir turi 10 – 15 masės % vandens kiekį prieš pradedant tiekimą.

7. Būdas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame apytiksliai 20 % bendro mineralinės vatos atliekų kiekio yra tiekiamas į vamzdyną (11) išankstiniam pakaitinimui ir apytiksliai 80 % bendro mineralinės vatos atliekų kiekio yra tiekiamas tiesiogiai į įleidimo vamzdį (4).

8. Būdas pagal bet kurį iš 3 – 5 punktų, kuriame apytiksliai 50 % bendrojo kiekio lakiųjų pelenų yra tiekiami į tiekimo vamzdį (3) ir apytikriai 50 % bendrojo kiekio lakiųjų pelenų yra sumaišomi su mineralinės vatos atliekomis prieš tai, kai pradedama tiekti tiesiai į įleidimo vamzdį (4).

*(51)* Int.Cl. ***C03B 5/12*** (2006.01)
***C03B 5/235*** (2006.01)
*(11)* **2102118**
*(96)* 08707021.5
*(96)* 2008-01-14
*(97)* 2009-09-23
*(97)* 2016-03-09
*(86)* PCT/EP2008/000216
*(86)* 2008-01-14
*(87)* WO 2008/086991
*(87)* 2008-07-24
*(30)* 07250138, 2007-01-15, EP
*(72)* HANSEN, Lars Elmekilde, DK
BOELLUND, Lars, DK
HANSEN, Lars Kresten, DK
HANSEN, Peter Farkas Binderup, DK
JENSEN, Leif Moller, DK
*(73)* Rockwool International A/S, 2640 Hedehusene, DK
*(74)* Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
*(54)* Būdas ir aparatas mineraliniams pluoštams gaminti
Apibrėžties punktai: 18, brėžiniai: 3.

*(57)* 1. Būdas mineraliniams pluoštams gaminti, apimantis

cirkuliacinės degimo kameros (1) numatymą, kuri susideda iš viršutinės sekcijos (2), apatinės sekcijos (3) ir pagrindo sekcijos (4),

pirminio kuro, kietųjų dalelių mineralinės medžiagos ir pirminių degimo dujų įvedimą į cirkuliacinės degimo kameros (1) viršutinę sekciją (2) ir pirminio kuro deginimą taip išlydant kietųjų dalelių medžiagą tam, kad formuotų mineralinį lydalą ir generuotų išmetamąsias dujas,

mineralinio lydalo atskyrimą nuo išmetamųjų dujų, kuriame išmetamosios dujos eina per išleidimo angą (8) cirkuliacinėje degimo kameroje (1) ir mineralinis lydalas teka žemyn apatinės sekcijos (3) sienomis kaip plona plėvelė ir susirenka cirkuliacinės degimo kameros (1) pagrindo sekcijoje (4), ir

surinkto lydalo srauto (13) tekėjimą per išleidimo angą (11) pagrindo sekcijoje (4) į išcentrinį pluošto gamybos aparatą (12) ir pluoštų formavimą,

b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad būdas taip pat apima antrinio kuro ir antrinių degimo dujų įvedimą į cirkuliacinės degimo kameros (1) apatinę sekciją (3) tam, kad formuotų liepsną apatinėje sekcijoje (3), kuri kaitina lydalą.

2. Būdas pagal 1 punktą, kuriame antrinis kuras apima skystą arba dujinį kurą.

3. Būdas pagal 1arba 2 punktą, kuriame antrinis kuras yra pasirinktas iš grupės, susidedančios iš alkoholių, propano, metano, gamtinių dujų ir jų mišinių.

4. Būdas pagal 2 arba 3 punktą, kuriame antrinis kuras papildomai apima anglies arba naftos, kuri sudaro mažiau nei 50 % bendrojo antrinio kuro tūrio.

5. Būdas pagal 1 punktą, kuriame antrinis kuras apima kietąjį kurą, pageidautina anglį.

6. Būdas pagal 5 punktą, kuriame antrinis kuras apima iki 100 % kietojo kuro, pageidautina tarp 70 ir 90 % kietojo kuro.

7. Būdas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame antrinės degimo dujos yra grynasis deguonis.

8. Būdas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame antrinis kuras ir antrinės degimo dujos yra įvedamos per bent du, pageidautina bent tris, degiklio įvadus (9) taip, kad iš karto po įleidimo į cirkuliacinę degimo kamerą (1), antrinis kuras dega formuodamas liepsną.

9. Būdas pagal 8 punktą, kuriame degiklio įvadai (9) yra patalpinti cirkuliacinės degimo kameros (1) apatinės sekcijos (3) apatinėje dalyje, geriau, kai greta pagrindo sekcijos (4).

10. Būdas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame antrinių degimo dujų ir antrinio kuro santykis yra toks, kad čia antrinių degimo dujų būtų nepakankamai įgalinti antrinį kurą patirti visišką sudegimą.

11. Būdas pagal bet kurį 1 – 9 punktą, kuriame antrinio kuro ir antrinių degimo dujų santykis yra toks, kad čia būtų daugiau negu pakankama antrinių degimo dujų, įgalinančių antrinį kurą patirti visišką sudegimą.

12. Būdas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame išleidimo anga (11) pagrindo sekcijoje yra sifonas.

13. Būdas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame pirminis kuras yra kietųjų dalelių anglinis kuras, pageidautina anglis.

14. Būdas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame pirminis kuras yra kietųjų dalelių anglingojo kuro, pageidautina anglies, ir vieno arba daugiau dujinio kuro, pasirinkto iš grupės, susidedančios iš propano, metano ir gamtinių dujų, mišinys.

15. Būdas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuriame pirminės degiosios dujos yra praturtintas deguonimi oras arba grynas deguonis.

16. Aparatas, naudojamas mineraliniams pluoštams gaminti pagal bet kurį ankstesnį punktą, apimantis cirkuliacinę degimo kamerą (1), apimančią iš esmės cilindrinę viršutinę sekciją (2), apatinę sekciją (3) ir pagrindo sekciją (4), kuriame cirkuliacinė degimo kamera (1) apima įleidimo angas (5, 6) viršutinėje sekcijoje pirminiam kurui, ypatingai, kietųjų dalelių mineralinei medžiagai ir pirminėms degiosioms dujoms,

išleidimo angą (8), skirtą išmetamosioms dujoms, išleidimo angą (11) pagrindo sekcijoje ir išcentrinį pluošto gamybos aparatą (12), kuriame išleidimo anga (11) pagrindo sekcijoje (14) veda į išcentrinį pluošto gamybos aparatą (12),

kur aparatas yra sukonstruotas tokiu būdu, kai pirminio kuro, įvesto su kietųjų dalelių mineraline medžiaga ir pirminėmis degimo dujomis per įleidimo angą (5, 6) degimas yra naudojamas lydyti kietųjų dalelių mineralinę medžiagą tam, kad formuotų mineralinį lydalą, mineralinis lydalas teka žemyn apatinės sekcijos (3) sienomis kaip plona plėvelė ir susirenka cirkuliacinės degimo kameros pagrindo sekcijoje (4);

b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad aparatas taip pat apima įleidimo angas (9, 10) apatinėje sekcijoje (3) antriniam kurui ir antrinėms degimo dujoms.

17. Aparatas pagal 16 punktą, kuriame cirkuliacinės degimo kameros (1) apatinė sekcija (3) yra nupjauto kūgio formos.

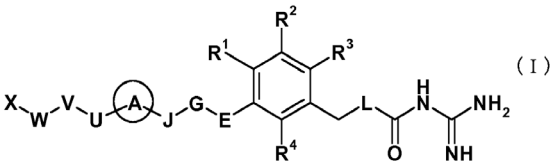
18. Aparatas pagal 16 arba 17 punktą, kuriame išleidimo anga (11) apatinėje sekcijoje yra sifonas.

---

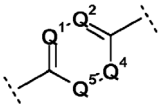
*(51)* Int.Cl. ***C07D 205/04*** (2006.01)
***A61K 31/426*** (2006.01)
***A61K 31/4402*** (2006.01)
***A61K 31/4545*** (2006.01)
***A61K 31/495*** (2006.01)
***A61K 31/496*** (2006.01)
***A61K 31/505*** (2006.01)
***A61K 31/506*** (2006.01)
***A61K 31/5377*** (2006.01)
***A61K 31/551*** (2006.01)
***A61P 1/02*** (2006.01)
***A61P 1/04*** (2006.01)
***A61P 1/16*** (2006.01)
***A61P 3/04*** (2006.01)
***A61P 3/10*** (2006.01)
***A61P 9/00*** (2006.01)
***A61P 9/10*** (2006.01)
***A61P 9/12*** (2006.01)
***A61P 11/00*** (2006.01)

*(11)* **2695881**

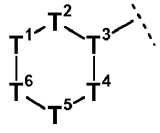
*(96)* 12758359.9
*(96)* 2012-03-13
*(97)* 2014-02-12
*(97)* 2016-04-27
*(86)* PCT/JP2012/056429
*(86)* 2012-03-13
*(87)* WO 2012/124696
*(87)* 2012-09-20
*(30)* 2011056031, 2011-03-15, JP
*(72)* YOSHIHARA, Kousei, JP
SUZUKI, Daisuke, JP
YAMAKI, Susumu, JP
YAMADA, Hiroyoshi, JP
MIHARA, Hisashi, JP
SEKI, Norio, JP
*(73)* Astellas Pharma Inc., Tokyo 103-8411, JP
*(74)* Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
*(54)* Guanidino junginys
Apibrėžties punktai: 17, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Junginys, pavaizduotas formule (I) arba jo druska:


(I)

kur A yra:



$Q^1$ yra N, $Q^2$ yra $CRQ^{22}$, $Q^4$ yra $CRQ^{42}$, $Q^5$ yra N,
$RQ^{22}$ ir $R^{Q42}$ yra H,
$R^1$, $R^2$, $R^3$ ir $R^4$ viena kitos atžvilgiu yra vienodos arba skirtingos ir yra H arba halogenas,
E yra vienguba jungtis,
G yra vienguba jungtis,
J yra vienguba jungtis,
L yra O arba NH,
U yra vienguba jungtis arba O,
V yra vienguba jungtis arba $C_1$-$C_6$ alkilenas, kuris gali būti pakeistas okso (=O),
W yra vienguba jungtis,
X yra:



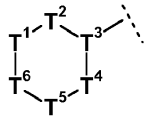
kur $T^1$ yra vienguba jungtis, $CR^{T11}R^{T12}$ arba $NR^{T13}$, $T^2$ yra $CR^{T21}R^{T22}$ arba $NR^{T23}$, $T^3$ yra $CR^{T31}$ arba N, $T^4$ yra $CR^{T41}R^{T42}$ arba $NR^{T43}$, $T^5$ yra vienguba jungtis, $(CR^{T51}R^{T52})_m$, arba $NR^{T53}$, $T^6$ yra $CR^{T61}R^{T62}$, > O arba $NR^{T63}$, $R^{T11}$, $R^{T12}$, $R^{T13}$, $R^{T21}$, $R^{T22}$, $R^{T23}$, $R^{T31}$, $R^{T41}$, $R^{T42}$, $R^{T43}$, $R^{T51}$, $R^{T52}$, $R^{T53}$, $R^{T61}$, $R^{T62}$ ir $R^{T63}$ viena kitos atžvilgiu yra vienodos arba skirtingos ir yra H, OH, halogenas, $C_{1-6}$ alkilas, kuris gali būti pakeistas, arilas, kuris gali būti pakeistas, cikloalkilas, kuris gali būti pakeistas, hetero žiedo grupė, kuri gali būti pakeista, O-($C_{1-6}$ alkilas, kuris gali būti pakeistas), NH($C_{1-6}$ alkilas, kuris

gali būti pakeistas), N($C_{1-6}$ alkilas, kuris gali būti pakeistas)$_2$, NH(arilas, kuris gali būti pakeistas), N(arilas, kuris gali būti pakeistas)$_2$, $SO_2$-($C_{1-6}$ alkilas, kuris gali būti pakeistas) arba $SO_2$-(cikloalkilas, kuris gali būti pakeistas), arba $R^{T11}$ ir $R^{T61}$, $R^{T11}$ ir

$R^{T63}$, $R^{T13}$ ir $R^{T61}$, $R^{T13}$ ir $R^{T63}$, $R^{T21}$ ir $R^{T31}$, $R^{T23}$ ir $R^{T31}$, $R^{T41}$ ir $R^{T51}$, $R^{T43}$ ir $R^{T51}$, $R^{T41}$ ir $R^{T53}$ arba $R^{T43}$ ir $R^{T53}$ gali būti susijungusios vien su kita, siekiant gauti naują jungtį, arba $R^{T11}$ ir $R^{T12}$, $R^{T21}$ ir $R^{T22}$, $R^{T41}$ ir $R^{T42}$, $R^{T51}$ ir $R^{T52}$ arba $R^{T61}$ ir $R^{T62}$ gali būti susijungusios vien su kita, siekiant gauti okso (=O), ir m yra 1 arba 2.

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

X yra:



$T^1$ yra vienguba jungtis, $CR^{T11}R^{T12}$ arba $NR^{T13}$, $T^2$ yra $CR^{T21}R^{T22}$, $T^3$ yra $CR^{T31}$ arba N, $T^4$ yra $CR^{T41}R^{T42}$, $T^5$ yra vienguba jungtis, $(CR^{T51}R^{T52})_m$ arba $NR^{T53}$, $T^6$ yra $CR^{T61}R^{T62}$, O arba $NR^{T63}$,

$R^{T21}$ ir $R^{T31}$ gali būti susijungusios vien su kita, siekiant gauti naują jungtį, arba $R^{T11}$ ir $R^{T12}$ gali būti susijungusios vien su kita, siekiant gauti okso (=O),

$R^{T11}$, $R^{T12}$ $R^{T21}$, $R^{T22}$, $R^{T31}$, $R^{T41}$, $R^{T42}$, $R^{T51}$ ir $R^{T52}$ viena kitos atžvilgiu yra vienodos arba skirtingos ir yra H, halogenas arba $C_{1-6}$ alkilas, kuris gali būti pakeistas,

$R^{T13}$ ir $R^{T53}$ yra H,

$R^{T61}$ yra H,

$R^{T62}$ yra OH, $C_{1-6}$ alkilas (kur $C_{1-6}$ alkilas gali būti pakeistas O-($C_{1-6}$ alkil) arba COOH),

arba O-($C_{1-6}$ alkilas, kuris gali būti pakeistas O-($C_{1-6}$ alkil)),

$R^{T63}$ yra CO-($C_{1-5}$ alkilas, kuris gali būti pakeistas O-($C_{1-6}$ alkil) arba azoto turinčiu monocikliniu nesočiu hetero žiedu(ais)), CO-(cikloalkil), CO-(aril), CO-( azoto turinčia monocikline nesočia hetero žiedo grupe), CON($C_{1-6}$ alkil)$_2$ arba $SO_2$-($C_{1-6}$ alkil) ir

m yra 1.

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

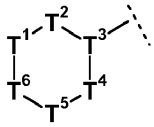
$R^1$, $R^2$, $R^3$ yra H ir $R^4$ yra halogenas,

U yra O,

V yra $C_{1-6}$ alkilenas, kuris gali būti pakeistas okso (=O).

4. Junginys arba jo druska pagal 3 punktą, kur:

X yra:



$T^1$ yra vienguba jungtis arba $CR^{T11}R^{T12}$, $T^2$ yra $CR^{T21}R^{T22}$, $T^3$ yra $CR^{T31}$ arba N, $T^4$ yra $CR^{T41}R^{T42}$, $T^5$ yra vienguba jungtis arba $(CR^{T51}R^{T52})_m$, $T^6$ yra $NR^{T63}$,

$R^{T11}$, $R^{T12}$, $R^{T21}$, $R^{T22}$, $R^{T31}$, $R^{T41}$, $R^{T42}$, $R^{T51}$ ir $R^{T52}$ yra H,

$R^{T63}$ yra CO-($C_{1-5}$ alkilas, kuris gali būti pakeistas O-($C_{1-6}$ alkil) arba azoto turinčiu monocikliniu nesočiu hetero žiedu(ais)), CO-(cikloalkil), CO-(aril), CO-( azoto turinčia monocikline nesočia hetero žiedo grupe), CON($C_{1-6}$ alkil)$_2$ arba $SO_2$-($C_{1-6}$ alkil) ir

m yra 1.

5. Junginys arba jo druska pagal 4 punktą, kur:

$T^1$ yra $CR^{T11}R^{T12}$, $T^2$ yra $CR^{T21}R^{T22}$, $T^3$ yra $CR^{T31}$, $T^4$ yra $CR^{T41}R^{T42}$, $T^5$ yra $(CR^{T51}R^{T52})_m$, $T^6$ yra $NR^{T63}$ ir

m yra 1.

6. Junginys arba jo druska pagal 5 punktą, kur L yra O.

7. Junginys arba jo druska pagal 6 punktą, kur:

$R^{T63}$ yra acetilas, propionilas, izobutirilas, pivalolilas, 2-etoksi-1-oksoetilas, 2-metoksi-1-oksoetilas, 3-metoksi-1-oksopropilas, 3-metoksi-2,2-dimetil-1-oksopropilas, ciklopropilkarbonilas, benzoilas, piridin-3-ilkarbonilas, dimetilaminokarbonilas, metilsulfonilas arba etilsulfonilas.

8. Junginys arba jo druska pagal 7 punktą, kur:
$R^{T63}$ yra acetilas, propionilas, izobutirilas, pivaloilas, 2-etoksi-1-oksoetilas, ciklopropilkarbonilas, benzoilas, piridin-3-ilkarbonilas, dimetilaminokarbonilas arba metilsulfonilas.

9. Junginys arba jo druska pagal 1 punktą, kur minėtas junginys yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:
1-karbamimidoil-3- {3-[2-(morfolin-4-il)pirimidin-5-il]benzil}karbamido,
2-fluor-3-[2-(morfolin-4-il)pirimidin-5-il]benzil-karbamimidoilkarbamato,
3-{2-[(3S)-3-fluorpirolidin-1-il]pirimidin-5-il}benzil-karbamimidoilkarbamato,
2-fluor-3-[2-(3-metoksiazetidin-1-il)pirimidin-5-il]benzil-karbamimidoilkarbamato,
3-(4-{4-[5-(3-{[(karbamimidoilkarbamoil)oksi]metil}-2-fluorfenil)pirimidin-2-il]piperazin-1-il}fenil)propano rūgšties,
3-{2-[(1-acetilpiperidin-4-il)metoksi]pirimidin-5-il}-2-fluorbenzil-karbamimidoilkarbamato,
3-(2-{[1-(ciklopropilkarbonil)piperidin-4-il]metoksi}pirimidin-5-il)-2-fluorbenzil-karbamimidoilkarbamato,
2-fluor-3-(2-{[1-(piridin-3-ilkarbonil)piperidin-4-il]metoksi}pirimidin-5-il)benzil-karbamimidoilkarbamato ir
1-(3-{2-[(1-acetilpiperidin-4-il)metoksi]pirimidin-5-il}-2-fluorbenzil)-3-karbamimidoilkarbamido,
arba jo druskos.

10. Junginys arba jo druska pagal 1 punktą, kur minėtas junginys yra 2-fluor-3-[2-(morfolin-4-il)pirimidin-5-Il]benzil-karbamimidoilkarbamatas arba jo druska.

11. Junginys arba jo druska pagal 1 punktą, kur minėtas junginys yra 2-fluor-3-[2-(3-metoksiazetidin-1-il)pirimidin-5-il] benzil-karbamimidoilkarbamatas arba jo druska.

12. Junginys arba jo druska pagal 1 punktą, kur minėtas junginys yra 3-{2-[(1-acetilpiperidin-4-il)metoksi]pirimidin-5-il}-2-fluorbenzil-karbamimidoilkarbamatas arba jo druska.

13. Junginys arba jo druska pagal 1 punktą, kur minėtas junginys yra 3-(2-{[1-(ciklopropilkarbonil)piperidin-4-il] metoksi}pirimidin-5-il)-2-fluorbenzil-karbamimidoilkarbamatas arba jo druska.

14. Junginys arba jo druska pagal 1 punktą, kur minėtas junginys yra 2-fluor-3-[2-(morfolin-4-il)pirimidin-5-il]benzil-karbamimidoilkarbamato monofosfatas.

15. Junginys arba jo druska pagal 1 punktą, kur minėtas junginys yra 3-{2-[(1-acetilpiperidin-4-il)metoksi]pirimidin-5-il}-2-fluorbenzil-karbamimidoilkarbamato monofosfatas.

16. Farmacinė kompozicija, apimanti junginį arba jo druską pagal 9 punktą ir farmaciniu požiūriu priimtiną užpildą.

17. Junginys arba jo druska pagal 9 punktą, skirti panaudoti diabetinės nefropatijos arba diabetinės makulos edemos prevencijai ir/arba gydymui.

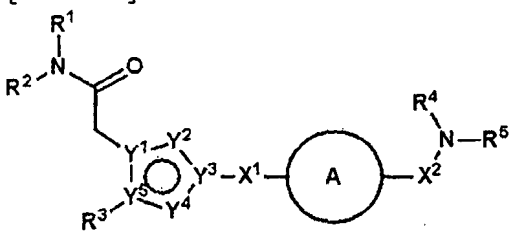
---

*(51)* Int.Cl. ***C07D 207/444*** (2006.01)
***A61K 31/4164*** (2006.01)
***A61K 31/4178*** (2006.01)
***A61K 31/4196*** (2006.01)
***A61K 31/4439*** (2006.01)
***A61K 31/444*** (2006.01)
***A61K 31/454*** (2006.01)
***A61K 31/4545*** (2006.01)
***A61K 31/46*** (2006.01)
***A61K 31/4725*** (2006.01)
***A61K 31/496*** (2006.01)

***A61K 31/537*** (2006.01)
***A61K 31/5377*** (2006.01)
***A61K 31/5386*** (2006.01)
***A61K 31/541*** (2006.01)
***A61K 31/553*** (2006.01)
***A61P 1/04*** (2006.01)
***A61P 9/10*** (2006.01)
***A61P 9/12*** (2006.01)
***A61P 17/14*** (2006.01)
***A61P 25/00*** (2006.01)

*(11)* **2772482**
*(96)* 12843663.1
*(96)* 2012-10-25
*(97)* 2014-09-03
*(97)* 2016-03-09
*(86)* PCT/JP2012/077541
*(86)* 2012-10-25
*(87)* WO 2013/062027
*(87)* 2013-05-02
*(30)* 2011236487, 2011-10-27, JP
*(72)* YOSHINAGA, Mitsukane, JP
KUWADA, Takeshi, JP
MIYAKOSHI, Naoki, JP
ISHIZAKA, Tomoko, JP
WAKASUGI, Daisuke, JP
SHIROKAWA, Shin-ichi, JP
HATTORI, Nobutaka, JP
SHIMAZAKI, Youichi, JP
*(73)* Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., Tokyo 170-8633, JP
*(74)* Liudmila GERASIMOVIČ, 9, Į „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius, LT
*(54)* Azolo darinys
Apibrėžties punktai: 12, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Azolo darinys, kurio formulė (I):

[Chem. 1]



(I)

[kur formulėje (I):

$R^1$ žymi vandenilio atomą, $C_{1-5}$-alkilą (kur $C_{1-5}$-alkilas nebūtinai turi nuo vieno iki trijų pakaitų, pasirinktų iš grupės, susidedančios iš hidroksi, halogeno atomų, ciano, $C_{3-7}$-cikloalkilo ir $C_{1-5}$-alkoksi), $C_{3-7}$-cikloalkilą, arba 4-8 narių prisotintą heterociklą;

$R^2$ žymi vandenilio atomą arba $C_{1-5}$-alkilą;

$R^3$ žymi arilą arba heteroarilą (kur arilas ir heteroarilas nebūtinai turi vieną arba du pakaitus, pasirinktus iš grupės, susidedančios iš $C_{1-5}$-alkoksi, $C_{1-5}$-alkilo, halogeno atomų, trifluormetilo, trifluormetoksi, ciano, hidroksi, difluormetoksi ir $C_{1-5}$- -alkilsulfonilo);

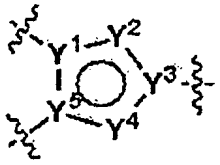
$R^4$ ir $R^5$, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, kiekvienas žymi vandenilio atomą, $C_{1-5}$-alkilą (kur $C_{1-5}$-alkilas nebūtinai turi nuo vieno iki trijų pakaitų, pasirinktų iš grupės, susidedančios iš hidroksi, halogeno atomų, ciano, $C_{3-7}$-cikloalkilo

ir $C_{1-5}$-alkoksi), $C_{3-7}$-cikloalkilą arba 4-8 narių prisotintą arba neprisotintą heterociklą, turintį vieną arba kelis azoto, deguonies arba sieros atomus žiede (kur 4-8 narių prisotintas arba neprisotintas heterociklas nebūtinai turi vieną arba du pakaitus, pasirinktus iš grupės, susidedančios iš hidroksi, $C_{1-5}$ -alkilo, $C_{1-5}$-alkoksi, halogeno atomų, ciano, $C_{2-5}$-alkanoilo ir trifluormetilo),

arba $R^4$ ir $R^5$, kartu su juos jungiančiu azoto atomu, sudaro 4-8 narių prisotintą arba neprisotintą heterociklą, nebūtinai turintį vieną arba kelis azoto, deguonies arba sieros atomus žiede, papildomai prie juos jungiančio azoto atomo (kur 4-8 narių prisotintas arba neprisotintas heterociklas nebūtinai turi vieną arba du pakaitus, pasirinktus iš grupės, susidedančios iš hidroksi, $C_{1-5}$-alkilo (kur $C_{1-5}$-alkilas nebūtinai turi vieną arba du hidroksilo pakaitus), $C_{1-5}$-alkoksi, halogeno atomų, ciano, $C_{2-5}$-alkanoilo, okso, aminokarbonilo, mono-$C_{1-5}$-alkilaminokarbonilo, di-$C_{1-5}$-alkilaminokarbonilo, trifluormetilo, amino, mono-$C_{1-5}$-alkilamino, di-$C_{1-5}$- alkilamino ir $C_{2-5}$-alkanoilamino, ir 4-8 narių prisotintas arba neprisotintas heterociklas nebūtinai turi $C_{1-5}$-alkileno grupę, jungiančią skersiniu ryšiu du skirtingus anglies atomus žiede) arba sudaro 2-oksa-6-azaspiro[3.3]hept-6-ilą arba 7-oksa-2-azaspiro[3.5]non-2-ilą;

nebūtinai turintis pakaitų azolo žiedas, kuris atvaizduotas tokia formulę (α):

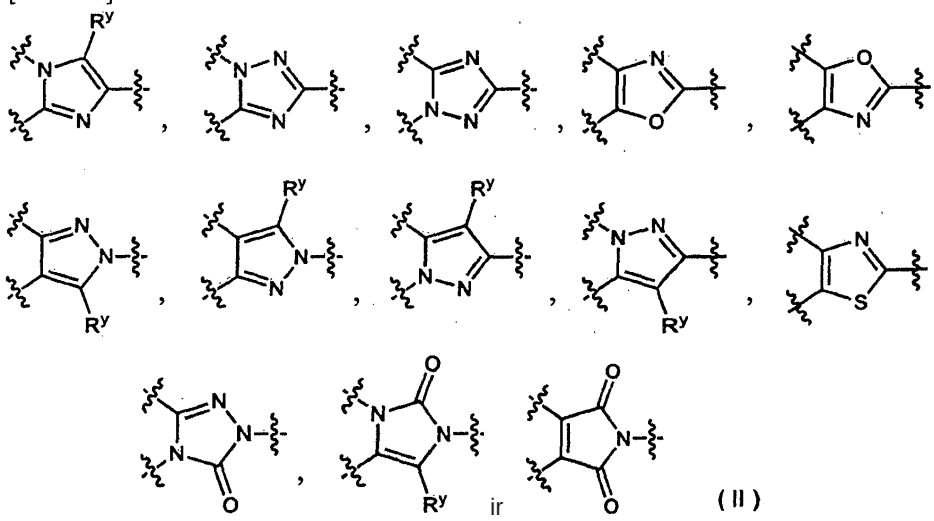
[Chem. 2]



(α)

turi bet kurią struktūrą iš toliau pateiktos formulių grupės (II):

[Chem. 3]



(II)

kur

$R^y$ žymi vandenilio atomą arba $C_{1-5}$-alkilą;

$X^1$ ir $X^2$ yra tokie, kad

i) kai $X^1$ yra vienguba jungtis arba turi formulę -CO-, tai $X^2$ žymi -$C_{1-5}$-alkileną- arba -O-$C_{1-5}$-alkileną-; ir

ii) kai $X^1$ turi formulę -CONR$^{x1}$-, tai X2 žymi viengubą jungtį;

$R^{x1}$ žymi vandenilio atomą arba $C_{1-5}$-alkilą; ir

A žiedas žymi benzeno žiedą, 6 narių aromatinį heterociklą (kur benzeno žiedas ir 6 narių aromatinis heterociklas nebūtinai turi vieną arba du pakaitus, pasirinktus iš grupės, susidedančios iš halogeno atomų ir $C_{1-5}$-alkoksi), 4-8 narių prisotintą arba iš dalies neprisotintą heterociklą, turinti vieną arba du azoto atomus (kur 4-8 narių prisotintas arba neprisotintas heterociklas nebūtinai turi vieną okso pakaitą) arba

$C_{3-7}$-cikloalkaną],

arba farmaciniu požiūriu priimtina azolo darinio druska.

2. Azolo darinys arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska pagal 1 punktą, kur aukščiau nurodytoje formulėje (I)

$R^4$ ir $R^5$, kurie gali būti vienodi arba skirtingi, kiekvienas žymi vandenilio atomą, $C_{1-5}$-alkilą (kur $C_{1-5}$-alkilas nebūtinai turi nuo vieno iki trijų pakaitų, pasirinktų iš grupės, susidedančios iš hidroksi, halogeno atomų, ciano, $C_{3-7}$-cikloalkilo ir $C_{1-5}$-alkoksi), $C_{3-7}$-cikloalkilą arba 4-8 narių prisotintą arba neprisotintą heterociklą, turintį vieną arba kelis azoto, deguonies arba sieros atomus žiede (kur 4-8 narių prisotintas arba neprisotintas heterociklas nebūtinai turi vieną arba du pakaitus, pasirinktus iš grupės, susidedančios iš hidroksi, $C_{1-5}$-alkilo, $C_{1-5}$-alkoksi, halogeno atomų, ciano, $C_{2-5}$-alkanoilo ir trifluormetilo), arba

$R^4$ ir $R^5$, kartu su juos jungiančiu azoto atomu, sudaro 4-8 narių prisotintą arba neprisotintą heterociklą, nebūtinai turintį vieną arba kelis azoto, deguonies arba sieros atomus žiede papildomai prie juos jungiančio azoto atomo (kur 4-8 narių prisotintas arba neprisotintas heterociklas nebūtinai turi vieną arba du pakaitus, pasirinktus iš grupės, susidedančios iš hidroksi, $C_{1-5}$-alkilo (kur $C_{1-5}$-alkilas nebūtinai turi vieną arba du hidroksilo pakaitus), $C_{1-5}$-alkoksi, halogeno atomų, ciano, $C_{2-5}$- alkanoilo, okso, aminokarbonilo, mono-$C_{1-5}$-alkilaminokarbonilo, di-$C_{1-5}$-alkilaminokarbonilo ir trifluormetilo, ir 4-8 narių prisotintas arba neprisotintas heterociklas nebūtinai turi $C_{1-5}$-alkileno grupę, jungiančią skersiniu ryšiu du skirtingus anglies atomus žiede), arba sudaro 2-oksa-6-azaspiro[3.3]hept-6-ilą arba 7-oksa-2-azaspiro[3.5]non-2-ilą.

3. Azolo darinys arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska pagal 1 arba 2 punktą, kur aukščiau nurodytoje formulėje (I)

$X^1$ žymi viengubą jungtį;

$X^2$ žymi -$C_{1-5}$-alkileną- arba -O-$C_{1-5}$-alkileną-; ir

A žiedas žymi benzeno žiedą, 6 narių aromatinį heterociklą (kur benzeno žiedas ir 6 narių aromatinis heterociklas nebūtinai turi vieną arba du pakaitus, pasirinktus iš grupės, susidedančios iš halogeno atomų ir $C_{1-5}$-alkoksi), arba 4-8 narių prisotintą arba neprisotintą heterociklą, turintį vieną arba du azoto atomus (kur 4-8 narių prisotintas arba neprisotintas heterociklas nebūtinai turi vieną okso pakaitą).

4. Azolo darinys arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska pagal bet kurį vieną iš 1 – 3 punktų, kur aukščiau nurodytoje formulėje (I)

A žiedas žymi benzeno žiedą arba 6 narių aromatinį heterociklą (kur benzeno žiedas ir 6 narių aromatinis heterociklas nebūtinai turi vieną arba du pakaitus, pasirinktus iš grupės, susidedančios iš halogeno atomų ir $C_{1-5}$-alkoksi).

5. Azolo darinys arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska pagal bet kurį vieną iš 1-4 punktų, kur aukščiau nurodytoje formulėje (I)

A žiedas žymi benzeno žiedą arba piridino žiedą (kur benzeno žiedas ir piridino žiedas nebūtinai turi vieną arba du pakaitus, pasirinktus iš grupės, susidedančios iš halogeno atomų ir $C_{1-5}$-alkoksi).

6. Azolo darinys arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska pagal bet kurį vieną iš 1 – 5 punktų, kur aukščiau nurodytoje formulėje (I)

$R^1$ yra $C_{1-5}$-alkilas;

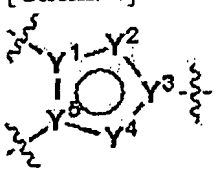
$R^2$ yra vandenilio atomas; ir

$R^3$ yra fenilas arba piridilas (kur fenilas ir piridilas nebūtinai turi vieną arba du pakaitus, pasirinktus iš grupės, susidedančios iš $C_{1-5}$-alkilo, $C_{1-5}$-alkoksi, halogeno atomų, ciano, trifluormetilo, difluormetoksi, trifluormetoksi ir $C_{1-5}$-alkilsulfonilo).

7. Azolo darinys arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska pagal bet kurį vieną iš 1 – 6 punktų, kur aukščiau nurodytoje formulėje (I)

nebūtinai turintis pakaitų azolo žiedas, kuris atvaizduotas tokia formule (α):

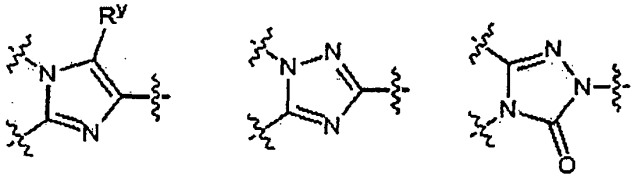
[Chem. 4]




(α)

turi bet kurią struktūrą iš toliau pateiktos formulių grupės (III):

[Chem. 5]



(III)

kur

$R^y$ žymi vandenilio atomą arba metilo grupę.

8. Azolo darinys arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska pagal bet kurį vieną iš 1 – 7 punktų, kur aukščiau nurodytoje formulėje (I)

$X^1$ yra vienguba jungtis;

$X^2$ yra etilenas arba metiletilenas; ir

$R^4$ ir $R^5$, kartu su juos jungiančiu azoto atomu, sudaro 4-8 narių prisotintą arba neprisotintą heterociklą, nebūtinai turintį vieną arba kelis azoto, deguonies arba sieros atomus žiede papildomai prie juos jungiančio azoto atomo (kur 4-8 narių prisotintas arba neprisotintas heterociklas nebūtinai turi vieną arba du pakaitus, pasirinktus iš grupės, susidedančios iš hidroksi, $C_{1-5}$-alkilo (kur $C_{1-5}$-alkilas nebūtinai turi vieną arba du hidroksilo pakaitus), $C_{1-5}$-alkoksi, halogeno atomų, ciano, $C_{2-5}$- alkanoilo ir trifluormetilo, ir 4- 8 narių prisotintas arba neprisotintas heterociklas nebūtinai turi $C_{1-5}$-alkileno grupę, jungiančią skersiniu ryšiu du skirtingus anglies atomus žiede) arba sudaro 2-oksa-6-azaspiro[3.3]hept-6-ilą.

9. Azolo darinys arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska pagal bet kurį vieną iš 1 – 8 punktų, kur aukščiau nurodytoje formulėje (I)

$R^4$ ir $R^5$, kartu su juos jungiančiu azoto atomu, sudaro 5 arba 6 narių prisotintą heterociklą, nebūtinai turintį vieną arba kelis deguonies atomus žiede papildomai prie juos jungiančio azoto atomo (kur 6 narių prisotintas heterociklas nebūtinai turi vieną arba du pakaitus, pasirinktus iš grupės, susidedančios iš hidroksilo ir $C_{1-5}$-alkilo, ir šis 6 narių prisotintas heterociklas nebūtinai turi $C_{1-5}$-alkileno grupę, jungiančią skersiniu ryšiu du skirtingus anglies atomus žiede) arba sudaro 2-oksa-6-azaspiro[3.3]hept-6-ilą.

10. Azolo darinys arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska pagal 1 punktą, kur azolo darinys, atvaizduotas formule (I) yra pasirinktus iš grupės, susidedančios iš:

2-[2-(3-chlorfenil)-4-{4-[2-(piperidin-1-il)etil]fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(3-chlorfenil)-4-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-1H=imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(3-chlorfenil)-4-(4-{2-[3-(hidroksimetil)pirolidin-1-il]etil}fenil)-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(3-chlorfenil)-4-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(4-fluor-3-metoksifenil)-4-{4-[2-(piperidin-1-il)etil]fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(4-fluor-3-metoksifenil)-4-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(4-fluor-3-metoksifenil)-4-{4-(2-(pirolidin-1-il)etil]fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(4-fluor-3-metoksifenil)-4-(4-{2-[(2R)-2-metilpirolidin-1-il]etil}fenil)-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(4-fluor-3-metoksifenil)-4-{4-[2-(3-hidroksi-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il) acetamido;

2-[2-(4-fluor-3-metoksifenil)-4-{4-[2-(3-metoksipiperidin-1-il)etil]fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[4-{4-[2-(2,6-dimetilmorfolin-4-il)etil]fenil}-2-(4-fluor-3-metoksifenil)-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(4-fluor-3-metoksifenil)-4-{4-[2-(3-metilpirolidin-1-il)etil]fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(4-fluor-3-metoksifenil)-4-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-1 H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il) acetamido;

2-[2-(4-fluor-3-metoksifenil)-4-{4-[2-(1,4-oksazepan-4-il)etil]fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[4-{4-[2-(3,5-dimetilmorfolin-4-il)etil]fenil}-2-(4-fluor-3-metoksifenil)-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(3-chlorfenil)-4-{5-[2-(morfolin-4-il)etil]piridin-2-il}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(3-chlorfenil)-4-{5-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]piridin-2-il}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(3-chlorfenil)-4-{6-[2-(morfolin-4-il)etil]piridin-3-il}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(3-metoksifenil)-5-metil-4-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(3-metoksifenil)-4-{4-[2-(morfolin-4-il)etil)fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-(2-(3-chloro-4-fluorfenil)-4-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(3-metoksifenil)-4-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(3-chlorfenil)-4-{2-fluor-4-[2-(morfolin-4-il)etil)fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[2-(3-chlorfenil)-4-{4-[2-(morfolin-4-il)propil]fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[5-(3-chlorfenil)-3-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-1H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[5-(3-chlorfenil)-3-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-1H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[5-(3-chlorfenil)-3-{5-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]piridin-2-il}-1H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il) acetamido;

2-[5-(3-metoksifenil)-3-{5-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]piridin-2-il}-1H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il) acetamido;

2-[5-(4-fluor-3-metoksifenil)-3-{5-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]piridin-2-il}-1H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

N-tret-butil-2-[5-(3-metoksifenil)-3-{5-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]piridin-2-il}-1H-1,2,4-triazol-1-il] acetamido;

2-[5-(3-chlor-4-fluorfenil)-3-{5-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]piridin-2-il} -1H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il) acetamido;

N-tret-butil-2-[5-(3-chlorfenil)-3-{5-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]piridin-2-il}-1H-1,2,4-triazol-1-il]acetamido;

2-[5-(3-chlorfenil)-3-{5-[2-(morfolin-4-il)etil]piridin-2-il}-1H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

N-tret-butil-2-[5-(3-chlorfenil)-3-{5-[2-(morfolin-4-il)etil]piridin-2-il}-1H-1,2,4-triazol-1-il]acetamido;

2-[5-(3-chlor-4-fluorfenil)-3-{5-[2-(morfolin-4-il)etil]piridin-2-il}-1 H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[5-(4-fluor-3-metoksifenil)-3-{5-[2-(morfolin-4-il)etil]piridin-2-il}-1H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

N-tret-butil-2-[5-(3-metoksifenil)-3-{5-[2-(morfolin-4-il)etil]piridin-2-il}-1H-1,2,4-triazol-1-il]acetamido;

2-[5-(3-metoksifenil)-3-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-1H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[5-(3-metoksifenil)-3-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-1H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[3-(2-fluor-4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-5-(3-metoksifenil)-1H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[3-{3-fluor-4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-5-(3-metoksifenil)-1H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[5-(3-metoksifenil)-3-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)propil]fenil}-1H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il) acetamido;

2-[5-(3-metoksifenil)-3-{4-[2-(7-oksa-2-azaspiro[3.5]non-2-il)etil]fenil}-1H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[5-(3-metoksifenil)-3-{4-[2-(2-oksa-6-azaspiro[3.3]hept-6-il)etil]fenil}-1H-1,2,4-triazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[1-(3-chlorfenil)-3-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-1H-1,2,4-triazol-5-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[1-(3-chlorfenil)-3-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-1H-1,2,4-triazol-5-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[5-(3-chlorfenil)-3-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-2-okso-2,3-dihidro-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[4-(3-chlorfenil)-2-{4-[2-(piperidin-1-il)etil]fenil}-1,3-oksazol-5-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[4-(3-chlorfenil)-2- {4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-1,3-oksazol-5-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[4-(3-chlorfenil)-2-{4-[2-(2-oksa-6-azaspiro[3.3]hept-6-il)etil]fenil}-1,3-oksazol-5-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[5-(3-chlorfenil)-2-{4-[2-(piperidin-1-il)etil]fenil}-1,3-tiazol-4-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[5-(3-chlorfenil)-2-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-1,3-tiazol-4-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[3-(3-chlorfenil)-1-{4-[2-(piperidin-1-il)etil]fenil}-1H-pirazol-4-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[3-(3-chlorfenil)-1-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-1H-pirazol-4-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[5-(3-chlorfenil)-3-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-1H-pirazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[4-(3-chlorfenil])-1-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-2,5-diokso-2,5-dihidro-1H-pirol-3-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[4-(3-chlorfenil)-1-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[4-(3-chlorfenil)-1-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

N-tret-butil-2-[4-(4-fluor-3-metoksifenil)-1-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il] acetamido;

N-tret-butil-2-[4-(3-metoksifenil)-1-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]acetamido;

N-tret-butil-2-[4-(3-metoksifenil)-1-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]acetamido;

N-tret-butil-2-[4-(4-fluor-3-metoksifenil)-1-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]acetamido;

N-tret-butil-2-[4-(4-fluor-3-metoksifenil)-1-{5-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]piridin-2-il}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]acetamido;

N-tret-butil-2-[4-(3-chlorfenil)-1-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]acetamido;

N-tret-butil-2-[4-(3-chlorfenil)-1-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]acetamido;

2-[4-(3-chlorfenil)-1-{4-[2-(morfolin-4-il)propil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[4-(3-chlorfenil)-1-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)propil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-

(propan-2-il)acetamido;

2-[4-(3-chlorfenil)-1-{3-fluor-4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il) acetamido;

2-[4-(3-chlorfenil)-1-{3-fluor-4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[4-(3-chlorfenil)-1-{3-metoksi-4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il) acetamido;

2-[4-(3-chlorfenil)-1-{3-metoksi-4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[4-(3-chlor-4-fluorfenil)-1-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il) acetamido;

2-[4-(3-chlor-4-fluorfenil)-1-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

N-tret-butil-2-[4-(3-chlor-4-fluorfenil)-1-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]acetamido;

N-tret-butil-2-[4-(3-chlor-4-fluorfenil)-1-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]acetamido;

N-tret-butil-2-[4-(3-chlor-4-fluorfenil)-1-{5-[2-(morfolin-4-il)etil]piridin-2-il}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il] acetamido;

N-tret-butil-2-[4-(3-chlor-4-fluorfenil)-1-{5-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]piridin-2-il}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]acetamido;

2-[4-(3-chlorfenil)-1-{5-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)propil]piridin-2-il}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-(1-{4-[2-(morfolin-4-il)etil]fenil}-5-okso-4-[3-(trifluormetil)fenil]-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)-N-(propan-2-il) acetamido;

2-[4-(3-chlor-4-fluorfenil)-1-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)propil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[4-(4-fluor-3-metoksifenil)-1-{4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil)-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[4-(4-fluor-3-metoksifenil)-1-{3-metoksi-4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[1-{3-metoksi-4-[2-(3-oksa-8-azabiciklo[3.2.1]okt-8-il)etil]fenil}-4-(3-metoksifenil)-5-okso-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il)acetamido;

2-[4-(3-chlor-4-fluorfenil)-5-okso-1-{4-[2-(pirolidin-1-il)etil]fenil}-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il) acetamido;

2-[4-(3-chlor-4-fluorfenil)-5-okso-1-{4-[2-(piperidin-1-il)etil]fenil}-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-3-il]-N-(propan-2-il) acetamido; ir

2-[2-(3-chlorfenil)-4-{4-[2-(2-oksa-6-azaspiro[3.3]hept-6-il)etil]fenil}-1H-imidazol-1-il]-N-(propan-2-il)acetamido.

11. Farmacinė kompozicija, apimanti kaip veikliąjį ingredientą azolo darinį arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską pagal bet kurį vieną iš 1-10 punktų.

12. Agentas, kaip veikliąjį ingredientą apimantis azolo darinį arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską pagal bet kurį vieną iš 1-10 punktų, skirtas naudoti nuotaikos sutrikimo, nerimo, šizofrenijos, Alzheimerio ligos, Parkinsono ligos, Huntingtono chorėjos, maitinimosi sutrikimų, hipertenzijos, skrandžio ir žarnyno ligos, priklausomybės nuo vaistų, epilepsijos, cerebrinio infarkto, smegenų išemijos, cerebrinės edemos, galvos traumos, uždegimo, su imunitetu susijusios ligos ar alopecijos gydymui arba profilaktikai.

---

*(51)* Int.Cl. ***C07D 209/10*** (2006.01)
***C07D 209/14*** (2006.01)
***C07D 209/16*** (2006.01)

*(11)* **2516394**

*(96)* 10803222.8

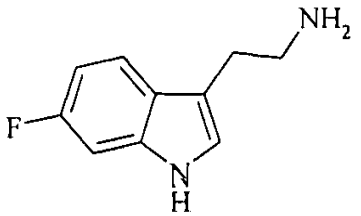
*(96)* 2010-12-20

*(97)* 2012-10-31

*(97)* 2016-03-16

*(86)* PCT/DK2010/050348

*(86)* 2010-12-20
*(87)* WO 2011/076212
*(87)* 2011-06-30
*(30)* 289530 P, 2009-12-23, US
*(72)* THERKELSEN, Frans, DK
ROCK, Michael, Harold, DK
TREPPENDAHL, Svend, DK
*(73)* H. Lundbeck A/S, 2500 Valby, DK
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Farmaciniu požiūriu aktyvaus agento gamybos procesas
Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Junginio, kurio formulė IV paruošimo procesas,




Formulė IV

apimantis šiuos žingsnius:
(a) (6-fluor-1H-indol-3-il) acetonitrilo ir $NH_3$ sumaišymas vandenyje, ir pereinamojo metalo katalizatoriaus maišymas alkoholiniame tirpiklyje; ir
(b) mišinio hidrinimas su $H_2$.

2. Procesas pagal 1 punktą, kur pereinamasis metalo katalizatorius yra RaNi.

3. Procesas pagal 1 punktą, kur alkoholinis tirpiklis yra metanolis.

4. Procesas pagal bet kurį iš 1 - 3 punktų, kur hidrinimas yra atliekamas 16 valandų, 250000 Paskalių (2,5 barai) slėgyje.

5. Procesas pagal bet kurį iš 1 - 4 punktų, kur hidrinimas yra atliekamas esant 55°C - 65°C temperatūrai.

6. Procesas pagal 2 punktą, kur naudojamas RaNi yra kempininis metalo katalizatorius.

7. Procesas pagal 2 arba 6 punktą, kur nominali RaNi aliuminio kompozicija yra 5 % ir vidutinis RaNi dalelės dydis yra 33 mikronai.

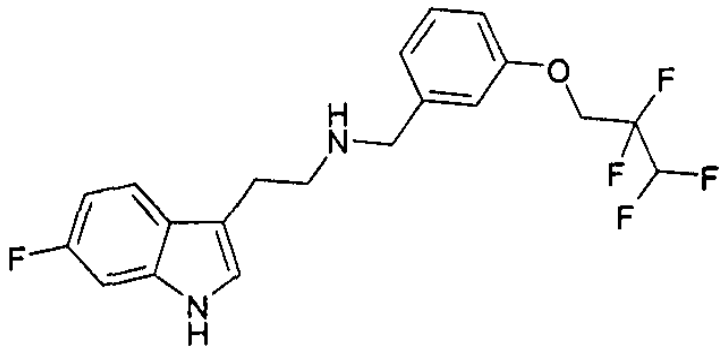
8. Procesas pagal bet kurį iš 1 - 7 punktų, kur $NH_3$ koncentracija vandeniniame tirpale yra 25 %.

9. Procesas pagal bet kurį ankstesnį punktą, papildomai apimantis IV formulės junginio gryninimą, kai gryninimas apima:
(a) IV formulės junginio tirpinimą alkoholiniame tirpiklyje;
(b) L(+)–tartaro rūgšties įdėjimą; ir
(c) tartaro rūgšties druskos nuosėdų fiksavimą.

10. Procesas pagal 9 punktą, kur alkoholinis tirpiklis yra metanolis.

11. Procesas pagal 9 arba 10 punktą, kur etilo acetatas yra naudojamas kartu su alkoholiniu tirpikliu.

12. Procesas pagal bet kurį ankstesnį punktą, papildomai apimantis IV formulės junginio reakciją, siekiant gauti formulės I junginį, sujungiant aminą su 3-(2,2,3,3-tetrafluorpropoksi)benzaldehidu tirpiklyje, o po to redukuojant imino ryšį su reduktoriumi



Formulė I

13. Procesas pagal 12 punktą, kur reduktorius yra natrio borohidridas.

14. Procesas pagal 12 arba 13 punktą, papildomai apimantis I formulės junginio konversiją į HCl druską, pridedant HCl, po to pasirinktinai gryninant gautą druską.

---

*(51)* Int.Cl. ***C07D 217/26*** (2006.01)
*(11)* **2595960**
*(96)* 11740973.0
*(96)* 2011-07-21
*(97)* 2013-05-29
*(97)* 2016-02-24
*(86)* PCT/GB2011/001096
*(86)* 2011-07-21
*(87)* WO 2012/010843
*(87)* 2012-01-26
*(30)* 366367 P, 2010-07-21, US
*(72)* MCCARTHY, Thomas, David, AU
KELLY, Peter, Michael, NZ
BOYLE, Craig, James, Stewart, GB
EBERLIN, Alexander, Redvers, GB
*(73)* Novartis AG, 4056 Basel, CH
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Tetrahidroizochinolino darinio druska ir solvatai
Apibrėžties punktai: 18, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. (*S*)-2-(difenilacetil)-1,2,3,4-tetrahidro-6-metoksi-5-(fenilmetoksi)-3-izochinolino karboksirūgšties natrio druska ir jos solvatai, amorfiniame pavidale arba kristalinio solvato pavidale.

2. Natrio druska pagal 1 punktą, kur solvatas yra etanolio solvatas, izo-propanolio solvatas, arba hidratas, turintis nuo 2 iki 5 molekulių vandens.

3. Natrio druska pagal 2 punktą, kur solvatas yra etanolio arba izo-propanolio solvatas.

4. Natrio druska pagal 2 punktą, kur solvatas yra hidratas, turintis 2 molekules vandens.

5. Natrio druska pagal 2 punktą, kuriame solvatas yra hidratas, turintis nuo 3 iki 5 molekulių vandens.

6. Natrio druskos hidratas pagal 4 punktą, kuriame minėtas kristalinis solvatas turi Rentgeno spinduliuotės miltelių difrakcijos spektrą, apimantį smailę prie 19,3 laipsnių 2θ ± 0.1 2θ laipsnių ir, pasirinktinai, dar turi smailę ties 18,2 laipsnių 2θ ± 0,1 2θ laipsnių, ir pasirinktinai, kur minėtas kristalinis solvatas turi kietos būsenos $^{13}$C BMR spektrą, apimantį smailes ties 55,7, 128,2 ir 151,3 ppm ± 0.2 ppm.

7. Natrio druskos hidratas pagal 5 punktą, kuriame minėtas kristalinis solvatas turi Rentgeno spinduliuotės miltelių difrakcijos spektrą, apimantį smailę prie 15,2 laipsnių 2θ ± 0,1 2θ laipsnių ir, pasirinktinai, dar apima mažiausiai dvi smailes, parinktas iš grupės, susidedančios iš 4,8, 7,3, 12,0, 12,6, 23,5, ir 24,5 laipsnių 2θ ± 0.1 2θ laipsnių, ir pasirinktinai, kur minėtas kristalinis solvatas turi kietos būsenos $^{13}$C BMR spektrą, apimantį smailes ties 53,7, 122,9 ir 128,1 ppm ± 0,2 ppm.

8. Etanolio solvatas pagal 3 punktą, kur minėtas kristalinis solvatas rodo Rentgeno spinduliuotės miltelių difrakcijos vaizdą, apimantį smailę prie 14,3 laipsnių 2θ ± 0,1 2θ laipsnių, arba turi Rentgeno spinduliuotės miltelių difrakcijos spektrą, apimantį smailę ties 14.7 laipsnių 2θ ± 0.1 2θ laipsnių, arba turi Rentgeno spinduliuotės miltelių difrakcijos spektrą, apimantį mažiausiai dvi smailes, parinktas iš grupės, susidedančios iš 14,3, 14,7, 26,9 ir 29,7 laipsnių 2θ ± 0,1 2θ laipsnių, ir pasirinktinai, kur minėtas kristalinis solvatas turi kietos būsenos $^{13}$C BMR spektrą, apimantį smailes ties 18,4, 139,7, ir 141,4 ppm ± 0,2 ppm.

9. *iz*o-Propanolio solvatas pagal 3 punktą, kuriame minėtas kristalinis solvatas turi Rentgeno spinduliuotės miltelių difrakcijos spektrą, apimantį mažiausiai vieną smailę, parinktą iš grupės, susidedančios iš 20,6, 26,6, 27,2, 28,3, ir 29,3 laipsnių 2θ ± 0,1 2θ laipsnių ir pasirinktinai dar apima mažiausiai dvi smailes, parinktas iš grupės, susidedančios iš 25,0, 26,0, 26,6, 27,2, 28,3, ir 29.3 laipsnių 2θ ± 0,1 2θ laipsnių arba dar apima mažiausiai vieną smailę, parinktą iš grupės, susidedančios iš 10,8, 14,0, 21,1, 21,9, ir 22,5 laipsnių 2θ ± 0,1 2θ laipsnių, ir pasirinktinai, kur minėtas kristalinis solvatas turi kietos būsenos $^{13}$C BMR spektrą, apimantį smailes ties 63,1 ir 140,7 ppm ± 0,2 ppm.

10. Farmacinė kompozicija, apimanti (*S*)-2-(difenilacetil)-1,2,3,4-tetrahidro-6-metoksi-5-(fenilmetoksi)-3-izochinolino karboksirūgšties natrio druską arba natrio druskos solvatą kartu su farmaciniu požiūriu priimtinu nešikliu, skiedikliu arba pagalbine medžiaga, kur (*S*)-2-(difenilacetil)-1,2,3,4-tetrahidro-6-metoksi-5-(fenilmetoksi)-3-izochinolino karboksirūgšties natrio druska yra amorfiniame pavidale arba kristalinio solvato pavidale.

11. Farmacinė kompozicija pagal 10 punktą, sukomponuota vartojimui per burną.

12. (*S*)-2-(difenilacetil)-1,2,3,4-tetrahidro-6-metoksi-5-(fenilmetoksi)-3-izochinolino karboksirūgšties natrio druskos arba jos solvato gavimo būdas, apimantis:

i) (*S*)-2-(difenilacetil)-1,2,3,4-tetrahidro-6-metoksi-5-(fenilmetoksi)-3-izochinolino karboksirūgšties paveikimą natrio alkoksidu;

ii) kristalinio alkoholio solvato formavimą iš i) pakopoje susidariusios natrio druskos; ir

iii) solvato perkristalinimą.

13. Būdas pagal 12 punktą, kuriame kristalinis alkoholio solvatas yra etanolio solvatas, izo-propanolio solvatas, arba hidratas, turintis nuo 2 iki 5 molekulių vandens.

14. Būdas pagal 12 punktą, kur kristalinio alkoholio solvato molekulė, suformuota ii) pakopoje, yra pakeičiama į kitą solvato molekulę prieš, tuo metu arba po pakopos iii), ypatingai, kai suformuotas solvatas yra hidratas.

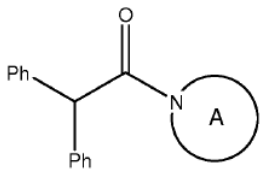
15. Būdas pagal bet kurį iš 12 punktą arba 14 punktą, kur solvatas, perkristalintas iii) pakopoje, yra izo-propanolio solvatas.

16. Būdas pagal bet kurį iš 12-15 punktą, dar apimantis solvato džiovinimo pakopą.

17. Būdas pagal bet kurį iš 12-15 punktą, dar apimantis natrio druskos parūgštinimą, kad sudarytų (*S*)-2-(difenilacetil)-1,2,3,4-tetrahidro-6-metoksi-5-(fenilmetoksi)-3-izochinolino karboksirūgštį iš esmės gryname pavidale, kur iš esmės grynas pavidalas reiškia produktą, turintį daugiau negu 96 % cheminio grynumo ir(arba) daugiau negu 97 % paklaidos ribose.

18. (*S*)-2-(difenilacetil)-1,2,3,4-tetrahidro-6-metoksi-5-(fenilmetoksi)-3-izochinolino karboksirūgšties natrio druskos alkoholio solvato gavimo būdas, apimantis šias pakopas:

i) (*S*)-2-(difenilacetil)-1,2,3,4-tetrahidro-6-metoksi-5-(fenilmetoksi)-3-izochinolino karboksirūgšties azoto atomo acilinimą aktyvuotu cikliniu amidu, kurio formulė:




,

kurioje A žiedas yra penkianaris azotą turintis heterociklas; ir

ii) i) pakopos paveikimą alkoksido druska alkoholiniame tirpiklyje.

---

*(51)* Int.Cl. ***C07D 251/60*** (2006.01)
*(11)* **2212302**
*(96)* 08838802.0
*(96)* 2008-10-14
*(97)* 2010-08-04
*(97)* 2016-04-27
*(86)* PCT/EP2008/063804
*(86)* 2008-10-14
*(87)* WO 2009/050169
*(87)* 2009-04-23
*(30)* 07118498, 2007-10-15, EP
*(72)* KERN, Andreas, DE
PRÖBSTLE, Hans-Ulrich, DE
JOHN, Tilo, DE
STEINER, Wolfgang, DE
MAAS, Heiko, HK
*(73)* BASF SE, 67056 Ludwigshafen am Rhein, DE
*(74)* Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
*(54)* Melamino gamybos būdas

Apibrėžties punktai: 5, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Melamino gamybos būdas karbamido konversija, naudojant kietą katalizatorių viename reaktoriuje arba nuosekliai sujungtų eilėje reaktorių temperatūros intervale nuo 370 iki 430°C, dujų, susidariusių karbamido konversijos metu, vėsinimą ir filtravimą, melamino pašalinimą desublimacija ir dalies dujų, likusių po melamino pašalinimo, („ciklo dujos“) pakartotinį grąžinimą į reaktorių arba reaktorius, kuris apima visų aukščiau minėtų pakopų vykdymą slėgyje intervale nuo 4 [0,4 MPa] iki 10 bar abs [1 MPa] ir karštų ciklo dujų dalies padavimą, kur dujų kiekis yra intervale nuo 5% iki 50%, kiekvienu atveju skaičiuojant nuo bendro dujų kiekio iš ciklono – po melamino atskyrimo, nepraleidžiant per karbamido skruberį, atgal į melamino sintezės reaktorių kaip skystinančių dujų.

2. Būdas pagal 1 punktą, kur katalizinė karbamido skaidymas ir melamino sintezė vyksta tik viename reaktoriuje verdančiame sluoksnyje.

3. Būdas pagal 1 arba 2 punktą, kur, po melamino pašalinimo, dalis karštų ciklo dujų, kur dujų kiekis yra intervale nuo 5% iki 50%, kiekvienu atveju skaičiuojant nuo bendro dujų kiekio iš ciklono, yra nukreipiamos į atšaką ir paduodamos į reaktorių kaip „skystinančios dujos“ nepraleidžiant per karbamido skruberį.

4. Būdas pagal 3 punktą, kur dalis karštų ciklo dujų, kur dujų kiekis yra intervale nuo 5% iki 50%, kiekvienu atveju skaičiuojant nuo bendro dujų kiekio iš ciklono – po melamino atskyrimo, nepraleidžiant per karbamido skruberį, yra nukreipiamos į atšaką prieš vėsinantį dujų ventiliatorių tekėjimo kryptimi.

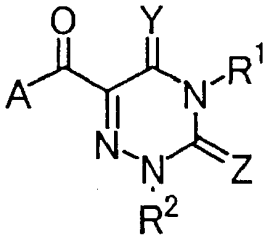
5. Būdas pagal 1-4 punktus, kur desublimacija yra vykdoma temperatūros intervale nuo 150 iki 250°C.

---

*(51)* Int.Cl. ***C07D 253/06*** (2006.01)
***A01N 43/707*** (2006.01)
***A01N 43/80*** (2006.01)
***A01N 43/84*** (2006.01)
***A01N 47/02*** (2006.01)
***A01P 13/02*** (2006.01)
***C07D 401/04*** (2006.01)
***C07D 403/04*** (2006.01)
***C07D 403/06*** (2006.01)
***C07D 405/04*** (2006.01)
***C07D 409/04*** (2006.01)
***C07D 413/04*** (2006.01)
***C07D 417/04*** (2006.01)

*(11)* **2542538**
*(96)* 11800564.4
*(96)* 2011-05-26
*(97)* 2013-01-09
*(97)* 2015-12-30
*(86)* PCT/JP2011/062643
*(86)* 2011-05-26
*(87)* WO 2012/002096
*(87)* 2012-01-05
*(30)* 2010148286, 2010-06-29, JP
*(72)* SHIBAYAMA, Atsushi, JP
KAJIKI, Ryu, JP
KOBAYASHI, Masami, JP
MITSUNARI, Takashi, JP
NAGAMATSU, Atsushi, JP
*(73)* FMC CORPORATION, Philadelphia, PA 19103, US
*(74)* Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* 6-Acil-1,2,4-triazino-3,5-diono darinys ir herbicidai
Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Triazino darinys arba jo druska, kaip pavaizduota formulėje 1:

[Chem. 22]



[ 1 ]

[Formulėje, $R^1$ žymi vandenilio atomą; $C_1$-$C_{12}$ alkilo grupę; $C_2$-$C_6$ alkenilo grupę; $C_2$-$C_6$ alkinilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkenilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupę; $C_2$-$C_6$ haloalkenilo grupę; $C_2$-$C_6$ haloalkinilo grupę; $C_3$-$C_6$ halocikloalkilo grupę; $C_3$-$C_6$ halocikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; amino $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; nitro $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilamino $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; di($C_1$-$C_6$ alkil)amino $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkiltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkiltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkilsulfonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; hidroksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; fenilo $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, (fenilas iš grupės, gali būti pakeistas viena pakaitine grupe, parinkta iš pakaitų grupės α arba nuo 2 iki 5 pakaitinių grupių, kurios yra vienodos arba skirtingos viena kitai ir yra parenkamos iš pakaitų grupės α); $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkiloksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkiloksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; feniloksi $C_1$-$C_6$-alkilo grupę (fenilas iš grupės,

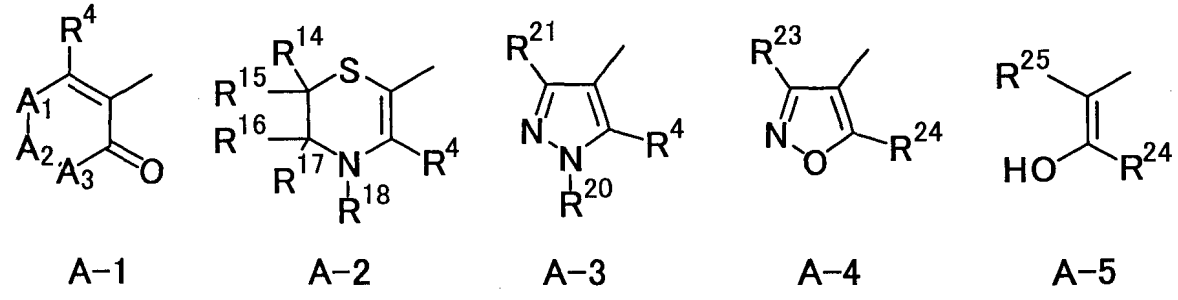
gali būti pakeistas su nuo 1 iki 5 identiškų arba skirtingų pakaitų, parinktų iš pakaitų grupės α); feniltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupę (fenilas iš grupės, gali būti pakeistas su nuo 1 iki 5 identiškų arba skirtingų pakaitų, parinktų iš pakaitų grupės α); fenilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę (fenilas iš grupės, gali būti pakeistas su nuo 1 iki 5 identiškų arba skirtingų pakaitų, parinktų iš pakaitų grupės α); fenilsulfonil $C_1$-$C_6$ alkilo grupę (fenilas iš grupės, gali būti pakeistas su nuo 1 iki 5 identiškų arba skirtingų pakaitų, parinktų iš pakaitų grupės α); $C_1$-$C_6$ haloalkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; fenilo grupę, kuri gali būti pakeista viena ar daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; fenilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, kuri gali būti pakeista viena ar daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; fenilo $C_2$-$C_6$ alkenilo grupę, kuri gali būti pakeista viena ar daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; fenilo $C_2$-$C_6$ alkinilo grupę, kuri gali būti pakeista viena ar daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; $C_1$-$C_6$ alkoksiimino $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; fenoksiimino $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, kuri gali būti pakeista viena ar daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; di ($C_1$-$C_6$ alkoksi) $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; ($R^{31}R^{32}$N-C=O)$C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksikarbonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilkarbonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilkarboniloksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilideno aminooksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; formilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupė; $C_1$-$C_6$ alkiltio $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; ciano $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; ciano $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_2$-$C_6$ alkilideno amino grupę; di ($C_1$-$C_{10}$alkil)amino $C_1$-$C_6$ alkilideno amino grupę; $NR^{31}R^{32}$ grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksi grupę; $C_2$-$C_6$ alkeniloksi grupę; $C_2$-$C_6$ alkiniloksi grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkiloksi grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkiloksi grupę; $C_1$-$C_6$-haloalkoksi grupę; heterociklinė grupę, apimančią nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną ar daugiau identiškų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo, ir azoto atomo, [grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α, ir, kai heterociklinėje grupėje heteroatomas yra sieros atomas, sieros atomas gali būti oksiduotas iki sulfoksido arba sulfono]; $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, pakeistą heterocikline grupe, apimančia nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vienu ar daugiau identiškų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo, [grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α]; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, pakeistą heterocikline grupe, apimančia nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vienu arba daugiau vienodų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo, ir azoto atomo [grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α]; arba $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, pakeistą su heterocikline-oksi grupe, kurioje heterociklinė grupė apima nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną ar daugiau identiškų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo, [grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α];

$R^2$ žymi vandenilio atomą; $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_2$-$C_6$ alkenilo grupę; $C_2$-$C_6$ alkinilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupę; $C_2$-$C_6$ haloalkenilo grupę; $C_2$-$C_6$ haloalkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkiloksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; di($C_1$-$C_6$ alkoksi) $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; heterociklinę grupę, kurią sudaro nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vienas arba daugiau identiškų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α); fenilo grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; fenilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; fenilo $C_2$-$C_6$ alkenilo grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; arba fenilo $C_2$-$C_6$ alkinilo grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α,

Y ir Z žymi deguonies atomą arba sieros atomą,

A žymi, bet kurią iš šių formulių nuo A-1 iki A-5,

[Chem. 23]

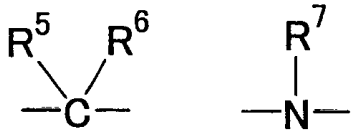



$R^4$ žymi hidroksilo grupę; $O^-M^+$ ($M^+$ yra šarminio metalo katijonas arba amonio katijonas); amino grupę; halogeno atomą; ciano grupę; izotiocianato grupę; izocianato grupę; hidroksikarboniloksi grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksikarboniloksi grupę; benziloksikarboniloksi grupę, kuri gali būti pakeistas pakaitine grupe, pasirinkta iš pakaitų grupės α; $C_1$-$C_6$ alkoksi grupę; $C_2$-$C_6$ alkeniloksi grupę; $C_2$-$C_6$ alkiniloksi grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkiloksi grupę; cianometileno oksi grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkiloksi grupę; $C_1$-$C_6$ alkilkarboniloksi grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkilkarboniloksi grupę; $C_2$-$C_6$ alkenilkarboniloksi grupę; $C_2$-$C_6$ haloalkenilkarboniloksi grupę; $C_2$-$C_6$ alkinilkarboniloksi grupę; $C_2$-$C_6$ haloalkinilkarboniloksi grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksikarbonilo $C_1$-$C_6$ alkoksi grupę; feniloksi grupę, kuri gali būti pakeista su

viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; benziloksi grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; fenilkarboniloksi grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; benzilkarboniloksi grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; fenilkarbonilo $C_1$-$C_6$ alkiloksi grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; $C_1$-$C_{10}$ alkilsulfoniloksi grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkilsulfoniloksi grupę; fenilsulfoniloksi grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; benzilsulfoniloksi grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; $C_1$-$C_{10}$ alkiltio grupę; $C_1$-$C_{10}$ alkilsulfinilo grupę; $C_1$-$C_{10}$ alkilsulfonilo grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkiltio grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkilsulfinilo grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkilsulfonilo grupę; $C_2$-$C_6$ alkeniltio grupę; $C_2$-$C_6$ alkenilsulfinilo grupę; $C_2$-$C_6$ alkenilsulfonilo grupę; $C_2$-$C_6$ alkiniltio grupę; $C_2$-$C_6$ alkinilsulfinilo grupę; $C_2$-$C_6$ alkinilsulfonilo grupę; feniltio grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; benziltio grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; fenilsulfinilo grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; benzilsulfinilo grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; fenilsulfonil grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; benzilsulfonilo grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; $C_1$-$C_{10}$ alkilamino grupę; di($C_1$-$C_{10}$ alkil)amino grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksikarbonilamino grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksi grupę, pakeistą su heterocikline grupe, sudaryta iš nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieno arba daugiau identiškų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α); heterociklinę grupę, apimančią nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną arba daugiau identiškų arba skirtingų heteroatomų, pasirinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo, (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α); arba heterociklinę oksi grupę, kurioje heterociklinė grupė apima nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną arba daugiau vienodų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomų (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α),

$A_1$ žymi grupę, vaizduojamą šia formule

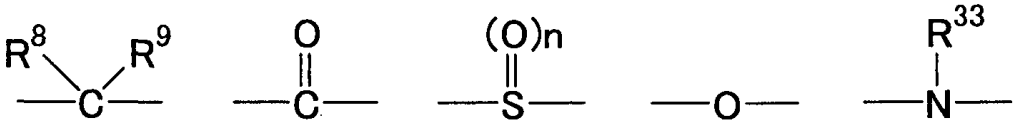
[Chem. 24]



[$X_1$] [$X_2$]

$A_2$ žymi grupę, vaizduojamą šia formule

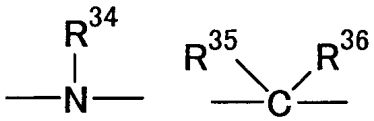
[Chem. 25]



[ $X_3$ ] [ $X_4$ ] [ $X_5$ ] [ $X_6$ ] [ $X_7$ ]

$A_3$ žymi grupę, vaizduojamą šia formule

[Chem. 26]



[ $X_8$ ] [ $X_9$ ]

n žymi 0, 1 arba 2,

$R^5$, $R^6$, $R^8$, $R^9$, $R^{35}$ ir $R^{36}$ kiekvienas nepriklausomai žymi vandenilio atomą arba $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, čia $R^5$ ir $R^8$ gali būti sujungti, sudarydami $C_2$-$C_5$ alkileno grandinę arba $C_2$-$C_5$ alkenileno grandinę, ir gali sudaryti žiedą kartu su gretimais anglies atomais, ir $R^5$ ir $R^{35}$ gali būti sujungti kartu, sudarydami $C_1$-$C_5$ alkileno grandinę, iš kurios susidaro žiedas su gretimais anglies atomais,

$R^7$, $R^{33}$ ir $R^{34}$ kiekvienas, nepriklausomai, žymi vandenilio atomą, $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupę, $C_2$-$C_6$ alkenilo grupę, $C_2$-$C_6$ alkinilo grupę arba $C_1$-$C_6$ alkoksi grupę,

$R^{14}$, $R^{15}$, $R^{16}$ ir $R^{17}$ kiekvienas, nepriklausomai, žymi vandenilio atomą, $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, $C_1$-$C_6$ alkoksi grupę arba benzilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α,

$R^{18}$ žymi vandenilio atomą, $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, $C_2$-$C_6$ alkenilo grupę, $C_2$-$C_6$ alkinilo grupę, cianometilo grupę arba benzilo grupę,

$R^{20}$ žymi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, $C_2$-$C_6$ alkenilo grupę, $C_2$-$C_6$ alkinilo grupę, $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupę, arba $C_3$-$C_6$ cikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę,

$R^{21}$ žymi vandenilio atomą, $C_1$-$C_6$ alkilo grupę arba halogeno atomą,

$R^{23}$ žymi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupę, $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupę, $C_1$-$C_{10}$ alkiltio grupę, $C_1$-$C_{10}$ alkilsulfinilo grupę, $C_1$-$C_{10}$ alkilsulfonilo grupę, feniltio grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α, benziltio grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α, fenilsulfinil grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α, benzilsulfinil grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α, fenilsulfonil grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α, arba benzilsulfonilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α,

$R^{24}$ žymi vandenilio atomą, halogeno atomą, ciano grupę, $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupę arba $C_1$-$C_6$ alkoksikarbonilamino grupę,

$R^{25}$ žymi $C_1$-$C_6$ alkoksikarbonilo grupę, ciano grupę arba nitro grupę,

$R^{31}$ ir $R^{32}$ kiekvienas nepriklausomai žymi vandenilio atomą; $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; fenilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; benzilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilkarbonilo grupę; $C_1$-$C_{10}$ alkiltio karbonilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksikarbonilo grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo grupę; fenilsulfonilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; benzilsulfonilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, pasirinktų iš pakaitų grupės α; heterociklinę grupę, apimančią nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną arba daugiau vienodų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α); arba $C_1$-$C_6$ alkilo grupė, pakeista su heterocikline grupe, kurioje heterociklinė grupė apima nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną arba daugiau vienodų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α), čia, $R^{31}$ ir $R^{32}$ gali būti sujungti ir sudaryti 5 – 6 narių žiedą, su gretimu azoto atomu, ir vienas arba keli anglies atomai žiede, gali būti pakeisti į sieros atomą ir/arba deguonies atomą;

kur „pakaitų grupė α“ žymi grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš:

halogeno atomo; hidroksilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkenilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkinilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės; $C_2$-$C_6$ haloalkenilo grupės; $C_2$-$C_6$ haloalkinilo grupės; $C_3$-$C_6$ halocikloalkilo grupės; $C_3$-$C_6$ halocikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksi grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkiloksi grupės; $C_2$-$C_6$ alkeniloksi grupės; $C_2$-$C_6$ alkiniloksi grupės; $C_1$-$C_6$ alkilkarboniloksi grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkoksi grupės; $C_1$-$C_6$ alkiltio grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkiltio grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilsulfinilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilsulfonilo grupės; amino grupės; $C_1$-$C_6$ alkilkarbonilamino grupės; mono($C_1$-$C_6$ alkil)amino grupės; di($C_1$-$C_6$ alkil)amino grupės; hidroksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkiltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupė; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkiltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilsulfonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; ciano $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkoksi grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkiloksi grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkoksi $C_1$-$C_6$ alkoksi grupės; ciano $C_1$-$C_6$ alkoksi grupės; $C_1$-$C_6$ acil grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksiimino $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; karboksilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksikarbonilo grupės; karbamoilo grupės; mono($C_1$-$C_6$ alkil)amino karbonilo grupės; di($C_1$-$C_6$ alkil)amino karbonilo grupės; nitro grupės; ciano grupės; fenilo grupės (fenilas grupėje gali būti pakeistas su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės β); heterociklinės grupės, apimančios nuo 2 iki 10 anglies atomų ir nuo 1 iki 5 vienodų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės β); heterociklinės oksi grupės, apimančios nuo 2 iki 10 anglies atomų ir nuo 1 iki 5 vienodų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis

grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės β); ir $C_3$-$C_6$ alkileno grupės, sudarytos su dvejomis gretimomis pakaitinėmis grupėmis, kur nuo 1 iki 3 anglies atomų alkileno grupėje gali būti pakeistos su atomu, parinktu iš grupės, susidedančios iš deguonies atomo, sieros atomo, azoto atomo ir anglies atomo apimančio karbonilo grupę; ir

„pakaitų grupė β“ žymi grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš: halogeno atomo, nitro grupės, ciano grupės, $C_1$-$C_6$ alkilo grupės, $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės, $C_1$-$C_6$ alkoksi grupės ir $C_1$-$C_6$ haloalkoksi grupės.].

2. Triazino darinys arba jo druska pagal 1 punktą, kur

$R^1$ žymi $C_1$-$C_{12}$ alkilo grupę; $C_2$-$C_6$ alkenilo grupę; $C_2$-$C_6$ alkilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkenilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupę; $C_2$-$C_6$ haloalkenilo grupę; $C_2$-$C_6$ haloalkinilo grupę; $C_3$-$C_6$ halocikloalkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkiltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkiloksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; feniloksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, (fenilas grupėje gali būti pakeistas su nuo 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α); feniltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupę (fenilas grupėje gali būti pakeistas su nuo 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α); fenilsulfinil $C_1$-$C_6$ alkilo grupę (fenilas grupėje gali būti pakeistas su nuo 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α); fenilsulfonil $C_1$-$C_6$ alkilo grupę (fenilas grupėje gali būti pakeistas su nuo 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α); fenilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; fenilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; fenilo $C_2$-$C_6$ alkenilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; fenilo $C_2$-$C_6$ alkinilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; $C_1$-$C_6$ alkoksiimino $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; di($C_1$-$C_6$ alkoksi) $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksikarbonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilkarbonilo $C_1$-$C_6$-alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilkarboniloksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $NR^{31}R^{32}$ grupę; heterociklinę grupę, apimančią nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną ar kelis identiškus arba skirtingus heteroatomus, parinktus iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α, ir, kai heterociklinės grupės heteroatomas yra sieros atomas, jis gali būti oksiduotas iki sulfoksido arba sulfono); arba $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, pakeistą su heterocikline grupe, kuri apima 3-10 anglies atomus ir vieną arba daugiau vienodų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α);

$R^2$ žymi vandenilio atomą; $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_2$-$C_6$ alkenilo grupę; $C_2$-$C_6$ alkinilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupę; $C_2$-$C_6$ haloalkenilo grupę; $C_2$-$C_6$ haloalkinilo grupę; heterociklinę grupę, apimančią nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną arba daugiau identiškų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α); fenilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; arba fenilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α;

Y ir Z žymi deguonies atomą arba sieros atomą,

A žymi bet kurį iš A-1, A-3 ir A-5,

A1 yra [$X_1$]

A2 yra [$X_3$] arba [$X_4$], ir

A3 yra [$X_9$],

[$X_1$] - $R^3$ ir $R^6$ kiekvienas nepriklausomai žymi vandenilio atomą arba $C_1$-$C_6$ alkilo grupę,

[$X_3$] - $R^8$ ir $R^9$ kiekvienas nepriklausomai žymi vandenilio atomą arba $C_1$-$C_6$ alkilo grupę,

[$X_9$] - $R^{35}$ ir $R^{36}$ kiekvienas nepriklausomai žymi vandenilio atomą arba $C_1$-$C_6$ alkilo grupę,

čia, $R^5$ ir $R^8$ gali būti sujungti kartu, sudarydami $C_2$-$C_5$ alkileno grandinę arba $C_2$-$C_5$ alkenileno grandinę, ir gali sudaryti žiedą kartu su gretimais anglies atomais, o $R^5$ ir $R^{35}$ gali būti sujungti kartu, sudarydami $C_1$-$C_5$ alkileno grandinę ir sudaryti žiedą su gretimais anglies atomais,

A-3 - $R^{20}$ yra $C_1$-$C_6$ alkilo grupė,

$R^{21}$ yra vandenilio atomas arba $C_1$-$C_6$ alkilo grupė,

A-5 - $R^{24}$ žymi vandenilio atomą, $C_1$-$C_6$ alkilo grupę arba $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupę, $R^{25}$ žymi $C_1$-$C_6$ alkoksikarbonilo grupę, ciano grupę arba nitro grupę,

$R^4$ žymi hidroksilo grupę; $O^-M^+$ ($M^+$ žymi šarminio metalo katijoną arba amonio katijoną); arba $C_1$-$C_{10}$ alkilsulfoniloksi grupę;

$R^{31}$ ir $R^{32}$ kiekvienas nepriklausomai žymi vandenilio atomą; $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; fenilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; arba benzilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; čia, $R^{31}$ ir $R^{32}$ gali būti sujungti, kad sudarytų 5 – 6 narių žiedą su gretimu azoto atomu, ir vienas arba keli anglies atomai esantys žiede gali būti pakeisti su sieros

atomu ir/arba deguonies atomu,

čia, „pakaitų grupė α“ žymi grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš:

halogeno atomo; $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkenilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkinilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės; $C_2$-$C_6$ haloalkenilas grupės; $C_2$-$C_6$ haloalkinilo grupės; $C_3$-$C_6$ halocikloalkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksi grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkiloksi grupės; $C_2$-$C_6$ alkeniloksi grupės; $C_2$-$C_6$ alkiniloksi grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkoksi grupės; $C_1$-$C_6$ alkiltio grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo grupės; nitro grupės; ciano grupės; fenilo grupės (fenilas gali būti pakeistas su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės β); heterociklinės oksi grupės, kurią sudaro nuo 2 iki 10 anglies atomų, ir nuo 1 iki 5 heteroatomų, kurie yra pasirinktinai parinkti iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės β); ir $C_3$-$C_6$ alkileno grupės, sudarytos su dvejomis gretimomis pakaitinėmis grupėmis, kur nuo 1 iki 3 anglies atomų alkileno grupėje gali būti pakeisti su atomu, parinktu iš grupės, susidedančios iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo, kur anglies atomas, sudaro karbonilo grupę.

3. Triazino darinys arba jo druska pagal 1 punktą, kur

$R^1$ yra grupė, parinkta iš grupės, susidedančios iš $C_1$-$C_{12}$ alkilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkenilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkinilo grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkenilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės; $C_2$-$C_6$ haloalkenilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkiltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksi-$C_1$-$C_6$ alkilo grupės; fenilo grupės, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; fenilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; $C_1$-$C_6$ alkoksiimino $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksikarbonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilkarbonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $NR^{31}R^{32}$ grupės; heterociklinės grupės, apimančios nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną arba daugiau vienodų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α, ir, kai grupės heteroatomas yra sieros atomas, jis gali būti oksiduotas iki sulfoksido arba sulfono); ir, $C_1$-$C_6$ alkilo grupės, pakeistos su heterocikline grupe, kuri apima nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną arba daugiau identiškų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α);

$R^{31}$ ir $R^{32}$, kiekvienas nepriklausomai, žymi grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš vandenilio atomo; $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; ir fenilo grupės, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α;

$R^2$ žymi grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkenilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkinilo grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės; heterociklinės grupės, apimančios nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną arba daugiau vienodų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α); ir fenilo grupės, kuri gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α;

Y ir Z žymi deguonies atomą arba sieros atomą,

A žymi bet kurį iš A-1, A-3 ir A-5,

$R^4$ A-1-ame žymi hidroksilo grupę; $O^-M^+$ ($M^+$ yra šarminio metalo katijonas arba amonio katijonas); arba $C_1$-$C_{10}$ alkilsulfoniloksi grupę;

A-1-ame $A_1$ yra $[X_1]$

$A_2$ yra $[X_3]$ arba $[X_4]$ ir

$A_3$ yra $[X_9]$,

$[X_1]$ - $R^5$ ir $R^6$ kiekvienas nepriklausomai žymi vandenilio atomą arba $C_1$-$C_6$ alkilo grupę,

$[X_3]$ - $R^8$ ir $R^9$ kiekvienas nepriklausomai žymi vandenilio atomą arba $C_1$-$C_6$ alkilo grupę,

$[X_9]$ - $R^{35}$ ir $R^{36}$ kiekvienas nepriklausomai žymi vandenilio atomą arba $C_1$-$C_6$-alkilo grupę, čia, $R^5$ ir $R^8$ gali jungtis tarpusavyje per $C_2$-$C_5$ alkileno grandinę arba $C_2$-$C_5$ alkenileno grandinę ir sudaro žiedą, o $R^5$ ir $R^{35}$ gali jungtis vienas su kitu per $C_1$-$C_5$ alkileno grandinę ir sudaryti žiedą,

A-3 - $R^{20}$ yra $C_1$-$C_6$ alkilo grupė,

$R^{21}$ yra vandenilio atomas arba $C_1$-$C_6$ alkilo grupė ir

$R^4$ A-1-ame žymi hidroksilo grupę; $O^-M^+$ ($M^+$ yra šarminio metalo katijonas arba amonio katijonas); arba $C_1$-$C_{10}$ alkilsulfoniloksi grupę;

„pakaitų grupė α“ žymi grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš: halogeno atomo; $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkenilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkinilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksi grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkoksi grupės; $C_1$-$C_6$ alkiltio grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo grupės; nitro grupės; ciano grupės; fenilo grupės; ir $C_3$-$C_6$ alkileno grupės, sudarytos su dviejomis gretimomis pakaitinėmis grupėmis, kur nuo 1 iki 3 anglies atomų, esančių alkileno grupėje gali būti pakeisti su atomais, parinktais iš grupės, susidedančios iš deguonies atomo,

sieros atomo, azoto atomo ir anglies atomo sudarančio karbonilo grupę.

4. Triazino darinys arba jo druska pagal 1 punktą, kur

$R^1$ žymi grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš $C_1$-$C_{12}$ alkilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkenilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkinilo grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkenilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės; $C_2$-$C_6$ haloalkenilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkiltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; fenilo grupės, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; fenilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksiimino $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksikarbonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilkarbonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $NR^{31}R^{32}$ grupės; heterociklinės grupės, parinktos iš grupės, susidedančios iš piridilo grupės, pirimidinilo grupės, piridazinilo grupės, tienilo grupės, izoksazolilo grupės, pirazolilo grupės, morfolinilo grupės, tiomorfolinilo grupės, pirazinilo grupės, piperidinilo grupės ir piperazinilo grupės (heterociklinė grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α, ir kai heteroatomas yra sieros atomas, jis gali būti oksidiuotas iki sulfoksido arba sulfono); ir tetrahidrofurilo-metilo grupės;

$R^{31}$ ir $R^{32}$, kiekvienas nepriklausomai, žymi grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš vandenilio atomo; $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; ir fenilo grupės;

$R^2$ žymi grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės; piridilo grupės; ir fenilo grupės;

Y ir Z žymi deguonies atomą arba sieros atomą,

A žymi bet kurį iš A-1 ir A-3,

$R^4$ A-1-ame žymi hidroksilo grupę; arba $C_1$-$C_{10}$ alkilsulfoniloksi grupę,

A-1-ame $A_1$ yra $[X_1]$, $A_2$ yra $[X_3]$ arba $[X_4]$, ir $A_3$ yra $[X_9]$,

$[X_1]$ - $R^5$ ir $R^6$ yra vandenilio atomas arba $C_1$-$C_6$ alkilo grupė,

$[X_3]$ - $R^8$ ir $R^9$ yra vandenilio atomas arba $C_1$-$C_6$ alkilo grupė,

$[X_9]$ - $R^{35}$ ir $R^{36}$ yra vandenilio atomas arba $C_1$-$C_6$ alkilo grupė,

čia, $R^5$ ir $R^8$ gali būti sujungti kartu, sudarydami $C_2$-$C_5$ alkileno grandinę ir žiedą, bei $R^5$ ir $R^{35}$ gali

būti sujungti kartu, sudarydami $C_1$-$C_5$ alkileno grandinę ir žiedą,

A-3 - $R^{20}$ yra $C_1$-$C_6$ alkilo grupė, $R^{21}$ yra vandenilio atomas arba $C_1$-$C_6$ alkilo grupė ir $R^4$ žymi hidroksilo grupę arba $C_1$-$C_{10}$ alkilsulfoniloksi grupę, ir

„pakaitų grupė α“ reiškia grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš: halogeno atomo; $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkenilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkinilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksi grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkoksi grupės; $C_1$-$C_6$ alkiltio grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo grupės; nitro grupės; ciano grupės; fenilo grupės; ir metilendioksi grupės.

5. Agrocheminė kompozicija, apimanti triazino darinį arba jo druską, pagal bet kurį iš 1 – 4 punktų kartu su žemės ūkyje priimtinu nešikliu.

6. Agrocheminė kompozicija pagal 5 punktą, kur agrocheminė kompozicija papildomai apima paviršiaus aktyviąją medžiagą.

7. Herbicidas, apimantis triazino darinį arba jo druską, pagal bet kurį iš 1 - 4 punktų, kaip aktyvųjį komponentą.

8. Herbicidas pagal 7 punktą, kur herbicidas turi herbicidinį poveikį piktžolėms pievose arba laukuose, kuriuose auginami agrokultūriniai augalai.

9. Herbicidas pagal 8 punktą, kur agrokultūriniai augalai turi atsparumą įgytą selekcijos arba genetinės rekombinacijos būdu.

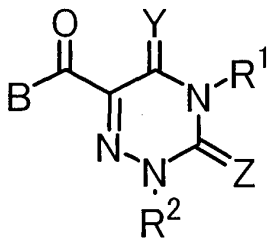
10. Būdas naikinti piktžoles dirvožemyje panaudojant efektyvų herbicidų kiekį, apimantį triazino darinį arba jo druską, pagal bet kurį iš 1 - 4 punktų.

11. Būdas pagal 10 punktą, kur dirvožemis yra žemės ūkio paskirties žemė.

12. Būdas pagal 10 punktą, kur dirvožemis yra žemės ūkio paskirties žemė su pievomis arba laukais, kuriuose auginami agrokultūriniai augalai.

13. Triazino darinys arba jo druska, vaizduojami formule 2:

[Chem. 27]



[2]

[formulėje, B žymi hidroksilo grupę arba $C_1$-$C_6$ alkoksi grupę, $R^2$, Y ir Z reikšmės yra tokios pat, kaip aprašytos anksčiau nurodytoje formulėje 1, ir $R^1$ žymi $C_2$-$C_6$ alkenilo grupę; $C_2$-$C_6$ alkinilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkenilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupę; $C_2$-$C_6$-haloalkenilo grupę; $C_2$-$C_6$ haloalkinilo grupę; $C_3$-$C_6$ halocikloalkilo grupę; $C_3$-$C_6$ halocikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; amino $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; nitro $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilamino $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; di($C_1$-$C_6$ alkil)amino $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkiltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkiltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkilsulfonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; hidroksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; fenilo $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, (fenilas grupėje gali būti pakeistas su viena pakaitine grupe, parinkta iš pakaitų grupės α arba nuo 2 iki 5 pakaitinių grupių, kurios yra vienodos arba skirtingos ir yra parenkamos iš pakaitų grupės α); $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkiloksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkiloksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; feniloksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę (fenilas grupėje gali būti pakeistas su 1-5 identiškomis arba skirtingomis, pakaitinėmis grupėmis parinktomis iš pakaitų grupės α); feniltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupę (fenilas grupėje gali būti pakeistas su 1-5 identiškomis arba skirtingomis, pakaitinėmis grupėmis parinktomis iš pakaitų grupės α); fenilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę (fenilas grupėje gali būti pakeistas su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis, pakaitinėmis grupėmis parinktomis iš pakaitų grupės α); fenilsulfonil $C_1$-$C_6$ alkilo grupę (fenilas grupėje gali būti pakeistas su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis, pakaitinėmis grupėmis parinktomis iš pakaitų grupės α); $C_1$-$C_6$ haloalkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; fenilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; fenilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; fenilo $C_2$-$C_6$ alkenilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; fenilo $C_2$-$C_6$ alkinilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; $C_1$-$C_6$ alkoksiimino $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; fenoksiimino $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; di($C_1$-$C_6$ alkoksi) $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; ($R^{31}R^{32}$N-C=O)$C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksikarbonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilkarbonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilkarboniloksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilideno aminooksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; formilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkiltio $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; ciano $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; ciano $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_2$-$C_6$ alkilideno amino grupę; di($C_1$-$C_{10}$ alkil)amino $C_1$-$C_6$ alkilideno amino grupę; $NR^{31}R^{32}$ grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksi grupę; $C_2$-$C_6$ alkeniloksi grupę; $C_2$-$C_6$ alkiniloksi grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkiloksi grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkiloksi grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkoksi grupę; heterociklinę grupę, apimančią nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną ar kelis identiškus arba skirtingus heteroatomus, parinktus iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo, [grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis, pakaitinėmis grupėmis parinktomis iš pakaitų grupės α, ir, kai heteroatomas yra sieros atomas, jis gali būti oksiduotas iki sulfoksido arba sulfono]; $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, pakeistą su heterocikline grupe, apimančia nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną arba kelis identiškus arba skirtingus heteroatomus, parinktus iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo [grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis, pakaitinėmis grupėmis parinktomis iš pakaitų grupės α]; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, pakeistą su heterocikline grupe, apimančia nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną arba kelis identiškus arba skirtingus heteroatomus, parinktus iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo [grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis, pakaitinėmis grupėmis parinktomis iš pakaitų grupės α]; arba $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę, pakeistą su heterocikline oksi grupe, kurioje heterociklinė grupė apima nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną arba daugiau identiškų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo, [grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis, pakaitinėmis grupėmis parinktomis iš pakaitų grupės α];

$R^{31}$ ir $R^{32}$ kiekvienas nepriklausomai žymi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; fenilo grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; benzilo grupę, kuri gali būti pakeista su viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilkarbonilo grupę; $C_1$-$C_{10}$ alkiltio karbonilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkoksikarbonilo grupę; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupę; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupę; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo grupę; fenilsulfonilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; benzilsulfonilo grupę, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; heterociklinę grupę, apimančią nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną ar kelis identiškus arba skirtingus heteroatomus, parinktus iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo, (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis, pakaitinėmis grupėmis parinktomis iš pakaitų grupės α); arba $C_1$-$C_6$ alkilo grupę,

pakeistą su heterocikline grupe, kurioje heterociklinė grupė, apima nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną arba daugiau identiškų arba skirtingų heteroatomų, pasirinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis, pakaitinėmis grupėmis parinktomis iš pakaitų grupės α), čia $R^{31}$ ir $R^{32}$ gali būti sujungti, kad sudarytų 5 - 6 narių žiedą su gretimu azoto atomu, ir vienas arba daugiau anglies atomų žiede, gali būti pakeistas su sieros atomu ir/arba deguonies atomu;

kur, „pakaitų grupė α“ reiškia grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš:

halogeno atomo; hidroksilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkenilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkinilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės; $C_2$-$C_6$ haloalkenilo grupės; $C_2$-$C_6$ haloalkinilo grupės; $C_3$-$C_6$ halocikloalkilo grupės; $C_3$-$C_6$ halocikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksi grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkiloksi grupės; $C_2$-$C_6$ alkeniloksi grupės; $C_2$-$C_6$ alkiniloksi grupės; $C_1$-$C_6$ alkilkarboniloksi grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkoksi grupės; $C_1$-$C_6$ alkiltio grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkiltio grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilsulfinilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilsulfonilo grupės; amino grupės; $C_1$-$C_6$ alkilkarbonilamino grupės; mono($C_1$-$C_6$ alkil)amino grupės; di($C_1$-$C_6$ alkil)amino grupės; hidroksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkiltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupė; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkiltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilsulfonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; ciano $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkoksi grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo $C_1$-$C_6$ alkiloksi grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkoksi $C_1$-$C_6$ alkoksi grupės; ciano $C_1$-$C_6$ alkoksi grupės; $C_1$-$C_6$ acil grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksiimino $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; karboksilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksikarbonilo grupės; karbamoilo grupės; mono($C_1$-$C_6$ alkil)amino karbonilo grupės; di($C_1$-$C_6$ alkil)amino karbonilo grupės; nitro grupės; ciano grupės; fenilo grupės (fenilas grupėje gali būti pakeistas su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės β); heterociklinės grupės, apimančios nuo 2 iki 10 anglies atomų ir nuo 1 iki 5 vienodų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės β); heterociklinės oksi grupės, apimančios nuo 2 iki 10 anglies atomų ir nuo 1 iki 5 vienodų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės β); ir $C_3$-$C_6$ alkileno grupės, sudarytos su dvejomis gretimomis pakaitinėmis grupėmis, kur nuo 1 iki 3 anglies atomų alkileno grupėje gali būti pakeistos su atomu, parinktu iš grupės, susidedančios iš deguonies atomo, sieros atomo, azoto atomo ir anglies atomo apimančio karbonilo grupę; ir

„pakaitų grupė β“ žymi grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš: halogeno atomo, nitro grupės, ciano grupės, $C_1$-$C_6$ alkilo grupės, $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės, $C_1$-$C_6$ alkoksi grupės ir $C_1$-$C_6$ haloalkoksi grupės.].

14. Triazino darinys arba jo druska pagal 13 punktą, kur

Y formulėje 2 yra deguonies atomas,

$R^1$ formulėje 2 žymi grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš $C_2$-$C_6$ alkenilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkinilo grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkenilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės; $C_2$-$C_6$ haloalkenilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkiltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksiimino $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$-alkoksikarbonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilkarbonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; fenilo grupės, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; fenilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; ir heterociklinės grupės, apimančios nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną arba daugiau identiškų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α, ir, kai heteroatomas yra sieros atomas, kuris gali būti oksiduotas iki sulfoksido arba sulfono); ir

$R^2$ formulėje 2 žymi grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės; fenilo grupės, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; ir heterociklinės grupės, apimančios nuo 3 iki 10 anglies atomų ir vieną arba daugiau identiškų arba skirtingų heteroatomų, parinktų iš deguonies atomo, sieros atomo ir azoto atomo (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α).

15. Triazino darinys arba jo druska pagal 14 punktą, kur

Y formulėje 2 yra deguonies atomas,

$R^1$ formulėje 2 žymi grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš $C_2$-$C_6$ alkenilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkinilo grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkilo grupės; $C_3$-$C_6$ cikloalkenilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės; $C_2$-$C_6$ haloalkenilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksi $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkiltio $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksiimino $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksikarbonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilkarbonilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; fenilo grupės, kuri gali būti pakeista viena arba daugiau pakaitinių grupių, parinktų iš pakaitų grupės α; fenilo $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; ir heterociklinės grupės, parinktos iš grupės, susidedančios iš piridilo grupės, pirimidinilo grupės, pirazinilo grupės, piridazinilo grupės, tienilo grupės, tiazolilo grupės, izoksazolilo grupės, pirazolilo grupės, morfolinilo grupės, tiomorfolinilas grupės ir piperazinilo grupės (grupė gali būti pakeista su 1 - 5 identiškomis arba skirtingomis pakaitinėmis grupėmis, parinktomis iš pakaitų grupės α, ir, kai heteroatomas yra sieros atomas, kuris gali būti oksiduotas iki sulfoksido arba sulfono);

$R^2$ yra grupė, parinkta iš grupės, susidedančios iš $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės; ir piridilo grupės; ir „pakaitų grupė α“ reiškia grupę, parinktą iš grupės, susidedančios iš halogeno atomo; $C_1$-$C_6$ alkilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkenilo grupės; $C_2$-$C_6$ alkinilo grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkoksi grupės; $C_1$-$C_6$ haloalkoksi grupės; $C_1$-$C_6$ alkiltio grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfinilo grupės; $C_1$-$C_6$ alkilsulfonilo grupės; nitro grupės; ciano grupės; fenilo grupės; ir metilendioksi grupės.

---

*(51)* Int.Cl. ***C07D 311/26*** (2006.01)
*(11)* **2310379**
*(96)* 09772614.5
*(96)* 2009-06-18
*(97)* 2011-04-20
*(97)* 2015-12-16
*(86)* PCT/FI2009/050544
*(86)* 2009-06-18
*(87)* WO 2010/000927
*(87)* 2010-01-07
*(30)* 20085681, 2008-07-01, FI
*(72)* PIETARINEN, Suvi, FI
HOTANEN, Ulf, FI
*(73)* Montisera Ltd, Helsinki, FI
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Medžio šakos vidinio galo ekstrakto frakcionavimo būdas ir skystis-skystis ekstrahavimo panaudojimas medžio šakos vidinio galo ekstrakto gryninimui

Apibrėžties punktai: 21, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Medžio šakos vidinio galo ekstrakto frakcionavimo būdas, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad medžio šakos vidinis galas iš pradžių yra ekstrahuojamas hidrofiliniu tirpikliu, gaunamas medžio šakos vidinio galo ekstraktas yra ekstrahuojamas su lipofiliniu tirpikliu, yra išgaunama bent viena medžio šakos vidinio galo ekstrakto frakcija ir minėtas frakcionavimas yra atliekamas kaip skystis-skysti ekstrahavimas.

2. Būdas pagal 1 punktą, kur minėtas lipofolinis tirpiklis apima nepolinį tirpiklį arba nepolinių tirpiklių mišinį, turintį žemesnę negu 3 dialektrinę konstantą, nustatytą esant 25 ºC.

3. Būdas pagal 2 punktą, kur minėtas lipofilinis tirpiklis yra parinktas iš grupės, susidedančios iš heksano, heptano, benzeno, tolueno, cikloheksano, ciklopentano, ir jų mišinių.

4. Būdas pagal 1 punktą, kur minėtas hidrofilinis tirpiklis apima polinį tirpiklį arba polinių tirpiklių mišinį, kurio dialektrinė konstanta yra didesnė negu 3, pageidautinai didesnė negu 15, nustatyta esant 25 ºC.

5. Būdas pagal 4 punktą, kur minėtas hidrofilinis tirpiklis yra parinktas iš grupės, susidedančios iš vandens, alkoholio, acetono ir jų mišinių.

6. Būdas pagal 1 punktą, kur minėtas ekstrahavimas su hidrofiliniu tirpikliu yra atliekamas ant neišdžiovinto arba dalinai išdžiovintos medžio šakos vidinio galo medžiagos, kurioje sausos kietos medžiagos yra 60-95 %, pageidautinai 70-90 %.

7. Būdas pagal bet kurį vieną iš ankstesnių punktų, kur hidrofilinis tirpiklis, kuris buvo naudotas minėtam ekstrahavimui, turi vandens.

8. Būdas pagal 7 punktą, kur minėtame hidrofiliniame tirpiklyje ir/arba gaunamame medžio šakos vidinio galo ekstrakte vandens kiekis yra pakoreguotas, kad palengvintų minėto lipofilinio tirpiklio ekstrahavimo fazių atskyrimą, pageidautinai minėtas hidrofilinis tirpiklis apima etanolį, minėtas lipofilinis tirpiklis apima heptaną, o minėto vandens yra 10 % arba daugiau.

9. Būdas pagal bet kurį vieną iš ankstesnių punktų, kur minėtas ekstrahavimas su lipofiliniu tirpikliu yra kartojamas bent kartą.

10. Būdas pagal bet kurį vieną iš ankstesnių punktų, kur minėta išgauta medžio šakos vidinio galo ekstrakto frakcija apima vieną arba daugiau lipofilinių frakcijų, o minėtas lipofilinis tirpiklis yra pašalinamas garinant, ir kur gaunama lipofilinė derva yra išgaunama.

11. Būdas pagal bet kurį vieną iš ankstesnių punktų, kur minėta išgauta medžio šakos vidinio galo ekstrakto frakcija apima vieną arba daugiau hidrofilinių frakcijų, o minėtas hidrofilinis tirpiklis yra pašalinamas garinant, ir kur išgrynintas hidrofilinis ekstraktas yra išgaunamas ir yra pasirinktinai papildomai apdorojamas tam, kad išleistų specifinį(-ius) jo komponentą(-us).

12. Būdas pagal bet kurį vieną iš ankstesnių punktų, kur minėtas medžio šakos vidinis galas apima spygliuočių medžių šakų vidinius galus, pageidautinai medžių, parinktų iš pušies (*Pinus)*, melsvosios eglės *(Piceas),* kėnio *(Abies)* ir jų derinių.

13. Būdas pagal 12 punktą, kur minėtas ekstrahavimas su hidrofiliniu tirpikliu leidžia gauti neapdirbtą hidrofilinį ekstraktą, turintį komponetą (-us), parinktą (-us) ir grupės, susidedančios iš lignano(-ų), flavonoido(-ų), stilbeno(-ų), juvabiono(-ų), riebiosios (-ųjų) rūgšties (-čių), dervos rūgšties (-čių), sterolo (-ų), trigliceridо(-ų) ir jų derinių.

14. Būdas pagal 12 punktą, kur minėtas ekstrahavimas su lipofiliniu tirpikliu leidžia gauti išgrynintą hidrofilinį ekstraktą, turintį daugiau negu 90 % sausos kietos medžiagos iš komponento(-ų), parinkto(-ų) iš grupės, susidedančios iš lignano(-ų), flavonoido(-ų), stilbeno(-ų) ir jų derinių.

15. Būdas pagal 14 punktą, kur minėti lignanai yra parinkti iš alohidroksimatairezino, (-)-hidroksimatairezinolo, sekoizolaricirezinolo, konidendrino, konidendrinės rūgšties, todolaktolo, izoliovilo, laricirezinolo, lignano A, matairezinolo, oligolignanų, nortrachelogenino, pinorezinolo ir jų derinių, o minėti stilbenai yra parinkti iš pinosilvino, pinosilvino monometilo eterio ir jų derinių, ir kur vienas arba daugiau iš minėtų junginių yra izoliuotas(-i) nuo minėto ekstrakto.

16. Būdas pagal bet kurį vieną iš ankstesnių punktų, kur minėtas lipofilinis tirpiklis yra išgautas po minėto ekstrahavimo ir nukreiptas į tolimesnį lipofilinį ekstrahavimą.

17. Būdas pagal bet kurį vieną iš ankstesnių punktų, kur minėtu ekstrahavimu su lipofiliniu tirpikliu yra gaunamas lipofilinis ekstraktas, kuriame yra sudedamosios dalys, parinktos iš grupės, susidedančios iš dervos rūgšties(-čių), sočiosios(-ųjų) rūgšties(-čių), sterolo(-ų), juvabiono(-ų), trigliceridо(-ų) ir jų derinių.

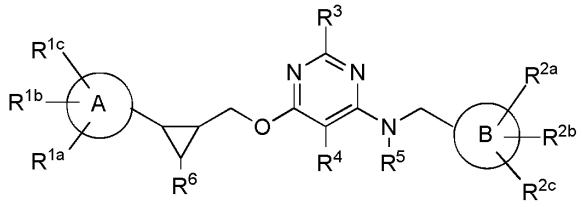
18. Lipofilinio skystis-skystis ekstrahavimo naudojimas medžio šakos vidinio galo hidrofilinio ekstrakto gryninimui, kur minėtas medžio šakos vidinio galo ekstraktas yra gaunamas pradiniu medžio šakos vidinio galo ekstrahavimu su hidrofiliniu tirpikliu.

19. Panaudojimas pagal 18 punktą, kur minėtu gryninimu yra gaunamas medžio šakos vidinio galo hidrofilinis ekstraktas, turintis mažiau negu 25 %, pageidautinai mažiau negu 10 %, ir labiausiai pageidautinai mažiau negu 5 % priemaišų sausos kietos medžiagos, kur priemaišos yra parinktos iš grupės, susidedančios iš dervos rūgščių, riebiųjų rūgščių, sterolų, juvabionų, trigliceridų ir jų derinių.

20. Išgrynintas medžio šakos vidinio galo ekstraktas, gaunamas skystis-skystis ekstrahavimu, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad turi daugiau negu 90 %, pageidautinai daugiau negu 95 %, ir labiausiai pageidautinai daugiau negu 99 % sausos kietos medžiagos iš sudedamųjų dalių, parinktų iš lignano(-ų), flavonoido(-ų), ir/arba stilbeno(-ų) derinių, ir mažiau negu 10 %, pageidautinai mažiau negu 5 %, ir labiausiai pageidautinai mažiau negu 1 % sausos kietos medžiagos iš priemaišų, parinktų iš dervos rūgščių, riebiųjų rūgščių, sterolų, juvabionų, trigliceridų ir jų derinių.

21. Išgrynintas medžio šakos vidinio galo ekstraktas pagal 20 punktą, susidedantis iš esmės iš 20-40 % iš sausų kietų medžiagų iš stilbenų,parinktų iš pinosilvino ir pinosilvino monometilo eterio, 55-75 % iš sausų kietų medžiagų iš lignanų, parinktų iš alohidroksimatairezino, (-)-hidroskimatairezinolo, sekoizolaricirezinolo, konidendrino, konidendrinės rūgšties, todolaktolo, izoliovilo, laricirezinolo, lignano A, matairezinolo, oligolignanų, nortrachelogenino ir pinorezinolo, ir 1-5 % sausos kietos medžiagos iš priemaišų, parinktų iš C18 riebiųjų rūgščių, neoabietinės rūgšties, abietinės rūgšties, dehidroabietinės rūgšties, pimarinės rūgšties, izopimarinės rūgšties ir palustrinės rūgšties.

*(51)* Int.Cl. ***C07D 401/12*** (2006.01)
***C07D 401/14*** (2006.01)
***C07D 405/14*** (2006.01)
***C07D 417/14*** (2006.01)
***C07D 487/04*** (2006.01)
***A61K 31/506*** (2006.01)
***A61P 25/18*** (2006.01)
*(11)* **2748151**
*(96)* 12826375.3
*(96)* 2012-08-20
*(97)* 2014-07-02
*(97)* 2016-03-16
*(86)* PCT/US2012/051522
*(86)* 2012-08-20
*(87)* WO 2013/028590
*(87)* 2013-02-28
*(30)* 201161527392 P, 2011-08-25, US
*(72)* COX, Christopher, D., US
DUDKIN, Vadim, US
KERN, Jeffrey, US
LAYTON, Mark, E., US
RAHEEM, Izzat, T., US
*(73)* Merck Sharp & Dohme Corp., Rahway, NJ 07065-0907, US
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Pirimidino PDE10 inhibitoriai
Apibrėžties punktai: 29, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Junginys, kurio formulė I:




I

kur:
A yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:
(1) piridilo,
(2) chinolinilo,
(3) naftiridinilo,
(4) tiazolilo,
(5) piridazinilo,
(6) oksazolilo ir
(7) pirazolilo,
(8) dihidropirolopirazolilo,
(9) dihidrociklopentapiridinilo,
(10) imidazopiridazinilo, ir
(11) pirazolopirimidinilo;
B yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:
(1) tiazolilo,
(2) pirazolilo,
(3) tiadiazolilo,
(4) izoksazolilo,

(5) izotiazolilo,

(6) piridilo, ir

(7) pirimidinilo;

$R^{1a}$, $R^{1b}$ ir $R^{1c}$ yra nepriklausomai parinkti iš grupės, susidedančios iš:

(1) vandenilio,

(2) halogeno,

(3) hidroksilo,

(4) $-(C=O)_m-O_n-C_{1-6}$alkilo, kur m yra 0 arba 1, n yra 0 arba 1 (kur jeigu m yra 0 arba n yra 0, yra ryšys) ir kur alkilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{13}$,

(5) $-(C=O)_m-O_n-C_{3-6}$cikloalkilo, kur cikloalkilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{13}$,

(6) $-(C=O)_m-C_{2-4}$alkenilo, kur alkenilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{13}$,

(7) $-(C=O)_m-C_{2-4}$alkinilo, kur alkinilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{13}$,

(8) $-(C=O)_m-O_n$-fenilo arba $-(C=O)_m-O_n$-naftilo, kur fenilas arba naftilas yra nepakeisti arba pakeisti vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{13}$,

(9) $-(C=O)_m-O_n$-heteroarilo, kur heterarilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{13}$,

(10) $-(C=O)_m-NR^{10}R^{11}$,

(11) $-S(O)_2-NR^{10}R^{11}$,

(12) $-S(O)_q-R^{12}$, kur q yra 0, 1 arba 2 ir kur $R^{12}$ yra parinktas iš $R^{10}$ ir $R^{11}$ reikšmių,

(13) $-CO_2H$,

(14) -CN, ir

(15) $-NO_2$;

$R^{2a}$, $R^{2b}$ ir $R^{2c}$ yra nepriklausomai parinkti iš grupės, susidedančios iš:

(1) vandenilio,

(2) halogeno,

(3) hidroksilo,

(4) $-(C=O)_m-O_n-C_{1-6}$alkilo, kur alkilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{13}$,

(5) $-(C=O)_m-O_n-C_{3-6}$cikloalkilo, kur cikloalkilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{13}$,

(6) $-(C=O)_m-C_{2-4}$alkenilo, kur alkenilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{13}$,

(7) $-(C=O)_m-C_{2-4}$alkinilo, kur alkinilas yra yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{13}$,

(8) $-(C=O)_m-O_n$-fenilo arba $-(C=O)_m-O_n$-naftilo, kur fenilas arba naftilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{13}$,

(9) $-(C=O)_m-O_n$-heterociklilo, kur heterociklilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{13}$,

(10) $-(C=O)_m-NR^{10}R^{11}$,

(11) $-S(O)_2-NR^{10}R^{11}$,

(12) $-S(O)_q-R^{12}$,

(13) $-CO_2H$,

(14) -CN, ir

(15) $-NO_2$;

$R^3$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:

(1) $CH_3$,

(2) $CF_3$,

(3) $CH_2F$,

(4) $CH_2CH_3$,

(5) ciklopropilo,

(6) ciano,

(7) vandenilio,

(8) $NH_2$,

(9) $C(O)OR^5$,

(10) $-O-C_{1-6}$alkilo,

(11) $-(CO)NH_2$,

(12) $C_{1-6}$alkilOH,

(13) $C(O)$ $C_{1-6}$alkilo ir

(14) halogeno;

$R^4$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:

(1) vandenilio,

(2) halogeno,

(3) -$C_{1-6}$alkilo, ir

(4) ciano,

$R^5$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:

(1) vandenilio, ir

(2) $C_{1-6}$alkilo;

$R^6$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:

(1) vandenilio,

(2) $C_{1-6}$alkilo, ir

(3) $OC_{1-6}$alkilo;

$R^{10}$ ir $R^{11}$ yra nepriklausomai parinkti iš grupės, susidedančios iš:

(a) vandenilio,

(b) $C_{1-6}$alkilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas $R^{14}$,

(c) $C_{3-6}$alkenilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas $R^{14}$,

(d) $C_{3-6}$alkinilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas $R^{14}$,

(e) $C_{3-6}$cikloalkilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas $R^{14}$,

(f) $C_{1-6}$alkoksilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas $R^{14}$,

(g) fenil, kuris yra nepakeistas arba pakeistas $R^{14}$, ir

(h) heteroarilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas $R^{14}$,

$R^{13}$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:

(1) halogeno,

(2) hidroksilo,

(3) -$(C=O)_m$-$O_n$-$C_{1-6}$alkilo, kur alkilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{14}$,

(4) -$O_n$-($C_{1-3}$)perfluoralkilo,

(5) -$(C=O)_m$-$O_n$-$C_{3-6}$cikloalkilo, kur cikloalkilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{14}$,

(6) -$(C=O)_m$-$C_{2-4}$alkenilo, kur alkenilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{14}$,

(7) -$(C=O)_m$-$C_{2-4}$alkinilo, kur alkinilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{14}$,

(8) -$(C=O)_m$-$O_n$-fenilo arba -$(C=O)_m$-$O_n$-naftilo, kur fenilas arba naftilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{14}$,

(9) -$(C=O)_m$-$O_n$-heteroarilo, kur heteroarilas yra nepakeistas arba pakeistas vienu arba daugiau pakaitų, parinktų iš $R^{14}$,

(10) -$(C=O)_m$-$NR^{10}R^{11}$,

(11) -$S(O)_2$-$NR^{10}R^{11}$,

(12) -$S(O)_q$-$R^{12}$,

(13) -$CO_2H$,

(14) -CN, and

(15) -$NO_2$;

$R^{14}$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:

(1) hidroksilo,

(2) halogeno,

(3) $C_{1-6}$alkilo,

(4) -$C_{3-6}$cikloalkilo,

(5) -O-$C_{1-6}$alkilo,

(6) -O(C=O)-$C_{1-6}$alkilo,

(7) -NH-$C_{1-6}$alkilo,

(8) fenilo,

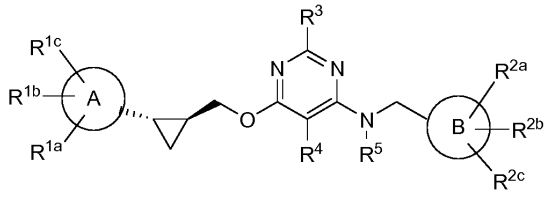
(9) heteroarilo,

(10) -$CO_2H$, ir

(11) -CN;

arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

2. Junginys pagal 1 punktą, kurio formulė Ia:



Ia

arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

3. Junginys pagal 1 punktą, arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur A yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:

(1) piridilo,

(2) chinolinilo, ir

(3) naftiridinilo.

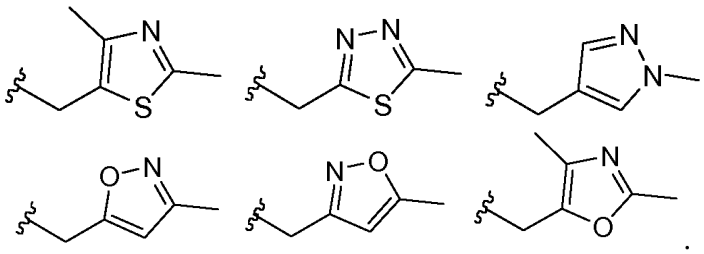
4. Junginys pagal 1 punktą, arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur B yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:

(1) tiazolilo,

(2) pirazolilo, ir

(3) tiadiazolilo.

5. Junginys pagal 1 punktą, arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur B yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:



6. Junginys pagal 1 punktą, arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur $R^{1a}$, $R^{1b}$, $R^{1c}$ yra parinkti iš grupės, susidedančios iš:

(1) $C_{1-6}$alkilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas halogenu arba hidroksilu,

(2) -O-$C_{1-6}$alkilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas halogenu arba hidroksilu,

(3) fenilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas halogenu, hidroksilu,-$NH_2$, -NH-$C_{1-6}$alkilu arba -N($C_{1-6}$alkil)($C_{1-6}$alkil), -O-$C_{1-6}$alkilo arba $C_{1-6}$alkilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas fluoru,

(4) heteroarilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas halogenu, hidroksilu, -$NH_2$, -NH-$C_{1-6}$alkil, arba -N($C_{1-6}$alkil)($C_{1-6}$alkil), -O-$C_{1-6}$alkil arba $C_{1-6}$alkil, kuris yra nepakeistas arba pakeistas fluoru,

(5) -O-fenilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas halogenu, hidroksilu, -$NH_2$, -NH-$C_{1-6}$alkilu, arba -N($C_{1-6}$alkil)($C_{1-6}$alkil), -O-$C_{1-6}$alkilu arba $C_{1-6}$alkilu, kuris yra nepakeistas arba pakeistas fluoru, ir

(6) -O-heteroarilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas halogenu, hidroksilu, -$NH_2$, -NH-$C_{1-6}$alkilu, arba -N($C_{1-6}$alkil)($C_{1-6}$alkil), -O-$C_{1-6}$alkilu arba $C_{1-6}$alkilu, kuris yra nepakeistas arba pakeistas fluoru.

7. Junginys pagal 6 punktą, arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur $R^{1a}$, $R^{1b}$, $R^{1c}$ yra parinkti iš grupės, susidedančios iš:

(1) vandenilio,

(2) chloro,

(3) fluoro,

(4) bromo,

(5) metilo,

(6) metoksi,
(7) (metil)ciklopropilo,
(8) ciklopropilo,
(9) (metoksi)fenilo, ir
(10) (metil)fenilo.

8. Junginys pagal 1 punktą, arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur $R^{2a}$, $R^{2b}$ ir $R^{2c}$ yra neprilausomai parinkti iš grupės, susidedančios iš:
(1) vandenilio,
(2) halogeno,
(3) hidroksilo,
(4) $C_{1-6}$alkilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas halogenu, hidroksilu arba fenilu arba naftilu,
(5) -O-$C_{1-6}$alkilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas halogenu, hidroksilu arba fenilu,
(6) heterociklilo, kur heterociklilas yra parinktas iš imidazolilo, izotiazolilo, oksazolilo, morfolinilo, pirazolilo, piridilo, tetrazolilo ir tiazolilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas halogenu, hidroksilu, $C_{1-6}$alkilu, -$OC_{1-6}$alkilu arba -$NO_2$, ir
(7) fenilo, kuris yra nepakeistas arba pakeistas halogenu, hidroksilu, $C_{1-6}$alkilu, -O-$C_{1-6}$alkilu arba -$NO_2$.

9. Junginys pagal 8 punktą, arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur $R^{2c}$ yra vandenilis ir $R^{2a}$ ir $R^{2b}$ yra nepriklausomai parinkti iš grupės, susidedančios iš:
(1) vandenilio,
(2) chloro,
(3) fluoro,
(4) bromo,
(5) metilo,
(6) ciklopropilo;
(7) izopropoksi,
(8) metoksi, ir
(9) t-butoksi.

10. Junginys pagal 1 punktą, arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur $R^3$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš $CH_3$, $CF_3$, ir $CH_2F$.

11. Junginys pagal 1 punktą, arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur $R^5$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio ir metilo.

12. Junginys pagal 1 punktą, kuris yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:
2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
2-metil-6-{[2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;
2-metil-6-{[(1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;
N-[(2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-il)metil]-2-metil-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-N-[(2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-il)metil]-2-metil-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
N-[(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)metil]-2-metil-6-[(2-chinolin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-N-[(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)metil]-2-metil-6-[(2-chinolin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
N-[(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)metil]-2-metil-6-{[2-(1,5-nafthidrin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
S,S-N-[(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)metil]-2-metil-6-{[2-(1,5-nafthidrin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
N-[(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)metil]-2-metil-6-{[2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
S,S-N-[(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)metil]-2-metil-6-{[2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
N-[(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)metil]-6-{[2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi} - 2-metilpirimidin-4-amino;
S,S-N-[(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)metil]-6-{[2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metilpirimidin-4-amino;
N-[(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)metil]-2-metil-6-[(-2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-N-[(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)metil]-2-metil-6-[(-2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-chinolin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-chinolin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

S,S-2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-chinolin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-{[2-(1,5-nafthidrin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
S,S-2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-{[2-(1,5-nafthidrin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
6-{[2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]pirimidin-4-amino;
S,S-6-{[2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]pirimidin-4-amino;
S,S-2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-{[-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-{[-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
6-{[2-(3-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]pirimidin-4-amino;
6-{[2-(5-fluorpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(-metil-1H-pirazol-4-il)metil]pirimidin-4-amino;
S,S-6-{[2-(5-fluorpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(-metil-1H-pirazol-4-il)metil]pirimidin-4-amino;
6-({2-[5-(fluormetil)piridin-2-il]ciklopropil}metoksi)-2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]pirimidin-4-amino;
6-({2-[5-(difluormetil)piridin-2-il]ciklopropil}metoksi)-2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]pirimidin-4-amino;
2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-({2-[5-(trifluormetil)piridin-2-il]ciklopropil}metoksi)pirimidin-4-amino;
2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-{[2-(1,3-tiazol-4-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
2-metil-N-[(2-metil-1,3-tiazol-5-il)metil]-6-[(2-chinolin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-2-metil-N-[(2-metil-1,3-tiazol-5-il)metil]-6-[(2-chinolin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
2-metil-N-[(2-metil-1,3-tiazol-5-il)metil]-6-{[2-(1,5-nafthidrin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
S,S-2-metil-N-[(2-metil-1,3-tiazol-5-il)metil]-6-{[2-(1,5-nafthidrin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
2-metil-6-{[2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(2-metil-1,3-tiazol-5-il)metil]pirimidin-4-amino;
S,S-2-metil-6-{[2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(2-metil-1,3-tiazol-5-il)metil]pirimidin-4-amino;
6-{[2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(2-metil-1,3-tiazol-5-il)metil]pirimidin-4-amino;
S,S-6-{[2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(2-metil-1,3-tiazol-5-il)metil]pirimidin-4-amino;
2-metil-N-[(2-metil-1,3-tiazol-5-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-2-metil-N-[(2-metil-1,3-tiazol-5-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
2-metil-N-[(2-metil-1,3-tiazol-5-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-2-metil-N-[(2-metil-1,3-tiazol-5-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-[(2-chinolin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-[(2-chinolin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[2-(1,5-nafthidrin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
S,S-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[2-(1,5-nafthidrin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
6-{[2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;
S,S-6-{[2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;
2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
6-{[2-(5-fluorpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;
S,S-6-{[2-(5-fluorpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;
6-({2-[5-(fluormetil)piridin-2-il]ciklopropil}metoksi)-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;
6-({2-[5-(difluormetil)piridin-2-il]ciklopropil}metoksi)-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;
2-metil-6-{[2-(6-metilpiridazin-3-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;
S,S-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[2-(2-metil-1,3-tiazol-4-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
2-metil-6-{[2-(2-metil-1,3-oksazol-4-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;
2-metil-6-{[2-(-metil-1H-pirazol-3-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;
N-[(5-ciklopropil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-2-metil-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-N-[(5-ciklopropil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-2-metil-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
N-[(2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-N-[(2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-[(2-chinolin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-[(2-chinolin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[2-(1,5-nafthidrin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
S,S-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[2-(1,5-nafthidrin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;
6-{[2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;
S,S-6-{[2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;
6-{[2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

S,S-6-{[2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

S,S-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-2,4-diamino;

S,S-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-2,4-diamino;

2-metoksi-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

S,S-2-metoksi-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

2,5-dimetil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

S,S-2,5-dimetil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

N-[(2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-il)metil]-2,5-dimetil-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

S,S-N-[(2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-il)metil]-2,5-dimetil-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

N-6-{[2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-2-(trifluormetil)pirimidin-4-amino;

S,S-N-6-{[2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-2-(trifluormetil)pirimidin-4-amino;

6-{[2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-2-(trifluormetil)pirimidin-4-amino;

S,S-6-{[2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-2-(trifluormetil)pirimidin-4-amino;

N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]-2-(trifluormetil)pirimidin-4-amino;

S,S-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]-2-(trifluormetil)pirimidin-4-amino;

N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]-2-(trifluormetil)pirimidin-4-amino;

S,S-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]-2-(trifluormetil)pirimidin-4-amino;

6-{[2-(5,6-dihidro-4H-pirolo[1,2-b]pirazol-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

6-{[(1S,2S)-2-(5,6-dihidro-4H-pirolo[1,2-b]pirazol-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

6-{[2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-2,4-diamino;

S,S-6-{[(1S,2S)-2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-2,4-diamino;

2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[2-pirazolo[1,5-a]pirimidin-2-ilciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;

2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[(1S,2S)-2-pirazolo[1,5-a]pirimidin-2-ilciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;

2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[2-pirazolo[1,5-a]pirimidin-5-ilciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;

2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-[(1S,2S)-2-pirazolo[1,5-a]pirimidin-5-ilciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;

6-{[2-(5-brompiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

S,S-6-{[(1S,2S)-2-(5-brompiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

2-metil-6-{[2-(2-metilimidazo[1,2-b]piridazin-6-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

2-metil-6-{[(1S,2S)-2-(2-metilimidazo[1,2-b]piridazin-6-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

5-chlor-2-metil-6-{[2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

S,S-5-chloro-2-metil-6-{[(1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

2-etil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

N-[(2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-il)metil]-5-fluor-2-metil-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

S,S-N-[(2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-il)metil]-5-fluor-2-metil-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

N-[(2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-il)metil]-5-fluor-2-metil-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

S,S-N-[(2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-il)metil]-5-fluor-2-metil-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

5-fluor-2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(-2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

S,S-5-fluor-2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(-2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

5-fluoro-2-metil-6-{[2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

S,S-5-fluor-2-metil-6-{[2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

2-(fluormetil)-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilcikliopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-2-(fluormetil)-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilcikliopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
N -[(2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-il)metil]-2-etil-6-[(2-piridin-2-ilcikliopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-N -[(2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-il)metil]-2-etil-6-[(2-piridin-2-ilcikliopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
2-etil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilcikliopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-2-etil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilcikliopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
2-ciklopropil-N-[(2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilcikliopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-2-ciklopropil-N-[(2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilcikliopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
2-ciklopropil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilcikliopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
S,S-2-ciklopropil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilcikliopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;
5-fluor-6-{[2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-2,4-diamino;
5-fluor-6-{[(1S,2S)-2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-2,4-diamino;
5-fluor-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[2-(1,5-nafthidrin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-2,4-diamino;
5-fluor-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[(1S,2S)-2-(1,5-nafthidrin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-2,4-diamino;
5-fluor-6-{[2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-2,4-diamino;
5-fluor-6-{[(1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-2,4-diamino;
5-fluor-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[2-piridin-2-ilcikliopropil]metoksi}pirimidin-2,4-diamino;
5-fluor-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[(1S,2S)-2-piridin-2-ilcikliopropil]metoksi}pirimidin-2,4-diamino;
5-fluor-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[2-piridin-2-ilcikliopropil]metoksi}pirimidin-2,4-diamino;
5-fluor-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[(1S,2S)-2-piridin-2-ilcikliopropil]metoksi}pirimidin-2,4-diamino;
N-4-(2,4-dimetoksibenzil)-5-fluor-6-{[2-piridin-2-ilcikliopropil]metoksi}pirimidin-2,4-diamino;
N-4-(2,4-dimetoksibenzil)-5-fluor-6-{[(1S,2S)-2-piridin-2-ilcikliopropil]metoksi}pirimidin-2,4-diamino;
6-{[2-(5-chlorpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-5-fluor-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-2,4-diamino;
6-{[(1S,2S)-2-(5-chlorpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-5-fluor-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-2,4-diamino;
5-fluor-6-{[2-(5-fluoropiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-2,4-diamino;
5-fluor-6-{[(1S,2S)-2-(5-fluorpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-2,4-diamino;
5-chlor-6-{[2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-2,4-diamino;
5-chlor-6-{[(1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-2,4-diamino;
6-{[2-(4,5-dimetilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-2,4-diamino;
6-{[(1S,2S)-2-(4,5-dimetilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-2,4-diamino;
6-((2-(5,6-dihidro-4H-pirolo[1,2-b]pirazol-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)pirimidin-2,4-diamino;
6-(((1S,2S)-2-(5,6-dihidro-4H-pirolo[1,2-b]pirazol-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)pirimidin-2,4-diamino;
5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)-6-((2-(6-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-2,4-diamino;
5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)-6-(((1S,2S)-2-(6-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-2,4-diamino;
6-((2-(6,7-dihidro-5H-ciklopenta[b]piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)pirimidin-2,4-diamino;
S,S-6-(((1S,2S)-2-(6,7-dihidro-5H-ciklopenta[b]piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)pirimidin-2,4-diamino;
6-((2-(6,7-dihidro-5H-ciklopenta[b]piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)pirimidin-2,4-diamino;
S,S-6-(((1S,2S)-2-(6,7-dihidro-5H-ciklopenta[b]piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)pirimidin-2,4-diamino;
6-((2-(6,7-dihidro-5H-ciklopenta[b]piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)pirimidin-2,4-diamino;
S,S-6-(((1S,2S)-2-(6,7-dihidro-5H-ciklopenta[b]piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)pirimidin-2,4-diamino;

6-((2-(6,7-dihidro-5H-ciklopenta[b]piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil) pirimidin-2,4-diamino;

S,S-6-(((1S,2S)-2-(6,7-dihidro-5H-ciklopenta[b]piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)pirimidin-2,4-diamino;

6-((2-(6,7-dihidro-5H-ciklopenta[b]piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil) pirimidin-2,4-diamino;

S,S-6-(((1S,2S)-2-(6,7-dihidro-5H-ciklopenta[b]piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)pirimidin-2,4-diamino;

6-((2-(6,7-dihidro-5H-ciklopenta[b]piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil) pirimidin-2,4-diamino;

S,S-6-(((1S,2S)-2-(6,7-dihidro-5H-ciklopenta[b]piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)pirimidin-2,4-diamino;

6-((2-(6,7-dihidro-5H-ciklopenta[b]piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol2-il)metil) pirimidin-2,4-diamino;

S,S-6-(((1S,2S)-2-(6,7-dihidro-5H-ciklopenta[b]piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-5-fluor-N4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)pirimidin-2,4-diamino;

5-bromo-N-((2,4-dimetiltiazol-5-il)metil)-2-metil-6-((2-(piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-4-amino;

4-((2,4-dimetiltiazol-5-il)metilamino)-2-metil-6-((2-(piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-5-karbonitrilo;

2-metil-4-((1-metil-1H-pirazol-4-il)metilamino)-6-((2-(piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-5-karbonitrilo;

4-((1-metil-1H-pirazol-4-il)metilamino)-6-((2-(piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-pirimidin-2-karboksamido;

4-((1-metil-1H-pirazol-4-il)metilamino)-6-((2-(piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-pirimidin-2-karbonitrilo;

2-metil-N-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)-6-((2-(5-(tiazol-4-il)piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-4-amino;

6-{[2-(2,3'-bipiridin-6'-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-({2-[5-(1,3-tiazol-5-il)piridin-2-il]ciklopropil}metoksi)pirimidin-4-amino;

6-{[2-(3,4'-bipiridin-6-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-({2-[5-(1,3-tiazol-2-il)piridin-2-il]ciklopropil}metoksi)pirimidin-4-amino;

6-{[2-(3,3'-bipiridin-6-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[2-(5-piridazin-4-ilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-amino;

6-((2-(5-etilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-2-metil-N-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)pirimidin-4-amino;

6-{[2-(5-ciklopropilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-amino;

6-((2-(5-(1H-pirazol-1-il)piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-2-metil-N-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)pirimidin-4-amino;

6-(2-((2-metil-6-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metilamino)pirimidin-4-iloxy)metil)ciklopropil)nikotinonitrilo;

2-metil-N-((5-metilizoksazol-3-il)metil)-6-((2-(piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-pirimidin-4-amino;

N-[(2-fluor-5-metilpiridin-3-il)metil]-2-metil-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

S,S-N-(izotiazol-5-ilmetil)-2-metil-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

2-metil-N-[(5-metilpirazin-2-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]pirimidin-4-amino;

2-metil-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]-N-(pirimidin-5-ilmetil)pirimidin-4-amino;

2-metil-6-((2-(piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-N-(piridin-4-ilmetil)pirimidin-4-amino;

2-metil-6-[(2-piridin-2-ilciklopropil)metoksi]-N-(piridin-3-ilmetil)pirimidin-4-amino;

2-metil-N-((3-metilpiridin-4-il)metil)-6-((2-(piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-4-amino;

6-(2-((2-metil-6-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metilamino)pirimidin-4-iloksi)metil)ciklopropil)piridino;

2-amino-4-{[(1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-6-{[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]amino}pirimidin-5-karbonitrilo;

2-amino-4-{[(1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-6-{[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]amino}pirimidin-5-karbonitrilo; ir

S,S-2-amino-4-{[(1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-6-{[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]amino} pirimidin-5-karbonitrilo; ir

2-amino-4-{[(1S,2S)-2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-6-{[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]amino} pirimidin-5-karbonitrilo;

S,S-2-amino-4-{[(1S,2S)-2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-6-{[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]amino} pirimidin-5-karbonitrilo;

N-metoksi-N-metil-5-((2-metil-6-(((1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-4-ilamino)metil)-1,3,4-tiadiazol-2-karboksamido;

1-(5-((2-metil-6-(((1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-4-ilamino)metil)-1,3,4-tiadiazol-2-il)

etanono;
1-(5-((2-metil-6-(((1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-4-ilamino)metil)-1,3,4-tiadiazol-2-il) etanolio;
4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metilamino)-6-(((1R,2R)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-2-karboksirūgšties;
etil 4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metilamino)-6-(((1R,2R)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-2-karboksilato;
2-(5-((2-metil-6-(((1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-4-ilamino)metil)-1,3,4-tiadiazol-2-il) propan-2-olio;
2-(6-((1S,2S)-2-((2-metil-6-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metilamino)pirimidin-4-iloksi)metil)ciklopropil)piridin-3-il) propan-2-olio;
metil 5-((2-metil-6-(((1 S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-4-ilamino)metil)-1,3,4-tiadiazol-2-karbksilato;
5-((2-metil-6-(((1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-4-ilamino)metil)-1,3,4-tiadiazol-2-karbonitrilo;
5-((2-metil-6-(((1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-4-ilamino)metil)-1,3,4-tiadiazol-2-karboksamido;
6-(((1S,3S)-2-tret-butoksi-3-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-2-metil-N-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil) pirimidin-4-amino;
2-etil-N-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)-6-(((1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-4-amino;
2-(4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metilamino)-6-(((1R,2R)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-2-il) propan-2-olio;
N-((5-tret-butil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)-2-metil-6-(((1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-4-amino;
1-(4-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metilamino)-6-(((1R,2R)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-2-il) etanono;
2-metil-N-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)-6-(((1R,2R)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-4-amino;
1-(5-((2-metil-6-(((1 S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-4-ilamino)metil)-1,3,4-tiadiazol-2-il) etanolio;
2-chlor-N-((5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil)-6-(((1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil)metoksi)pirimidin-4-amino;
arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

13. Junginys pagal 12 punktą, kuris yra 2-metil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilcikliopropil)metoksi] pirimidin-4-aminas arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

14. Junginys pagal 12 punktą, kuris yra 2-metil-6-{[(1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-aminas arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

15. Junginys pagal 12 punktą, kuris yra S,S-*N*-[(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)metil]-2-metil-6-[(2-chinolin-2-ilcikliopropil) metoksi]pirimidin-4-aminas arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

16. Junginys pagal 12 punktą, kuris yra S,S-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]-6-{[2-(1,5-nafthidrin-2-il) ciklopropil]metoksi}pirimidin-4-aminas arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

17. Junginys pagal 12 punktą, kuris yra S,S-6-{[(1S,2S)-2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidine-2,4-diaminas arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

18. Junginys pagal 12 punktą, kuris yra 2-etil-N-[(1-metil-1H-pirazol-4-il)metil]-6-[(2-piridin-2-ilcikliopropil)metoksi] pirimidin-4-aminas arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

19. Junginys pagal 12 punktą, kuris yra 5-fluor-6-{[(1S,2S)-2-(5-metoksipiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-N-4-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-2,4-diaminas arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

20. Junginys pagal 12 punktą, kuris yra 6-{[2-(3,3'-bipiridin-6-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-aminas arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

21. Junginys pagal 12 punktą, kuris yra 6-{[2-(5-ciklopropilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-2-metil-N-[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]pirimidin-4-aminas arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

22. Junginys pagal 12 punktą, kuris yra 2-metil-N-((5-metilizoksazol-3-il)metil)-6-((2-(piridin-2-il)ciklopropil)metoksi)-pirimidin-4-aminas arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

23. Junginys pagal 12 punktą, kuris yra 2-amino-4-{[(1S,2S)-2-(5-metilpiridin-2-il)ciklopropil]metoksi}-6-{[(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]amino}pirimidin-5-karbonitrilas arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

24. Farmacinė kompozicija, kuri apima farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį ir junginį pagal bet kurį ankstesnį punktą arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską.

25. Junginys pagal bet kurį iš 1-23 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirtas panaudoti medicinoje.

26. Panaudojimas junginio pagal bet kurį iš 1-23 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos gamyboje vaisto, skirto gydymui sutrikimo, parinkto iš psichotinio sutrikimo, manijos sutrikimo ir vaistų indukuotos psichozės; nerimo sutrikimo, judėjimo sutrikimo, nuotaikos sutrikimo ir neurodegeneracinio sutrikimo.

27. Junginys pagal bet kurį iš 1-23 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirtas panaudoti gydyme neurologinio arba psichiatrinio sutrikimo, susijusio su PDE10 disfunkcija žinduolyje paciente, kuriam to reikia.

28. Junginys pagal bet kurį iš 1-23 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirtas panaudoti gydyme neurologinio arba psichiatrinio sutrikimo, susijusio su dryžuotojo kūno hipofunkcija arba smegenų pusrutulių pamato mazgų disfunkcija žinduolyje paciente, kuriam to reikia.

29. Junginys pagal bet kurį iš 1-23 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirtas panaudoti gydyme žinduolyje paciente, kuriam to reikia.

---

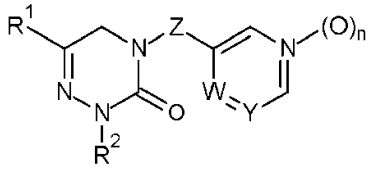
*(51)* Int.Cl. ***C07D 401/12*** (2006.01)
***C07D 401/14*** (2006.01)
***C07D 403/12*** (2006.01)
***C07D 403/14*** (2006.01)
***C07D 405/14*** (2006.01)
***C07D 413/14*** (2006.01)
***A01N 43/707*** (2006.01)
*(11)* **2785708**
*(96)* 12787459.2
*(96)* 2012-11-20
*(97)* 2014-10-08
*(97)* 2016-03-23
*(86)* PCT/EP2012/073032
*(86)* 2012-11-20
*(87)* WO 2013/079350
*(87)* 2013-06-06
*(30)* 11191056, 2011-11-29, EP
*(72)* RENDLER, Sebastian, CH
SCHAETZER, Jürgen Harry, CH
HACHISU, Shuji, CH
MAIENFISCH, Peter, CH
PITTERNA, Thomas, CH
JACOP, Olivier, CH
CASSAYRE, Jérome Yves, CH
*(73)* Syngenta Participations AG, 4058 Basel, CH

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

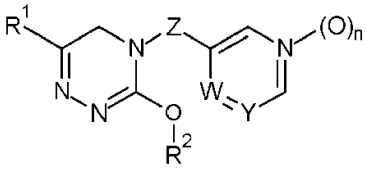
*(54)* Insekticidiniai triazinono dariniai

Apibrėžties punktai: 19, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Junginiai, kurių formulė I arba I’:



(I)



(I’)

kur

$R^2$ yra vandenilis, formilas, $C_1$-$C_6$-alkilas, $C_1$-$C_3$-halogenalkilas, $C_1$-$C_3$-alkoksi , $C_1$-$C_3$-halogenalkoksi, $C_1$-$C_6$-alkoksi$C_1$-$C_3$-alkilas, $C_1$-$C_6$-alkoksi$C_1$-$C_3$-alkoksi$C_1$-$C_3$-alkilas, $C_2$-$C_6$-alkinilas, $C_1$-$C_4$-cianoalkilas, $C_2$-$C_6$-alkenilas, fenil$C_1$-$C_4$-alkilas, $C_1$-$C_6$-alkilkarbonilas, $C_1$-$C_6$-halogenalkilkarbonilas, $C_1$-$C_6$-alkoksikarbonilas, $C_1$-$C_4$-alkoksikarbonil$C_1$-$C_4$-alkilas, fenil$C_1$-$C_5$-alkilkarbonilas, fenil$C_1$-$C_5$-alkoksikarbonilas, heteroarilkarbonilas, fenilkarbonilas, $C_1$-$C_6$-alkilsulfonilas, fenilsulfonilas, $C_3$-$C_6$-cikloalkilkarbonilas, kur žiedo metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O arba S, $C_3$-$C_6$-cikloalkoksikarbonilas, kur žiedo metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O arba S, $C_3$-$C_6$-cikloalkil$C_1$-$C_4$-alkilkarbonilas, kur žiedo arba grandinės metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O arba S, $C_1$-$C_6$-alkoksi$C_1$-$C_6$-alkoksikarbonilas;

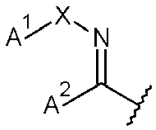
Y yra N arba C-$R^3$, kur $R^3$ yra vandenilis, hidroksi, $C_1$-$C_4$-alkoksi , $C_2$-$C_6$-alkenilas, $C_2$-$C_6$-alkinilas, $C_3$-$C_6$-cikloalkilas, kur žiedo metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O arba S, $C_3$-$C_6$-cikloalkil$C_1$-$C_4$-alkilas, kur žiedo arba grandinės metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O arba S, halogenas, ciano arba nitro, $C_1$-$C_3$-halogenalkiltio, $C_1$-$C_3$-halogenalkilsulfenilas, $C_1$-$C_3$-halogenalkilsulfonilas arba $C_1$-$C_3$-halogenalkoksi;

W yra C-H arba N;

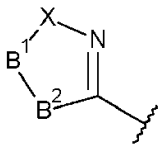
n yra 0 arba 1;

Z yra -N=CH- arba -$NR^4$-$CH_2$- , kur $R^4$ yra vandenilis, formilas, $C_1$-$C_6$-alkilas, $C_1$-$C_6$-alkilkarbonilas, $C_1$-$C_6$-halogenalkilkarbonilas, $C_1$-$C_6$-alkoksikarbonilas, $C_2$-$C_6$-alkeniloksikarbonilas, $C_2$-$C_6$-alkinilas, $C_2$-$C_6$-alkenilas arba fenil$C_1$-$C_5$-alkiloksikarbonilas;

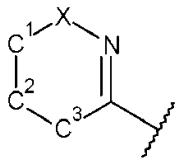
$R^1$ yra bet kuris $Q^1$, $Q^2$ arba $Q^3$



($Q^1$)



($Q^2$)



($Q^3$)

kur

X yra O, S arba $NR^5$, kur $R^5$ yra vandenilis, $C_1$-$C_6$-alkilas, $C_1$-$C_6$-halogenalkilas,

$A^1$ yra vandenilis, $C_1$-$C_6$-alkilas, $C_1$-$C_3$-halogenalkilas, $C_2$-$C_6$-alkinilas, $C_1$-$C_4$-cianoalkilas, $C_2$-$C_6$-alkenilas, fenil$C_1$-$C_4$-alkilas, heteroaril$C_1$-$C_4$-alkilas, fenilas, heteroarilas, $C_1$-$C_6$-alkilkarbonilas, $C_1$-$C_6$-halogenalkilkarbonilas, $C_1$-$C_6$-alkoksikarbonilas, fenil$C_1$-$C_5$-alkilkarbonilas, fenilkarbonilas, $C_1$-$C_6$-alkilsulfonilas, fenilsulfonilas, $C_3$-$C_6$-cikloalkilas, kur žiedo metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O arba S, $C_3$-$C_6$-cikloalkil$C_1$-$C_4$-alkilas, kur žiedo arba grandinės metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O arba S, $C_3$-$C_6$-cikloalkilkarbonilas, kur žiedo metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O arba S, arba $C_3$-$C_6$-cikloalkil$C_1$-$C_4$-alkilkarbonilas, kur žiedo arba grandinės metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O arba S;

$A^2$ yra vandenilis, $C_1$-$C_6$-alkilas, $C_1$-$C_3$-halogenalkilas, $C_2$-$C_6$-alkinilas, $C_1$-$C_4$-cianoalkilas, $C_2$-$C_6$-alkenilas, fenil$C_1$-$C_4$-alkilas, heteroaril$C_1$-$C_4$-alkilas, fenilas, heteroarilas, $C_3$-$C_6$-cikloalkilas, kur žiedo metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O arba S, $C_3$-$C_6$-cikloalkil$C_1$-$C_4$-alkilas, kur žiedo arba grandinės metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O arba S, $C_1$-$C_6$-alkilamino, $C_1$-$C_6$-di-alkilamino, $C_1$-$C_6$-alkiloksi, hidroksi, amino;

$B^1$ yra $CR^6R^7$ arba C(O), $S(O)_m$, kur m yra 1 arba 2;

$B^2$ yra $CR^8R^9$, O, $NR^{10}$, kur $R^{10}$ yra vandenilis, $C_1$-$C_6$-alkilas, arba $C_1$-$C_6$-halogenalkilas;

$C^1$ yra $CR^{11}R^{12}$, C(O);

$C^2$ yra $CR^{13}R^{14}$;

$C^3$ yra $CR^{15}R^{16}$, O, $NR^{17}$; kur $R^{17}$ yra vandenilis, $C_1$-$C_6$-alkilas arba $C_1$-$C_6$-halogenalkilas,

kur $R^6$, $R^7$, $R^8$, $R^9$, $R^{11}$,$R^{12}$, $R^{13}$, $R^{14}$, $R^{15}$ ir $R^{16}$ kiekvienas nepriklausomai vienas nuo kito yra vandenilis, $C_1$-$C_6$-alkilas, $C_1$-$C_3$-halogenalkilas, fenilas, heteroarilas, $C_3$-$C_6$-cikloalkilas, kur žiedo metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O

arba S, $C_3$-$C_6$-cikloalkil($C_1$-$C_4$)-alkilas, kur žiedo arba grandinės metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O arba S, arba

kur $R^6$, $R^7$, $R^8$, $R^9$, $R^{11}$, $R^{12}$, $R^{13}$, $R^{14}$, $R^{15}$ ir $R^{16}$ sudaro 3-6 narių karbociklą kur žiedo metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O arba S,

kur aukščiau nurodytos fenilo ir heteroarilo grupės nepriklausomai viena nuo kitos nebūtinai gali turėti $C_1$-$C_3$-alkilo, $C_1$-$C_3$-halogenalkilo, $C_1$-$C_3$-alkoksi, $C_1$-$C_3$-halogenalkoksi, $C_1$-$C_3$-alkiltio, $C_1$-$C_3$-alkilsulfinilo, $C_1$-$C_3$-alkilsulfonilo, -halogeno, ciano arba nitro pakaitų,

arba jų tautomerai, kiekvienu atveju laisvoje formoje arba druskos formoje.

2. Junginys pagal 1 punktą, kur $R^2$ yra vandenilis, $C_1$-$C_6$-alkilkarbonilas, $C_1$-$C_6$-alkoksikarbonilas, formilas, fenil$C_1$-$C_5$-alkilkarbonilas, fenil$C_1$-$C_5$-alkoksikarbonilas, fenilkarbonilas, $C_3$-$C_6$-cikloalkilkarbonilas, $C_1$-$C_6$-alkoksi$C_1$-$C_6$-alkoksikarbonilas, optimaliai vandenilis, $C_1$-$C_6$-alkilkarbonilas, $C_1$-$C_6$-alkoksikarbonilas arba formilas, ir visų geriausiai vandenilis, kur aukščiau nurodytos fenilo grupės nepriklausomai viena nuo kitos nebūtinai gali būti pakeista $C_1$-$C_3$-alkilo, $C_1$-$C_3$-halogenalkilo, $C_1$-$C_3$-alkoksi, $C_1$-$C_3$-halogenalkoksi, $C_1$-$C_3$-alkiltio, $C_1$-$C_3$-alkilsulfinilo, $C_1$-$C_3$-alkilsulfonilo, halogeno, ciano arba nitro pakaitų.

3. Junginys pagal 1 punktą, kur Y yra C-H, C-F, N, C-$CF_3$, C-Cl, C-$CH_3$, C-ciklo-Pr arba C-CN, optimaliai C-H, C-F, N, C-$CF_3$ arba C-CN, ir geriausiai C-F, C-H arba N.

4. Junginys pagal 1 punktą, kur W yra C-H.

5. Junginys pagal 1 punktą, kur n yra 0.

6. Junginys pagal 1 punktą, kur Z yra -N=CH- arba -NH-$CH_2$- ir geriausiai -N=CH-.

7. Junginys pagal 1 punktą, kur r $R^1$ yra $Q^1$; X yra O, N-$CH_3$ arba N-H, ir optimaliai O; $A^1$ yra vandenilis, $C_1$-$C_6$-alkilas, $C_1$-$C_3$-halogenalkilas, $C_2$-$C_6$-alkinilas, $C_2$-$C_6$-alkenilas, fenil$C_1$-$C_4$-alkilas, heteroaril$C_1$-$C_4$-alkilas, $C_3$-$C_6$-cikloalkilas, kur žiedo metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O arba S, arba $C_3$-$C_6$-ciklo-alkil$C_1$-$C_4$-alkilas, kur žiedo arba grandinės metileno grupė nebūtinai gali būti pakeista O arba S, ir optimaliai vandenilis, $C_1$-$C_6$-alkilas, $C_1$-$C_3$-halogenalkilas, ir geriausiai $C_1$-$C_6$-alkilas arba $C_1$-$C_3$-halogenalkilas; ir $A^2$ yra vandenilis, $C_1$-$C_6$-alkilas, $C_1$-$C_3$-halogenalkilas, fenilas, heteroarilas arba $C_3$-$C_6$-cikloalkilas, ir optimaliai vandenilis, $C_1$-$C_6$-alkilas, $C_1$-$C_3$-halogenalkilas arba ciklopropilas, ir geriausiai vandenilis arba $C_1$-$C_4$-alkilas, kur aukščiau nurodytos fenilo ir heteroarilo grupės nepriklausomai viena nuo kitos nebūtinai gali turėti $C_1$-$C_3$-alkilo, $C_1$-$C_3$-halogenalkilo, $C_1$-$C_3$-alkoksi, $C_1$-$C_3$-halogenalkoksi, $C_1$-$C_3$-alkiltio, $C_1$-$C_3$-alkilsulfinilo, $C_1$-$C_3$-alkilsulfonilo, halogeno, ciano arba nitro pakaitų.

8. Junginys pagal 1 punktą, kur $R^1$ yra $Q^2$; X yra optimaliai O, N-$CH_3$ arba N-H, ir geriausiai O; $B^1$ yra $CH_2$, $CH(CH_3)$, $CH(CF_3)$, $C(CF_3)(CH_3)$, $C(CH_3)_2$, $C(CF_3)_2$, $C(CH_2)_2$, $S(O)_2$, C(Aril)(H) arba C(Aril)($CH_3$), ir optimaliai $C(CH_3)_2$, $C(CF_3)_2$ arba $CH(CH_3)$, ir geriausiai $C(CH_3)_2$, arba $C(CF_3)_2$; ir $B^2$ yra O, NH, N($CH_3$) arba $CH_2$ ir optimaliai O arba $CH_2$, ir geriausiai $CH_2$.

9. Junginys pagal 1 punktą, kur $R^1$ yra $Q^3$; X yra optimaliai O, N-$CH_3$ arba N-H, ir geriausiai O; $C^1$ yra $CH_2$, C(O), $CH(CH_3)$, $C(CH_3)_2$ arba $C(CH_2)_2$, ir optimaliai C(O) arba $CH_2$ ir geriausiai $CH_2$; $C^2$ yra $CH_2$, $CH(CH_3)$, $C(CH_3)_2$ arba $C(CH_2)_2$, ir geriausiai $CH_2$, arba $C(CH_3)_2$ ir visų geriausiai $CH_2$; ir $C^3$ yra $CH_2$, NH, N($CH_3$) arba O, ir geriausiai $CH_2$ arba O, ir visų geriausiai O.

10. Junginys pagal 1 punktą, kur:

- $R^2$ yra H, $C(O)CH_3$, C(O)Ot-Bu, $C(O)OCH_2Ph$, C(O)OEt, $C(O)O(CH_2)_2OCH_3$, C(O)-izobutilas, C(O)-izopropilas, arba C(O)ciklo-Pr, ir optimaliai H,
- Y yra C-H, C-F, C-Cl, C-Br, C-$CH_3$, C-$CF_3$, C-ciklo-Pr, C-C≡N, C-CH=$CH_2$ arba N, ir optimaliai C-H, C-F arba N,
- W yra C-H arba N,
- n yra 0 arba 1, ir optimaliai 0,
- Z yra N=CH arba NH-$CH_2$,
- $R^1$ yra $Q^1$ kur X yra O, N-Me arba NH, ir optimaliai O; $A^1$ yra H, $CH_3$, etilas, $CH_2CF_3$, tret-butilas, 3,5-$Cl_2C_6H_3$, $CH_2$-2,6-$Cl_2C_6H_3$, ir optimaliai H, $CH_3$, etilas; $A^2$ yra H, $CH_3$, etilas, $CF_3$, t-$C_4H_9$, 3,5-$Cl_2C_6H_3$, optimaliai H arba $CH_3$.

11. Junginys pagal 1 punktą, kur:

- $R^2$ yra H, $C(O)CH_3$, C(O)Ot-Bu, $C(O)OCH_2Ph$, C(O)OEt, $C(O)O(CH_2)_2OCH_3$, C(O)-izobutilas, C(O)-izopropilas, arba C(O)ciklo-Pr, ir optimaliai H,
- Y yra C-H, C-F, C-Cl, C-Br, C-$CH_3$, C-$CF_3$, C-ciklo-Pr, C-C≡N, C-CH=$CH_2$ arba N, ir optimaliai C-H, C-F arba N,
- W yra C-H arba N,

- n yra 0 arba 1, ir optimaliai 0,
- Z yra N=CH arba NH-$CH_2$,
- $R^1$ yra $Q^2$ kur X yra O, N-Me arba NH, ir optimaliai O; $B^1$ yra $CMe_2$, CHMe, $C(CF_3)Me$, $C(CF_3)_2$, $CH(CF_3)$, CH(3,5-$Cl_2C_6H_3$), CH(2,6-$Cl_2C_6H_3$), $C(CF_3)$(3,5-$Cl_2C_6H_3$), $C(CH_2)_2$, ir optimaliai $CMe_2$ arba $C(CF_3)_2$; $B^2$ yra $CH_2$, O arba NH, ir optimaliai $CH_2$.

12. Junginys pagal 1 punktą, kur:
- $R^2$ yra H, $C(O)CH_3$, C(O)Ot-Bu, $C(O)OCH_2Ph$, C(O)OEt, $C(O)O(CH_2)_2OCH_3$, C(O)-izobutilas, C(O)-izopropilas, arba C(O)ciklo-Pr, ir optimaliai H,
- Y yra C-H, C-F, C-Cl, C-Br, C-$CH_3$, C-$CF_3$, C-ciklo-Pr, C-C≡N, C-CH=$CH_2$ arba N, ir optimaliai C-H, C-F arba N,
- W yra C-H arba N,
- n yra 0 arba 1, ir optimaliai 0,
- Z yra N=CH arba NH-$CH_2$,
- $R^1$ yra $Q^3$ kur X yra O, N-Me arba NH, ir optimaliai O; $C^1$ yra $CH_2$ arba C(O); $C^2$ yra $CH_2$, ir $C^3$ yra O, $CH_2$ arba NH.

13. Pesticidinė kompozicija, apimanti bent vieno junginio formulės (I) arba (I') pagal 1 punktą pesticidiškai veiksmingą kiekį.

14. Pesticides kompozicija pagal 13 punktą, kuri papildomai prie apimamo junginio formulės (I) arba (I'), apima kompozicijos adjuvantus.

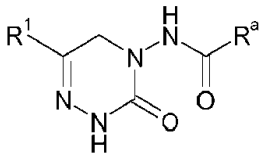
15. Kovos su kenkėjais ir jų kontrolės būdas, išskyrus žmogaus arba gyvūno kūno chirurginį arba terapinį gydymo būdą ir diagnostikos būdus, atliekamus su žmogaus arba gyvūno kūnu, kuriame būde kenkėjams, kenkėjų lokusui, arba augalams, jautriems kenkėjų atakai, taiko junginio formulės (I) arba (I') pagal 1 punktą pesticidiškai veiksmingą kiekį.

16. Kovos su kenkėjais ir jų kontrolės būdas, išskyrus žmogaus arba gyvūno kūno chirurginį arba terapinį gydymo būdą ir diagnostikos būdus, atliekamus su žmogaus arba gyvūno kūno, kuriame būde kenkėjams, kenkėjų lokusui, arba augalams, jautriems kenkėjų atakai taiko pesticidinę kompoziciją pagal 13 punktą.

17. Vabzdžių iš būrio *Hemiptera*, kurie yra atsparūs neonikotinoidiniam insekticidui, naikinimo ir kontrolės būdas, kur būde minėtiems neonikotinoidui atspariems vabzdžiams taiko junginį formulės (I) arba (I') pagal 1 punktą laisvoje formoje arba agrochemiškai priimtinos druskos formoje.

18. Augalų dauginimo medžiaga, apimanti junginį formulės (I) arba (I') pagal 1 punktą.

19. Junginys, kurio formulė (VIIIa):



kur $R^1$ yra kaip nurodyta 1 punkte, ir Ra yra $C_1$-$C_6$-alkilas.

---

*(51)* Int.Cl. ***C07D 401/14*** (2006.01)
***C07D 403/14*** (2006.01)
***A61P 31/12*** (2006.01)
***A61K 31/4025*** (2006.01)
***A61K 31/4178*** (2006.01)
*(11)* **2784075**
*(96)* 14168065.2

*(96)* 2007-08-09
*(97)* 2014-10-01
*(97)* 2016-03-23
*(30)* 836996 P, 2006-08-11, US
835462, 2007-08-08, US
*(72)* Bachand, Carol, CA
Belema, Makonen, US
Deon, Daniel H., CA
Good, Andrew C., US
Goodrich, Jason, US
James, Clint A., CA
Lavoie, Rico, US
Lopez, Omar D., US
Martel, Alain, CA
Meanwell, Nicholas A., US
Nguyen, Van N., US
Romine, Jeffrey Lee, US
Ruediger, Edward H., CA
Snyder, Lawrence B., US
St. Laurent, Denis R., US
Yang, Fukang, US
Langley, David R., US
Wang, Gan, US
Hamann, Lawrence G., US
*(73)* Bristol-Myers Squibb Holdings Ireland, 6312 Steinhausen, CH
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Hepatito C viruso inhibitoriai
Apibrėžties punktai: 7, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Junginys, kuris yra metilo ((1S)-1-(((2S)-2-(5-(4'-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-5-il)-4-bifenilil)-1H-imi-dazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)-2-metilpropil)karbamatas; arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, skirtas naudoti terapijoje.

2. Junginys, skirtas naudoti pagal 1 punktą, kuris yra metilo ((1S)-1-(((2S)-2-(5-(4'-(2-((2S)-1-((2S)-2-((metoksikarbonil)amino)-3-metilbutanoil)-2-pirolidinil)-1 H-imidazol-5-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil) karbonil)-2-metilpropil)karbamato dihidrochloridas.

3. Junginys, skirtas naudoti pagal 1 arba 2 punktą, papildomai apimantis vieno arba dviejų papildomų junginių, pasižyminčių anti-HCV aktyvumu, panaudojimą prieš, po arba vienu metu su junginiu pagal 1 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, arba junginiu pagal 2 punktą.

4. Junginys, skirtas naudoti pagal 3 punktą, kur bent vienas iš papildomų junginių yra interferonas arba ribavirinas.

5. Junginys, skirtas naudoti pagal 4 punktą, kur interferonas yra parinktas iš interferono alfa 2B, pegilinto interferono alfa, konsensuso interferono, interferono alfa 2A, ir limfoblastoidinio interferono tau.

6. Junginys, skirtas naudoti pagal 3 punktą, kur bent vienas iš papildomų junginių yra parinktas iš interleukino 2, interleukino 6, interleukino 12, junginio, kuris sustiprina 1 tipo helperių T ląstelių atsako išsivystymą, interferuojančios RNR, antiprasmės RNR, imikvimodo, ribavirino, inozino 5'-monofosfato dehidrogenazės inhibitoriaus, amantadino ir rimantadino.

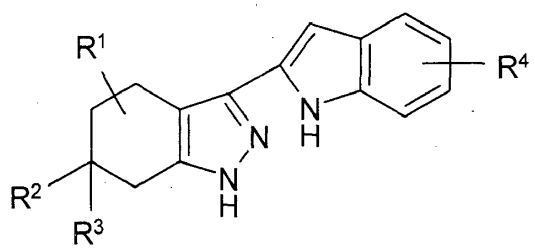
7. Junginys, skirtas naudoti pagal 3 punktą, kur bent vienas iš papildomų junginių yra efektyvus inhibuoti taikinio, parinkto iš HCV metaloproteazės, HCV serino proteazės, HCV polimerazės, HCV helikazės, HCV NS4Bbaltyno, HCV įėjimo, HCV ansambliavimo, HCV išėjimo, HCV NS5A baltymo ir IMPDH, funkciją HCV infekcijos gydymui.

*(51)* Int.Cl. ***C07D 401/14*** (2006.01)
***A61K 31/416*** (2006.01)
***A61K 31/4178*** (2006.01)
***A61K 31/422*** (2006.01)
***A61K 31/427*** (2006.01)
***A61K 31/433*** (2006.01)
***A61K 31/437*** (2006.01)
***A61K 31/4439*** (2006.01)
***A61K 31/454*** (2006.01)
***A61K 31/496*** (2006.01)
***A61K 31/5377*** (2006.01)
***A61K 31/55*** (2006.01)
***A61P 29/00*** (2006.01)
***A61P 37/02*** (2006.01)
***A61P 37/06*** (2006.01)
***A61P 37/08*** (2006.01)
***A61P 43/00*** (2006.01)
***C07D 403/04*** (2006.01)
***C07D 403/14*** (2006.01)
***C07D 405/14*** (2006.01)

*(11)* **2505586**
*(96)* 10833248.7
*(96)* 2010-11-25
*(97)* 2012-10-03
*(97)* 2016-03-02
*(86)* PCT/JP2010/070988
*(86)* 2010-11-25
*(87)* WO 2011/065402
*(87)* 2011-06-03
*(30)* 2009268040, 2009-11-25, JP
*(72)* INOUE, Teruhiko, JP
KAYA, Tetsudo, JP
KIKUCHI, Shinichi, JP
MATSUMURA, Koji, JP
MASUO, Ritsuki, JP
SUZUKI, Motoya, JP
MAEKAWA, Michihide, JP
*(73)* Japan Tobacco, Inc., Tokyo 105-8422, JP
*(74)* Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT

*(54)* Indolo junginys ir jo farmacinis panaudojimas
Apibrėžties punktai: 32, brėžiniai: 0.

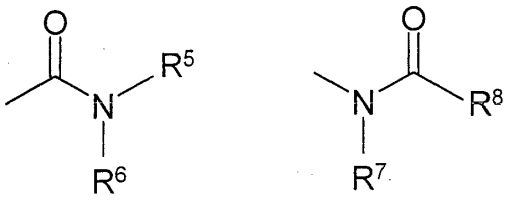
*(57)* 1. Junginys, pavaizduotas šia formule [I]:




[ I ]

kur:
$R^1$ yra:

(1) vandenilio atomas,
(2) hidroksi grupė arba
(3) $C_{1-6}$ alkoksi grupė, pasirinktinai pakeista $C_{6-10}$ arilo grupe(ėmis);
$R^2$ ir $R^3$ yra vienodos arba skirtingos ir kiekviena yra:
(1) vandenilio atomas arba
(2) $C_{1-6}$ alkilo grupė, pasirinktinai pakeista 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) hidroksi grupės ir
(b) $C_{1-6}$ alkoksi grupės; ir
$R^4$ yra grupė, pavaizduota:

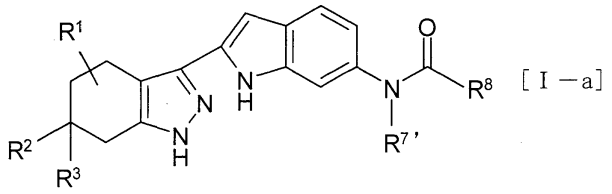


arba

kuri yra prisijungusi indolo žiedo 5-padėtyje arba 6-padėtyje,
kur:
$R^5$ yra:
(1) vandenilio atomas arba
(2) $C_{1-6}$ alkilo grupė ir
$R^6$ yra:
(1) vandenilio atomas,
(2) $C_{1-6}$ alkilo grupė, pasirinktinai pakeista 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) hidroksi grupės,
(b) $C_{1-6}$ alkoksi grupės,
(c) karboksi grupės,
(d) $C_{1-6}$ alkoksi-karbonilo grupės,
(e) $C_{6-10}$ arilo grupės,
(f) $C_{6-10}$ ariloksi grupės,
(g) amino grupės, pasirinktinai mono- arba di-pakeistos $C_{1-6}$ alkilo grupe(ėmis),
(h) 5- arba 6-narės nesočios heterociklinės grupės, pasirinktinai pakeistos $C_{1-6}$ alkilo grupe(ėmis) ir
(i) 5- arba 6-narės sočios heterociklinės grupės,
(3) $C_{1-6}$ alkoksi grupė,
(4) $C_{6-10}$ arilo grupė arba
(5) 5- arba 6-narė nesoti heterociklinė grupė, pasirinktinai pakeista 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) hidroksi grupės ir
(b) $C_{1-6}$ alkoksi grupės arba
$R^5$ ir $R^6$ kartu su azoto atomu, prie kurio jos yra prisijungusios, sudaro 5-arba 6-narį ciklinį aminą (kur minėtas ciklinis aminas pasirinktinai yra kondensuotas su 5- arba 6-nariu nesočiu heterociklu), pasirinktinai pakeistą 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) hidroksi grupės,
(b) $C_{1-6}$ alkilo grupės,
(c) $C_{1-6}$ alkoksi grupės ir
(d) $C_{1-6}$ alkoksi-karbonilo grupės;
$R^7$ yra:
(1) vandenilio atomas arba
(2) $C_{1-6}$ alkilo grupė, pasirinktinai pakeista 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) hidroksi grupės,
(b) $C_{1-6}$ alkoksi grupės ir
(c) amino grupės, pasirinktinai mono- arba di-pakeistos $C_{1-6}$ alkilo grupe(ėmis) ir
$R^8$ yra:
(1) $C_{1-6}$ alkilo grupė, pasirinktinai pakeista 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) hidroksi grupės,

(b) $C_{1-6}$ alkoksi grupės, pasirinktinai pakeistos $C_{6-10}$ arilo grupe(ėmis),
(c) $C_{3-6}$ cikloalkilo grupės, pasirinktinai pakeistos $C_{1-6}$ alkoksi grupe(ėmis),
(d) $C_{6-10}$ arilo grupės,
(e) 5- arba 6-narės nesočios heterociklinės grupės, pasirinktinai pakeistos okso grupe(ėmis),
(f) 5-8-narės sočios heterociklinės grupės, pasirinktinai pakeistos 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(i) hidroksi grupės,
(ii) $C_{1-6}$ alkilo grupės, pasirinktinai pakeistos 1 - 3 pakaitais, parinktais iš hidroksi grupės ir $C_{1-6}$ alkoksi grupės,
(iii) $C_{1-6}$ alkoksi grupės ir
(iv) okso grupės,
(g) $C_{3-6}$ cikloalkiloksi grupės,
(h) $C_{6-10}$ ariloksi grupės,
(i) 5- arba 6-narės nesočios heterocikliloksi grupės,
(j) 5- arba 6-narės sočios heterocikliloksi grupės ir
(k) amino grupės, pasirinktinai mono- arba di-pakeistos pakaitais, parinktais iš:
(i) $C_{1-6}$ alkilo grupės, pasirinktinai pakeistos 1 - 3 pakaitais, parinktais iš hidroksi grupės, karboksi grupės ir karboksi-$C_{1-6}$ alkoksi grupės,
(ii) $C_{1-6}$ alkil-karbonilo grupės, pasirinktinai pakeistos 1 - 3 pakaitais, parinktais iš hidroksi grupės ir $C_{1-6}$ alkoksi grupės,
(iii) $C_{1-6}$ alkoksi-karbonilo grupės, pasirinktinai pakeistos $C_{6-10}$ arilo grupe(ėmis) ir
(iv) $C_{3-6}$ cikloalkil-karbonilo grupės, pasirinktinai pakeistos $C_{1-6}$ alkoksi grupe(ėmis),
(2) $C_{1-6}$ alkoksi grupė, pasirinktinai pakeista $C_{6-10}$ arilo grupe(ėmis),
(3) $C_{3-6}$ cikloalkilo grupė, pasirinktinai pakeista 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) hidroksi grupės ir
(b) $C_{1-6}$ alkoksi grupės,
(4) $C_{6-10}$ arilo grupė, pasirinktinai pakeista $C_{1-6}$ alkilo grupe(ėmis), pasirinktinai pakeista 1 - 3 halogeno atomais,
(5) amino grupė, pasirinktinai mono- arba di-pakeista $C_{1-6}$ alkilo grupe(ėmis), pasirinktinai pakeista $C_{6-10}$ arilo grupe(ėmis),
(6) 5- arba 6-narė nesoti heterociklinė grupė, pasirinktinai pakeista $C_{1-6}$ alkilo grupe(ėmis),
(7) 5- arba 6-narė soti heterociklinė grupė, pasirinktinai pakeista 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) $C_{1-6}$ alkilo grupės,(b) $C_{1-6}$ alkil-karbonilo grupės ir
(c) okso grupės,
(8) $C_{3-6}$ cikloalkiloksi grupė arba
(9) $C_{6-10}$ aril-karbonilo grupė arba
$R^7$ ir $R^8$ kartu su azoto atomu ir anglies atomu, prie kurių jos yra prisijungusios, sudaro 5- arba 6-narį ciklinį aminą, pakeistą okso grupe, ir pasirinktinai papildomai pakeistą 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) hidroksi grupės,
(b) $C_{1-6}$ alkilo grupės, pasirinktinai pakeistos hidroksi grupe(ėmis),
(c) $C_{1-6}$ alkoksi grupės ir
(d) $C_{3-6}$ cikloalkilo grupės,
arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

2. Junginys pagal 1 punktą, pavaizduotas šia formule [I-a]:



[I—a]

kur:
$R^1$ yra:
(1) vandenilio atomas,
(2) hidroksi grupė arba
(3) $C_{1-6}$ alkoksi grupė, pasirinktinai pakeista $C_{6-10}$ arilo grupe(ėmis);
$R^2$ ir $R^3$ yra vienodos arba skirtingos ir kiekviena yra:

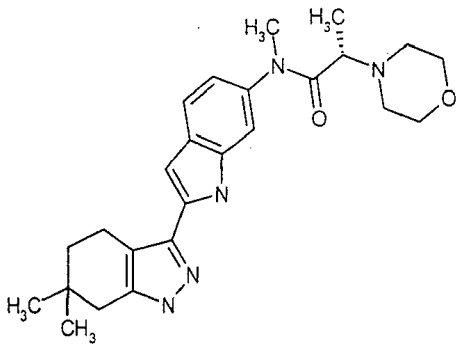
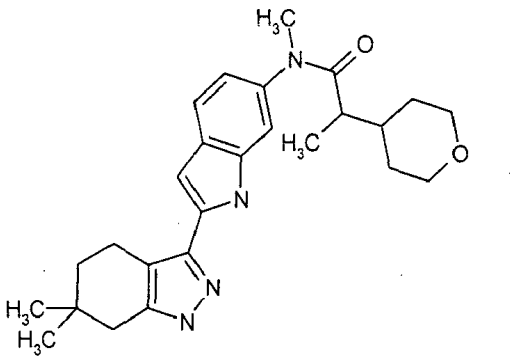
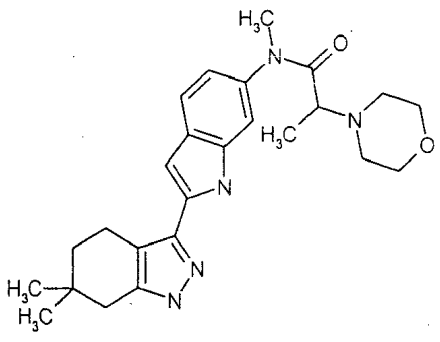
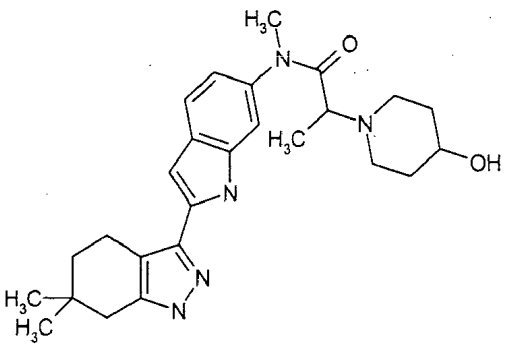
(1) vandenilio atomas arba
(2) $C_{1-6}$ alkilo grupė, pasirinktinai pakeista 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) hidroksi grupės ir
(b) $C_{1-6}$ alkoksi grupės;
$R^{7'}$ yra $C_{1-6}$ alkilo grupė, pasirinktinai pakeista 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) hidroksi grupės,
(b) $C_{1-6}$ alkoksi grupės ir
(c) amino grupės, pasirinktinai mono- arba di-pakeistos $C_{1-6}$ alkilo grupe(ėmis) ir
$R^8$ yra:
(1) $C_{1-6}$ alkilo grupė, pasirinktinai pakeista 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) hidroksi grupės,
(b) $C_{1-6}$ alkoksi grupės, pasirinktinai pakeistos $C_{6-10}$ arilo grupe(ėmis),
(c) $C_{3-6}$ cikloalkilo grupės, pasirinktinai pakeistos $C_{1-6}$ alkoksi grupe(ėmis),
(d) $C_{6-10}$ arilo grupės,
(e) 5- arba 6-narės nesočios heterociklinės grupės, pasirinktinai pakeistos okso grupe(ėmis),
(f) 5-8-narės sočios heterociklinės grupės, pasirinktinai pakeistos 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(i) hidroksi grupės,
(ii) $C_{1-6}$ alkilo grupės, pasirinktinai pakeistos 1 - 3 pakaitais, parinktais iš hidroksi grupės ir $C_{1-6}$ alkoksi grupės,
(iii) $C_{1-6}$ alkoksi grupės ir
(iv) okso grupės,
(g) $C_{3-6}$ cikloalkiloksi grupės,
(h) $C_{6-10}$ ariloksi grupės,
(i) 5- arba 6-narės nesočios heterocikliloksi grupės,
(j) 5- arba 6-narės sočios heterocikliloksi grupės ir
(k) amino grupės, pasirinktinai mono- arba di-pakeistos pakaitais, parinktais iš:
(i) $C_{1-6}$ alkilo grupės, pasirinktinai pakeistos 1 - 3 pakaitais, parinktais iš hidroksi grupės, karboksi grupės ir karboksi-$C_{1-6}$ alkoksi grupės,
(ii) $C_{1-6}$ alkil-karbonilo grupės, pasirinktinai pakeistos 1 - 3 pakaitais, parinktais iš hidroksi grupės ir $C_{1-6}$ alkoksi grupės,
(iii) $C_{1-6}$ alkoksi-karbonilo grupės, pasirinktinai pakeistos $C_{6-10}$ arilo grupe(ėmis) ir
(iv) $C_{3-6}$ cikloalkil-karbonilo grupės, pasirinktinai pakeistos $C_{1-6}$ alkoksi grupe(ėmis),
(2) $C_{1-6}$ alkoksi grupė, pasirinktinai pakeista $C_{6-10}$ arilo grupe(ėmis),
(3) $C_{3-6}$ cikloalkilo grupė, pasirinktinai pakeista 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) hidroksi grupės ir
(b) $C_{1-6}$ alkoksi grupės,
(4) $C_{6-10}$ arilo grupė, pasirinktinai pakeista $C_{1-6}$ alkilo grupe(ėmis), pasirinktinai pakeista 1 - 3 halogeno atomais,
(5) amino grupė, pasirinktinai mono- arba di-pakeista $C_{1-6}$ alkilo grupe(ėmis), pasirinktinai pakeista $C_{6-10}$ arilo grupe(ėmis),
(6) 5- arba 6-narė nesoti heterociklinė grupė, pasirinktinai pakeista $C_{1-6}$ alkilo grupe(ėmis),
(7) 5- arba 6-narė soti heterociklinė grupė, pasirinktinai pakeista 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) $C_{1-6}$ alkilo grupės,
(b) $C_{1-6}$ alkil-karbonilo grupės ir
(c) okso grupės,
(8) $C_{3-6}$ cikloalkiloksi grupės arba
(9) $C_{6-10}$ aril-karbonilo grupės arba
$R^{7'}$ ir $R^8$ kartu su azoto atomu ir anglies atomu, prie kurių jos yra prisijungusios, sudaro 5- arba 6-narį ciklinį aminą, pakeistą okso grupe ir pasirinktinai papildomai pakeistą 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) hidroksi grupės,
(b) $C_{1-6}$ alkilo grupės, pasirinktinai pakeistos hidroksi grupe(ėmis),
(c) $C_{1-6}$ alkoksi grupės ir
(d) $C_{3-6}$ cikloalkilo grupės,
arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

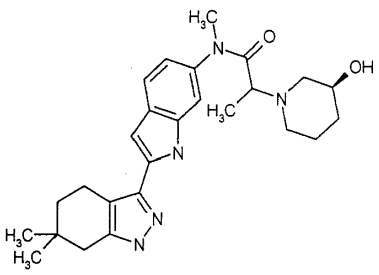
3. Junginys pagal 2 punktą, kur;
$R^1$ yra vandenilio atomas; ir

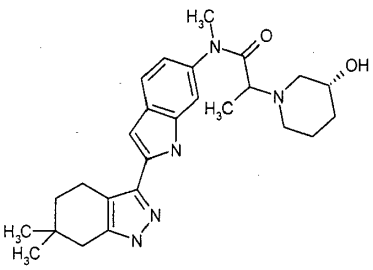
$R^2$ ir $R^3$ yra vienodos arba skirtingos ir kiekviena yra $C_{1-6}$ alkilo grupė,
arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

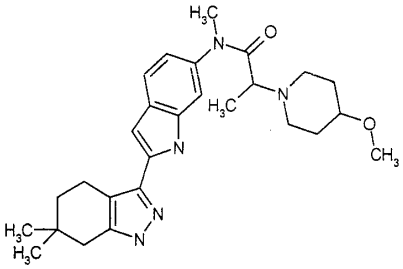
4. Junginys pagal 3 punktą, kur:
$R^{7'}$ yra $C_{1-6}$ alkilo grupė; ir
$R^8$ yra $C_{1-6}$ alkilo grupė, pakeista 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(a) hidroksi grupės,
(b) $C_{1-6}$ alkoksi grupės, pasirinktinai pakeistos $C_{6-10}$ arilo grupe(ėmis),
(c) $C_{3-6}$ cikloalkilo grupės, pasirinktinai pakeistos $C_{1-6}$ alkoksi grupe(ėmis),
(d) $C_{6-10}$ arilo grupės,
(e) 5- arba 6-narės nesočios heterociklinės grupės, pasirinktinai pakeistos okso grupe(ėmis),
(f) 5-8-narės sočios heterociklinės grupės, pasirinktinai pakeistos 1 - 3 pakaitais, parinktais iš:
(i) hidroksi grupės,
(ii) $C_{1-6}$ alkilo grupės, pasirinktinai pakeistos 1 - 3 pakaitais, parinktais iš hidroksi grupės ir $C_{1-6}$ alkoksi grupės,
(iii) $C_{1-6}$ alkoksi grupės ir
(iv) okso grupės,
(g) $C_{3-6}$ cikloalkiloksi grupės,
(h) $C_{6-10}$ ariloksi grupės,
(i) 5- arba 6-narės nesočios heterocikliloksi grupės,
(j) 5- arba 6-narės sočios heterocikliloksi grupės ir
(k) amino grupės, pasirinktinai mono- arba di-pakeistos pakaitais, parinktais iš:
(i) $C_{1-6}$ alkilo grupės, pasirinktinai pakeistos 1 - 3 pakaitais, parinktais iš hidroksi grupės, karboksi grupės ir karboksi-$C_{1-6}$ alkoksi grupės,
(ii) $C_{1-6}$ alkil-karbonilo grupės, pasirinktinai pakeistos 1 - 3 pakaitais, parinktais iš hidroksi grupės ir $C_{1-6}$ alkoksi grupės,
(iii) $C_{1-6}$ alkoksi-karbonilo grupės, pasirinktinai pakeistos $C_{6-10}$ arilo grupe(ėmis) ir
(iv) $C_{3-6}$ cikloalkil-karbonilo grupės, pasirinktinai pakeistos $C_{1-6}$ alkoksi grupe(ėmis),
arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

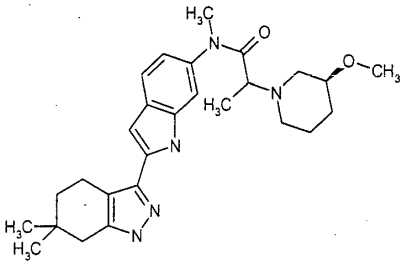
5. Junginys pagal 1 punktą, parinktas iš šių formulių:

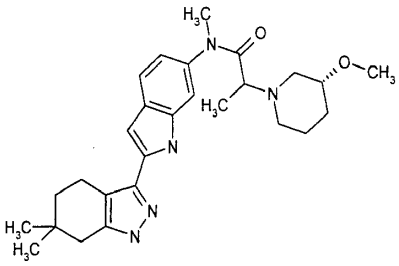





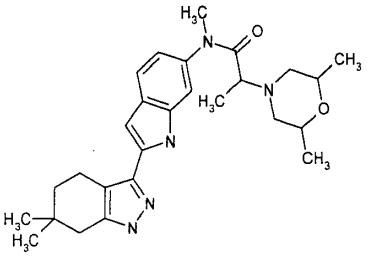


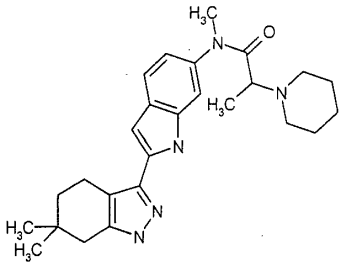


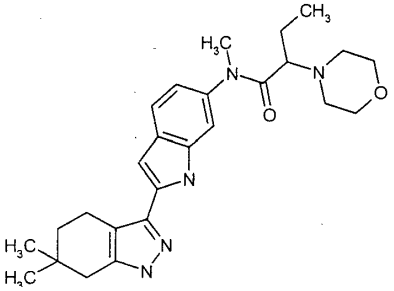


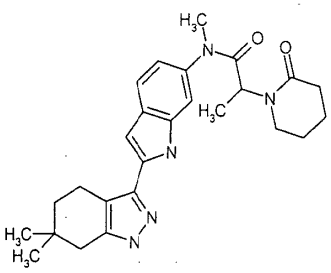


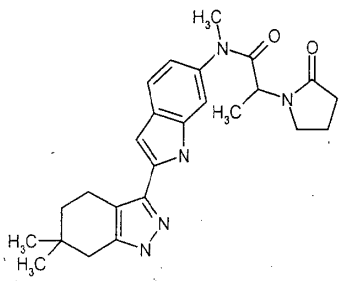


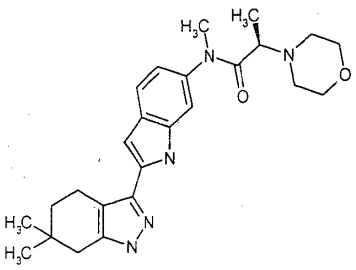


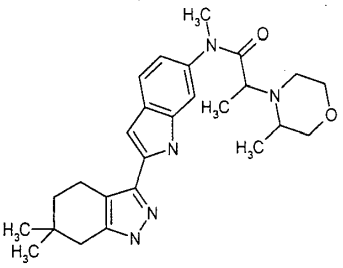


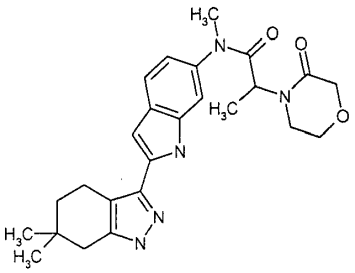


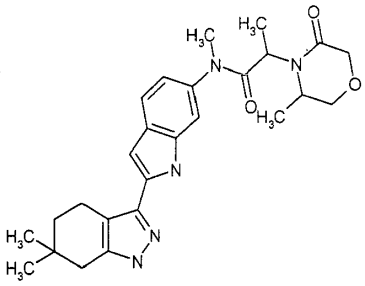


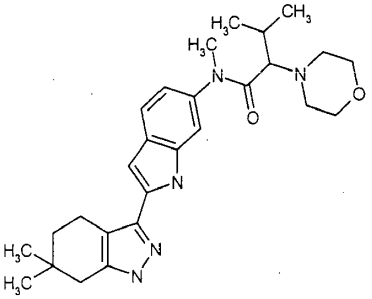


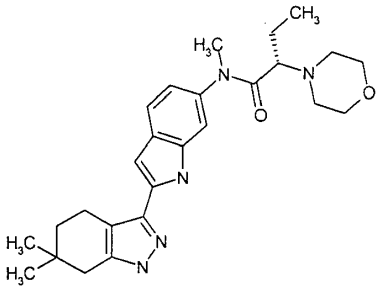


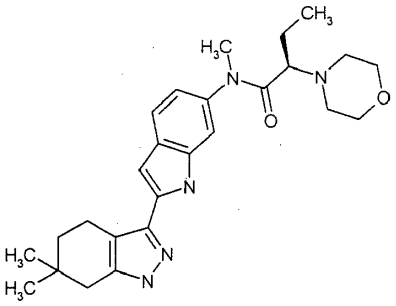


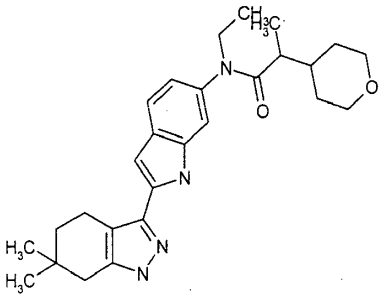


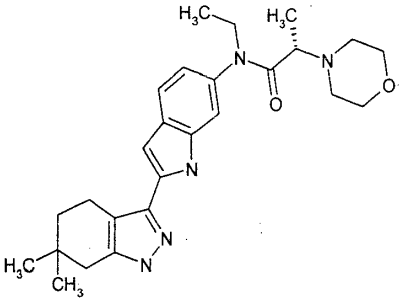


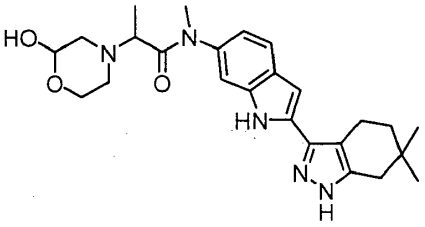


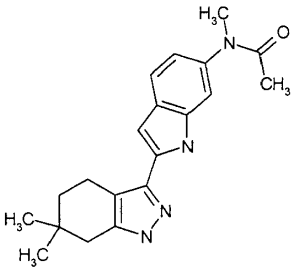




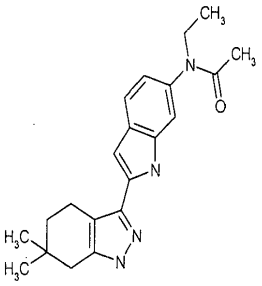








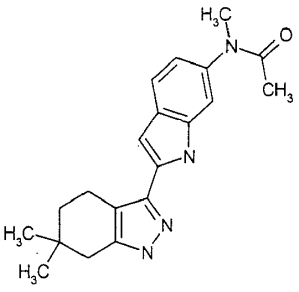
ir



,

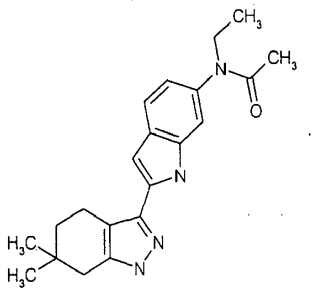
arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

6. Junginys pagal 1 punktą:



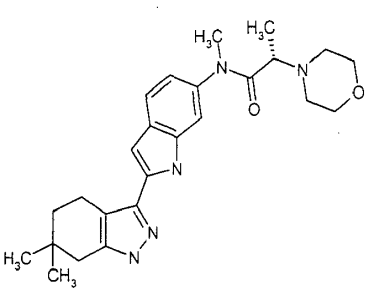
arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

7. Junginys pagal 1 punktą:



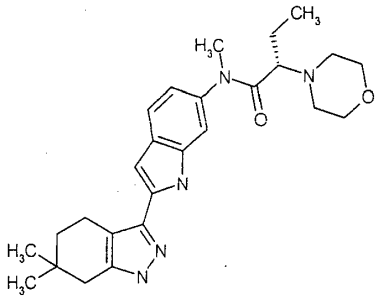
arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

8. Junginys pagal 1 punktą:



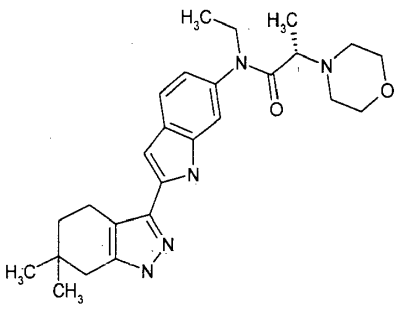
arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

9. Junginys pagal 1 punktą:



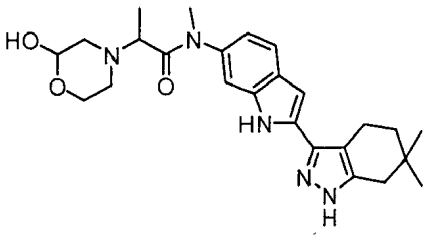
arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

10. Junginys pagal 1 punktą:



arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

11. Junginys pagal 1 punktą:



arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

12. Farmacinė kompozicija, apimanti junginį pagal bet kurį iš 1 - 11 punktų, arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską ir farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį.

13. ITK inhibitorius, apimantis junginį pagal bet kurį iš 1 - 11 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską.

14. Agentas, skirtas panaudoti uždegiminės ligos gydymui arba profilaktikai, apimantis junginį pagal bet kurį iš 1 - 11 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską.

15. Agentas, skirtas panaudoti pagal 17 punktą, kur uždegiminė liga yra reumatinis artritas.

16. Agentas, skirtas panaudoti alerginės ligos gydymui arba profilaktikai, apimantis junginį pagal bet kurį iš 1 - 11 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską.

17. Agentas, skirtas panaudoti autoimuninės ligos gydymui arba profilaktikai, apimantis junginį pagal bet kurį iš 1 - 11 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską.

18. Agentas, skirtas panaudoti pagal 17 punktą, kur autoimuninė liga yra reumatinis artritas.

19. Farmacinė kompozicija, skirta panaudoti kaip atmetimo inhibitorius transplantacijoje, apimanti junginį pagal bet kurį iš 1 - 11 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską.

20. Junginys pagal bet kurį iš 1 - 11 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti ITK slopinimo būdui žinduolyje.

21. Junginys pagal bet kurį iš 1 - 11 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti uždegiminės ligos žinduolyje gydymo arba prevencijos būdui.

22. Junginys, skirtas panaudoti pagal 21 punktą, kur uždegiminė liga yra reumatinis artritas.

23. Junginys pagal bet kurį iš 1 - 11 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti alerginės ligos žinduolyje gydymo arba prevencijos būdui.

24. Junginys pagal bet kurį iš 1 - 11 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti autoimuninės ligos žinduolyje gydymo arba prevencijos būdui.

25. Junginys, skirtas panaudoti pagal 24 punktą, kur te autoimuninė liga yra reumatinis artritas.

26. Junginys pagal bet kurį iš 1 - 11 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirti panaudoti atmetimo slopinimo būdui transplantacijoje žinduolyje.

27. Junginio pagal bet kurį iš 1 - 11 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos panaudojimas gamybai agento, skirto uždegiminės ligos gydymui arba profilaktikai.

28. Panaudojimas pagal 27 punktą, kur uždegiminė liga yra reumatinis artritas.

29. Junginio pagal bet kurį iš 1 - 11 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos panaudojimas gamybai agento, skirto alerginės ligos gydymui arba profilaktikai.

30. Junginio pagal bet kurį iš 1 - 11 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos panaudojimas, gamybai agento, skirto autoimuninės ligos gydymui arba profilaktikai.

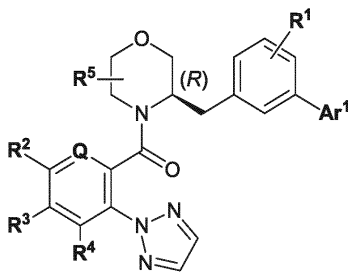
31. Panaudojimas pagal 30 punktą, kur autoimuninė liga yra reumatinis artritas.

32. Junginio pagal bet kurį iš 1 - 11 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos panaudojimas atmetimo inhibitoriaus transplantacijoje gamybai.

---

*(51)* Int.Cl. ***C07D 413/10*** (2006.01)
***C07D 413/14*** (2006.01)
***C07D 417/14*** (2006.01)
***A61K 31/5377*** (2006.01)
***A61P 3/04*** (2006.01)
***A61P 25/22*** (2006.01)
***A61P 25/30*** (2006.01)
***A61P 25/26*** (2006.01)

*(11)* **2776430**
*(96)* 12791862.1
*(96)* 2012-11-07
*(97)* 2014-09-17
*(97)* 2016-03-16
*(86)* PCT/IB2012/056218
*(86)* 2012-11-07
*(87)* WO 2013/068935
*(87)* 2013-05-16
*(30)* PCT/IB2011/054976, 2011-11-08, WO
*(72)* BOLLI, Martin, CH
BOSS, Christoph, CH
BROTSCHI, Christine, CH
HEIDMANN, Bibia, CH
SIFFERLEN, Thierry, CH
WILLIAMS, Jodi T., CH
*(73)* Actelion Pharmaceuticals Ltd., 4123 Allschwil, CH
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* 2-(1,2,3-Triazol-2-il)benzamido ir 3-(1,2,3-triazol-2-il) pikolinamido dariniai, kaip oreksino receptorių antagonistai
Apibrėžties punktai: 16, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Junginys, turintis formulę (I)




Formulė I

kurioje

$Ar^1$ reiškia 5- arba 6-narių heteroarilą, parinktą iš grupės, susidedančios iš pirolilo, pirazolilo, triazolilo, oksazolilo, tiazolilo, oksadiazolilo, tiofenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo ir piridazinilo; kur minėtas heteroarilas yra nepakeistas, mono- arba di-pakeistas, kur pakaitai yra nepriklausomai parinkti iš grupės, susidedančios iš ($C_{1-4}$)alkilo, ($C_{1-4}$)alkoksi, halogeno, ciano, ($C_{1-3}$)fluoralkilo ir ($C_{1-3}$)fluoralkoksi;

$R^1$ reiškia vieną pasirinktinį pakaitą, parinktą iš ($C_{1-4}$)alkilo, ($C_{1-4}$)alkoksi, hidroksi, and halogeno;

$R^2$ reiškia vandenilį, ($C_{1-4}$)alkilą, ($C_{1-4}$)alkoksi, halogeną arba ciano;

$R^3$ reiškia vandenilį, ($C_{1-4}$)alkilą, ($C_{1-4}$)alkoksi, ($C_{1-3}$)fluoralkilą arba halogeną;

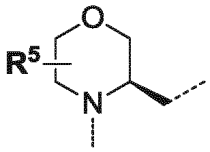
$R^4$ reiškia vandenilį, ($C_{1-4}$)alkilą, ($C_{1-3}$)fluoralkilą arba halogeną;

$R^5$ reiškia viena pasirinktinį pakaitą prie bet kurio žiedo anglies atomo morfolino žiede, kur minėtas pakaitas nepriklausomai yra metilas arba etilas; ir

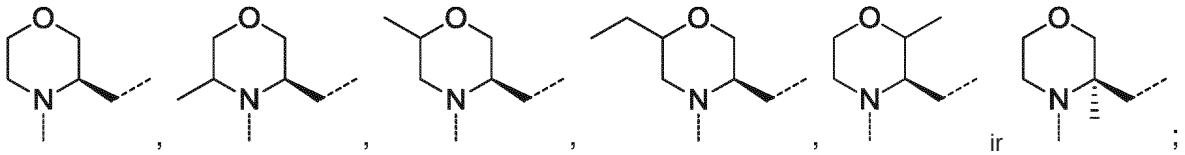
Q reiškia $CR^6$; arba, tuo atveju, kai $R^2$ yra ($C_{1-4}$)alkilas arba ($C_{1-4}$)alkoksi, Q reiškia $CR^6$ arba N; kur $R^6$ reiškia vandenilį, fluorą arba metilą;

arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

2. Junginys pagal 1 punktą, kur junginių, turinčių formulę (I):



morfolino žiedas yra žiedas, parinktas iš grupės, susidedančios iš:



Ar[1] reiškia 5- arba 6-narių heteroarilą, parinktą iš grupės, susidedančios iš pirolilo, pirazolilo, triazolilo, oksazolilo, tiazolilo, oksadiazolilo, tiofenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo ir piridazinilo; kur minėtas heteroarilas yra nepakeistas arba mono-pakeistas (C1-4)alkilu;

$R^1$ reiškia vieną pasirinktinį pakaitą, parinktą iš metilo, metoksi, hidroksi ir halogeno;

$R^2$ reiškia vandenilį, metilą, metoksi, halogeną arba ciano;

$R^3$ reiškia vandenilį, metilą, metoksi, trifluoralkilą arba halogeną;

$R^4$ reiškia vandenilį, metilą, trifluoralkilą arba halogeną;

Q reiškia $CR^6$; arba, tuo atveju, kai $R^2$ yra metilas, Q reiškia $CR^6$ arba N; kur $R^6$ reiškia vandenilį, fluorą arba metilą;

arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

3. Junginys pagal 1 arba 2 punktą, kur $Ar^1$ reiškia pirazol-1-ilą, [1,2,3]triazol-2-ilą, [1,2,4]oksadiazol-3-ilą, arba pirimidin-2-ilą, kur grupės yra nepakeistos arba, pirimidin-2-ilo atveju, pasirinktinai mono-pakeistos metilu;

arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

4. Junginys pagal bet kurį iš 1-3 punktą, kur $R^2$ reiškia vandenilį, metilą, metoksi, ciano, fluorą arba chlorą; $R^3$ reiškia vandenilį, metilą, trifluormetilą, fluorą arba chlorą; $R^4$ reiškia vandenilį, metilą, trifluormetilą arba fluorą; ir Q reiškia $CR^6$; arba, tuo atveju, kai $R^2$ yra metilas, Q reiškia $CR^6$ arba N; kur $R^6$ reiškia vandenilį, fluorą arba metilą;

arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

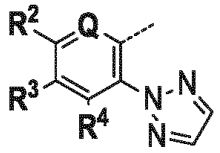
5. Junginys pagal bet kurį iš 1-4 punktą, kur Q reiškia CH;

arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

6. Junginys pagal bet kurį iš 1-3 punktą, kur $R^2$ reiškia vandenilį arba chlorą; $R^3$ reiškia vandenilį, chlorą, metilą arba trifluormetilą, $R^4$ reiškia vandenilį arba metilą; ir Q reiškia CH;

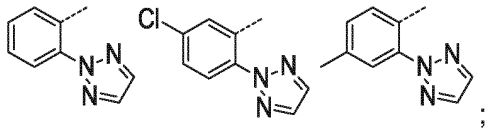
arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

7. Junginys pagal bet kurį iš 1-3 punktą, kur grupė

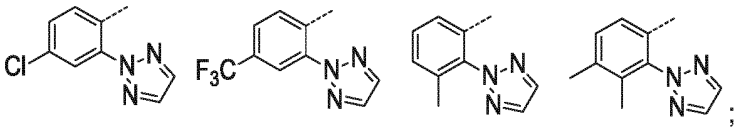


yra grupė, nepriklausomai parinkta iš šių A) - F) grupių:

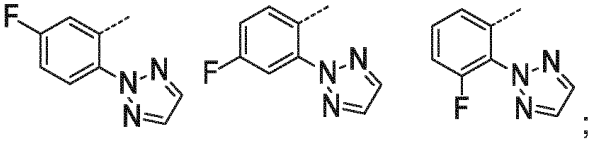
A)



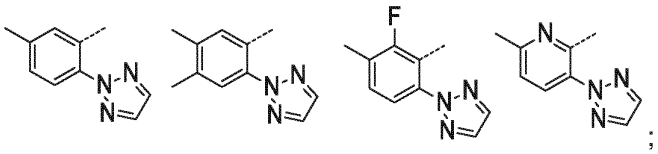
B)



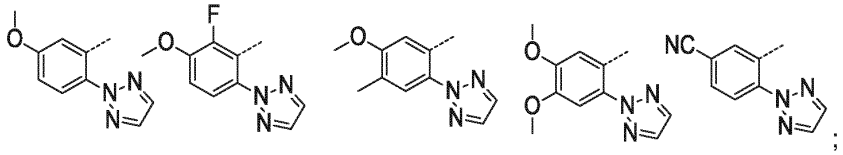
C)



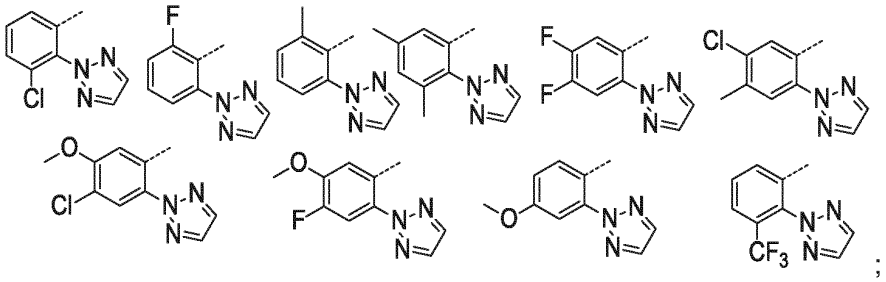
D)



E)

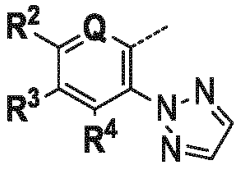


F)



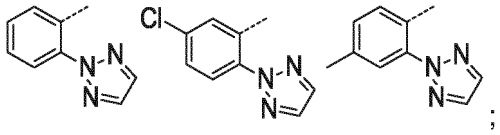
arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

8. Junginys pagal bet kurį iš 1-3 punktą, kur grupė

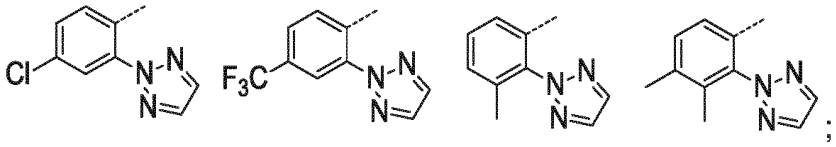


yra grupė, nepriklausomai parinkta iš grupės, susidedančios iš šių A) ir B) grupių:

A)

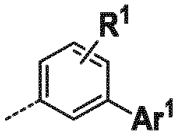


B)



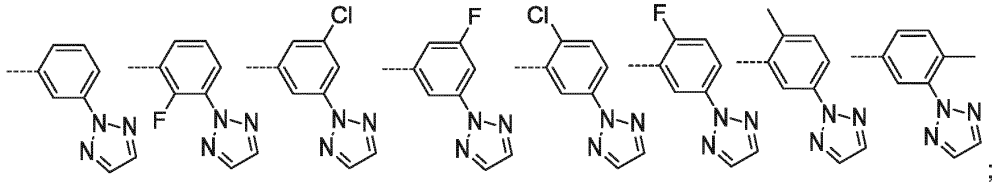
arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

9. Junginys pagal bet kurį iš 1, 2, arba 4-8 punktą, kur grupė

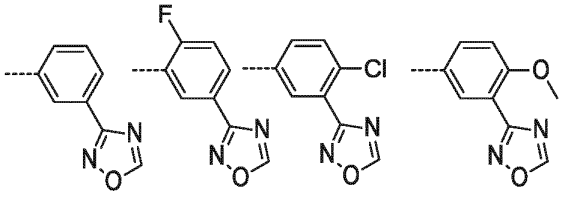


yra grupė, nepriklausomai parinkta iš šių A) - H) grupių:

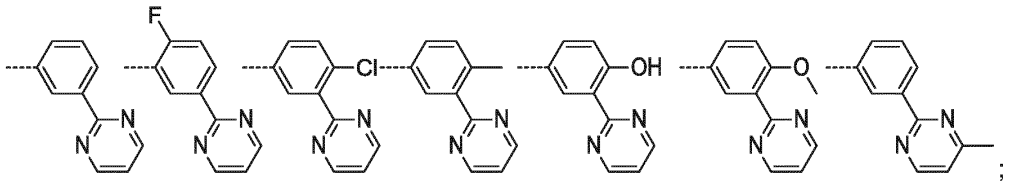
A)



B)

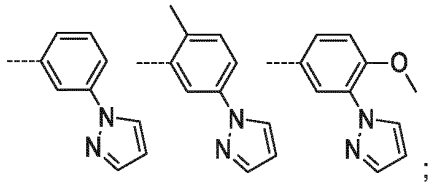


C)



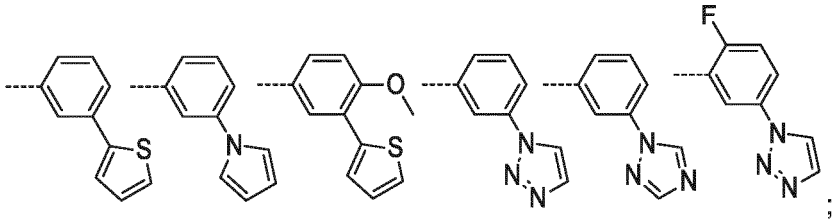
;

D)



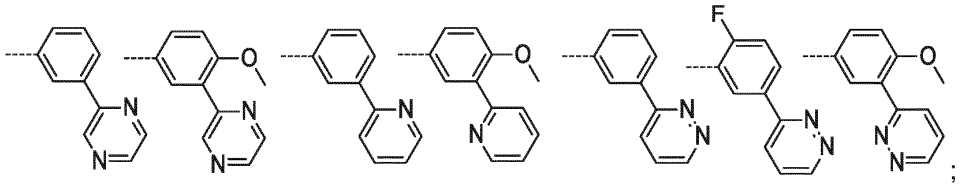
;

E)



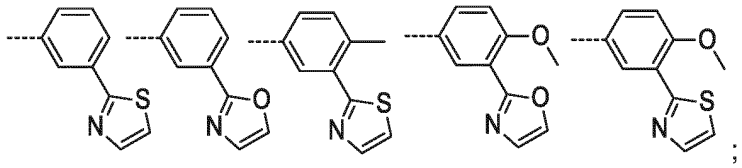
;

F)



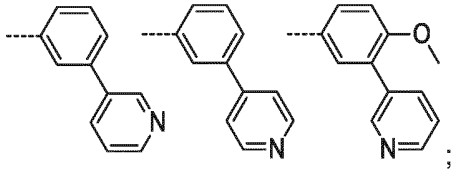
;

G)



;

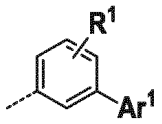
H)



;

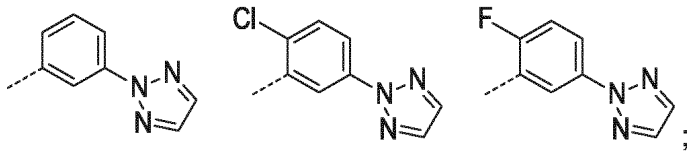
arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

10. Junginys pagal bet kurį iš 1, 2, arba 4-8 punktą, kur grupė



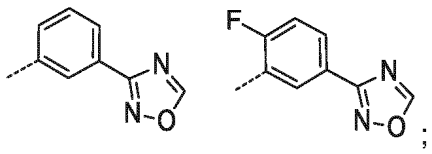
yra grupė, parinkta iš grupės, susidedančios iš šių A) ir B) grupių:

A)



ir

B)



arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

11. Junginys pagal 1 punktą, parinktas iš grupės, susidedančios iš:
[(R)-3-(3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(4-metoksi-3-piridin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(4-metoksi-3-piridin-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(4-metoksi-3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(4-metoksi-3-pirazin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(4-metoksi-3-piridazin-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(4-metoksi-3-tiazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(4-metoksi-3-oksazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(4-metoksi-3-tiofen-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(S)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(4-metoksi-3-pirazol-1-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-1-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(3-pirazol-1-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-pirazol-1-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(5-fluor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-pirazol-1-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(2-fluor-3-metil-6-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-pirazol-1-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-pirazol-1-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,4]triazol-1-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-piridin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-piridin-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(5-fluor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-piridin-4-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(2-fluor-3-metil-6-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(5-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
4-[1,2,3]triazol-2-il-3-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-karbonil]-benzonitrile;
(5-metoksi-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(2-fluor-3-metoksi-6-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4,5-dimetoksi-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4,5-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4-fluor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;

(5-metoksi-4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-pirol-1-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
{(R)-3-[3-(4-metil-pirimidin-2-il)-benzil]-morfolin-4-il}-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
{(R)-3-[3-(4-metil-pirimidin-2-il)-benzil]-morfolin-4-il}-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-pirazin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(3-oksazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-tiazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(3-tiazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-tiofen-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(3-tiofen-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-piridazin-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(3-piridazin-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(2-fluor-3-metil-6-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(5-metoksi-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(5-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(6-metil-3-[1,2,3]triazol-2-il-piridin-2-il)-[(R)-3-(3-pirazol-1-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(6-metil-3-[1,2,3]triazol-2-il-piridin-2-il)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono; and
(3-fluor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

12. Junginys pagal 1 punktą, parinktas iš grupės, susidedančios iš:
[(R)-3-(4-hidroksi-3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(4-metoksi-3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(4-metoksi-3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(4-metoksi-3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(4-fluor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(4-metoksi-3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(4-metoksi-3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-metil-6-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(4-metil-3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(4-metil-3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(4-metil-3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(3R,5R)-3-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(3R,5R)-3-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(3R,5R)-3-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(3S,5R)-3-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(3S,5R)-3-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(3S,5R)-3-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(4,5-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(3S,5R)-3-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(3,5-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-4-trifluormetil-fenil)-metanono;
(4-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4-fluor-5-metoksi-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4,5-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(4-metil-3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4,5-difluor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(3-fluor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(5-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4,5-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;

[(R)-3-(3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-4-trifluormetil-fenil)-metanono;
(5-fluor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(3,5-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(4-chlor-3-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(4,5-difluor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(3,4-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4-metoksi-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(3,4-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metoksi-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2S,5R)-2-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-2-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(4,5-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(2R,5R)-2-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(3,4-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(2R,5R)-2-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(2R,5R)-2-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-2-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-metil-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(5-chlor-4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4-chlor-5-metoksi-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(3-chlor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(3-chlor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(3-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(2R,5R)-2-metil-5-(3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-2-metil-5-(3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-2-metil-5-(3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-2-metil-5-(3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(3,4-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(2R,5R)-2-metil-5-(3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(5-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(2R,5R)-2-metil-5-(3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(2R,5R)-2-metil-5-(3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-metil-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-chlor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-metil-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-chlor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-metil-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-metil-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-chlor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-chlor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(4,5-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(5-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metoksi-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(2-fluor-3-metil-6-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(2-fluor-3-metoksi-6-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morphol in-4-il]-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metoksi-4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(3-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-fluor-6-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(4,5-difluor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-4-trifluormetil-fenil)-metanono;
(4-chlor-5-metoksi-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;

[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-1-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-1-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-2-etil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-2-Etil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-2-etil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(3-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(3-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-pirimidin-2-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-pirimidin-2-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-pirimidin-2-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-pirimidin-2-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(3,4-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-pirimidin-2-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-metanono;
(5-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-pirimidin-2-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-metanono;
(4-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(2R, 5R)-5-(2-fluor-5-pirimid in-2-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-metanono;
(3-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-pirimidin-2-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(3,4-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(5-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(3-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(2S,3R)-2-metil-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2S,3R)-2-metil-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2S,3R)-2-metil-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-piridazin-3-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-piridazin-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,3R)-2-metil-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(2R,3R)-2-metil-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-chlor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(3,4-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-chlor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-chloro-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-chlor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(3-chloro-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(3-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(2R,5R)-2-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(3-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-2-metil-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(5-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(4-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4,5-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(3-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(3,4-dimetil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-fluor-5-[1,2,4]oksadiazol-3-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-3-trifluormetil-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-fluor-3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(5-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(2R,5R)-2-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(4-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(2R,5R)-2-metil-5-(3-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
(5-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-2-metil-morphol in-4-il]-metanono;
(4-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(2R,5R)-5-(2-fluor-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-2-metil-morphol-in-4-il]-metanono;
[(R)-3-(2-metil-5-pirazol-1-il-benzil)-morfolin-4-il]-(5-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-metil-5-pirazol-1-il-benzil)-morfolin-4-il]-(4-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
[(R)-3-(2-metil-5-pirazol-1-il-benzil)-morfolin-4-il]-(3-metil-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
(4-chlor-2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-[(R)-3-(2-metil-5-[1,2,3]triazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-metanono;
[(R)-3-(4-metil-3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;

[(R)-3-(4-metil-3-tiazol-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono; ir
[(R)-3-(4-chlor-3-pirimidin-2-il-benzil)-morfolin-4-il]-(2-[1,2,3]triazol-2-il-fenil)-metanono;
arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska.

13. Farmacinė kompozicija, apimanti, kaip aktyvųjį pradmenį, vieną arba daugiau junginių pagal bet kurį iš 1-12 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtiną jo druską, ir bent vieną terapiniu požiūriu inertišką užpildą.

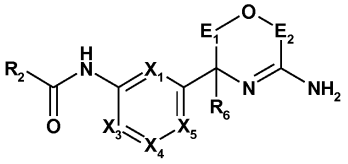
14. Junginys pagal bet kurį iš 1-12 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, skirta naudoti kaip vaistas.

15. Junginys pagal bet kurį iš 1-12 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, skirta naudoti ligos, parinktos iš grupės, susidedančios iš nerimo sutrikimų, priklausomybės sutrikimų, nuotaikos sutrikimų ir apetito sutrikimų, prevencijai arba gydymui.

16. Junginio pagal bet kurį iš 1-12 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos panaudojimas gamyboje medikamento, skirto ligos, parinktos iš grupės, susidedančios iš nerimo sutrikimų, priklausomybės sutrikimų, nuotaikos sutrikimų ir apetito sutrikimų, prevencijai arba gydymui.

---

*(51)* Int.Cl. ***C07D 413/14*** (2006.01)
***C07D 471/04*** (2006.01)
***C07D 487/04*** (2006.01)
***A61K 31/5377*** (2006.01)
***A61P 25/00*** (2006.01)
*(11)* **2663561**
*(96)* 12700390.3
*(96)* 2012-01-11
*(97)* 2013-11-20
*(97)* 2016-03-16
*(86)* PCT/EP2012/050395
*(86)* 2012-01-11
*(87)* WO 2012/095469
*(87)* 2012-07-19
*(30)* DE00772011, 2011-01-13, IN
201161534591 P, 2011-09-14, US
*(72)* BADIGER, Sangamesh, IN
CHEBROLU, Murali, IN
HURTH, Konstanze, CH
JACQUIER, Sébastien, CH
LUEOEND, Rainer Martin, CH
MACHAUER, Rainer, CH
RUEEGER, Heinrich, CH
TINTELNOT-BLOMLEY, Marina, CH
VEENSTRA, Siem Jacob, CH
VOEGTLE, Markus, CH
*(73)* Novartis AG, 4056 Basel, CH
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Nauji heterocikliniai dariniai ir jų panaudojimas neurologinių sutrikimų gydyme
Apibrėžties punktai: 21, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Junginys, turintis formulę (I), arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska



(I),

kurioje

$X_1$ yra $CR_1$ arba N;

$X_3$ yra $CR_3$ arba N;

$X_4$ yra $CR_4$ arba N;

$X_5$ yra $CR_5$;

kur vienas ir ne daugiai kaip vienas iš $X_1$, $X_3$ ir $X_4$ yra N;

$R_1$ yra vandenilis;

$R_2$ yra arilas, heteroarilas arba ne-aromatinė heterociklilo grupė $G_1$, kur grupė $G_1$ yra pasirinktinai pakeista 1, 2, 3 arba 4 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš grupės, susidedančios iš ciano, amino, amino-($C_{1-8}$)alkilo, *N*-$C_{1-4}$)alkil-amino($C_{1-8}$)alkilo, *N,N*-di($C_{1-4}$)alkil-amino-($C_{1-8}$)alkilo, aminokarbonilo, tiokarbamoilo, halogeno, ($C_{1-8}$)alkilo, halogen-($C_{1-8}$)alkilo, hidroksi, okso, ($C_{1-8}$alkoksi, halogen-($C_{1-8}$)alkoksi, ($C_{1-8}$)alkiltio, halogen-($C_{1-8}$)alkiltio, ($C_{1-8}$)alkoksi-($C_{1-8}$) alkilo, ($C_{3-8}$)cikloalkil-($C_{1-8}$)alkoksi, ($C_{1-8}$)alkoksi-($C_{1-8}$)alkoksi; ($C_{1-8}$)alkoksi-($C_{1-8}$)alkiltio, ($C_{1-8}$)alkiltio-($C_{1-8}$)alkilo, ($C_{1-8}$) alkiltio-($C_{1-8}$)alkoksi, ($C_{1-8}$)alkiltio-($C_{1-8}$)alkiltio, ($C_{2-8}$)alkenilo, ($C_{2-8}$)alkinilo, ($C_{2-8}$)alkenoksi, ($C_{2-8}$alkinoksi ir ($C_{3-8}$) cikloalkilo, arilo, heteroarilo arba ne-aromatinės heterociklinės grupės $G_2$, kur grupė $G_2$ yra pasirinktinai pakeista 1, 2, 3, arba 4 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš grupės, susidedančios iš ciano, aminokarbonilo, halogeno, ($C_{1-8}$) alkilo, halogen-($C_{1-8}$)alkilo, hidroksi, ($C_{1-8}$)akoksi, halogen-($C_{1-8}$)alkoksi, ($C_{1-8}$)alkiltio, halogen-($C_{1-8}$)alkiltio, ($C_{1-8}$)alkoksi-($C_{1-8}$)alkilo, ($C_{1-8}$)alkoksi-($C_{1-8}$)alkoksi, ($C_{1-8}$)alkoksi-($C_{1-8}$)alkiltio, ($C_{1-8}$)alkiltio-($C_{1-8}$)alkilo, ($C_{1-8}$)alkiltio-($C_{1-8}$)alkoksi, ($C_{1-8}$) alkiltio-($C_{1-8}$)alkiltio, ($C_{2-8}$)alkenilo ir ($C_{2-8}$)alkinilo;

$R_3$ yra vandenilis;

$R_4$ yra vandenilis, ciano, halogenas, ($C_{1-8}$)alkilas, halogen-($C_{1-8}$)alkilas, ($C_{1-8}$)alkoksi, halogen-($C_{1-8}$)alkoksi, ($C_{1-8}$)alkiltio, halogen-($C_{1-8}$)alkiltio, ($C_{1-8}$)alkoksi-($C_{1-8}$)alkilas, ($C_{1-8}$)alkoksi-($C_{1-8}$)alkoksi, ($C_{1-8}$)alkoksi-($C_{1-8}$)alkiltio, ($C_{1-8}$)alkiltio-($C_{1-8}$) alkilas, ($C_{1-8}$)alkiltio-($C_{1-8}$)alkoksi, ($C_{1-8}$)alkiltio-($C_{1-8}$)alkiltio, ($C_{2-8}$)alkenilas, arba ($C_{2-8}$)alkinilas;

$R_5$ yra vandenilis, ciano, halogenas, ($C_{1-8}$)alkilas, halogen-($C_{1-8}$)alkilas, ($C_{1-8}$)alkoksi, halogen-($C_{1-8}$)alkoksi, ($C_{1-8}$)alkiltio, halogen-($C_{1-8}$)alkiltio, ($C_{1-8}$)alkoksi-($C_{1-8}$)alkilas, ($C_{1-8}$)alkoksi-($C_{1-8}$)alkoksi, ($C_{1-8}$)alkoksi-($C_{1-8}$)alkiltio, ($C_{1-8}$)alkiltio-($C_{1-8}$) alkilas, ($C_{1-8}$)alkiltio-($C_{1-8}$)alkoksi, ($C_{1-8}$)alkiltio-($C_{1-8}$)alkiltio, ($C_{2-8}$)alkenilas arba ($C_{2-8}$)alkinilas, arba

$R_4$ ir $R_5$ kartu sudaro -C(H)=C(H)-C(H)=C(H)- arba ($C_{1-8}$)alkileno grupę, kur toje ($C_{1-8}$)alkileno grupėje 1 arba 2 -$CH_2$- žiedo nariai yra pasirinktinai pakeisti hetero žiedo nariais, nepriklausomai parinktais iš grupės, susidedančios iš -N(H)-, N[($C_{1-8}$)alkil]-, -O-,-S-, -S(=O)- arba -S(=O)$_2$-;

$R_6$ yra ($C_{1-8}$)alkilas, halogen-($C_{1-6}$)alkilas, hidroksi-($C_{1-8}$)alkilas, ($C_{1-8}$)alkoksi-($C_{1-8}$)alkilas, mercapto-($C_{1-8}$)alkilas, ($C_{1-8}$) alkiltio-($C_{1-8}$)alkilas, amino-($C_{1-8}$)alkilas; *N*-($C_{1-4}$)alkil-amino-($C_{1-8}$)alkilas, *N,N*-di($C_{1-4}$)alkil-amino-($C_{1-8}$)alkilas, ($C_{2-8}$) alkenilas, arba ($C_{2-8}$)alkinilas; arba

$R_5$ ir $R_6$ kartu sudaro ($C_{1-4}$)alkileno grupę, kur ($C_{1-4}$)alkileno grupės 1-$CH_2$- žiedo narys yra pasirinktinai pakeistas hetero žiedo nariu, nepriklausomai parinktu iš grupės, susidedančios iš N(H)-, -N[($C_{1-4}$)alkil]-, -O-, -S-, -(=O)- arba -S(=O)$_2$-;

$E_1$ yra -C($R_7$)($R_8$)- , kur kiekvienas iš $R_7$ ir $R_8$ yra vandenilis;

$E_2$ yra -C($R_{11}$)($R_{12}$)-;

arba

kiekvienas iš $R_{11}$ ir $R_{12}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, ciano, halogeno, ($C_{1-8}$) alkilo, halogen-($C_{1-8}$)alkilo, ($C_{1-8}$)alkoksi-($C_{1-8}$)alkilo ir ($C_{1-8}$)alkiltio-($C_{1-8}$)alkilo;

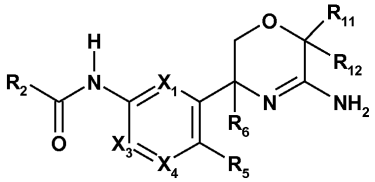
arba

$R_{11}$ ir $R_{12}$ kartu sudaro okso arba -$CR_{15}R_{16}$-$CR_{17}R_{18}$- grupę;

kur $R_{15}$, $R_{16}$, $R_{17}$ ir $R_{18}$ yra nepriklausomai parinkti iš vandenilio ir fluor.

2. Junginys pagal 1 punktą, arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, kur $X_1$ yra N; $X_3$ yra $CR_3$; $X_4$ yra $CR_4$; ir $X_5$ yra $CR_5$.

3. Junginys pagal 1 punktą, arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, turintis formulę (Ic):




(Ic),

kurioje

$X_1$ yra CH arba N;

$X_3$ yra CH arba N;

$X_4$ yra $CR_4$ arba N;

kur vienas ir ne daugiau kaip vienas iš $X_1$, $X_3$ ir $X_4$ yra N;

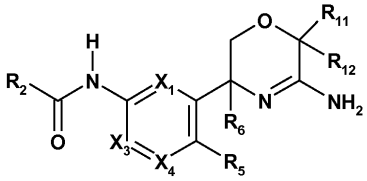
$R_2$ yra 5- arba 6-narių heteroarilo grupė, kurios struktūroje 1, 2, 3, arba 4 žiedo nariai yra hetero žiedo nariai, nepriklausomai parinkti iš grupės, susidedančios iš azoto žiedo nario, deguonies žiedo nario ir sieros žiedo nario, kur grupės yra pasirinktinai pakeistos 1, 2, 3 arba 4 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš grupių, susidedančių iš ciano, amino, aminokarbonilo, tiokarbamoilo, halogeno, ($C_{1-4}$)alkilo, halogen-($C_{1-4}$)alkilo, hidroksi, okso, ($C_{1-4}$)alkoksi; halogen-($C_{1-4}$)alkoksi, ($C_{1-4}$)alkiltio, halogen-($C_{1-4}$)alkiltio, ($C_{1-4}$)alkoksi-($C_{1-4}$)alkilo, ($C_{1-4}$)alkoksi-($C_{1-4}$)alkoksi, ($C_{1-4}$)alkoksi-($C_{1-4}$)alkiltio, ($C_{1-4}$)alkiltio-($C_{1-4}$)alkilo, ($C_{1-4}$)alkiltio-($C_{1-4}$)alkoksi, ($C_{1-4}$)alkiltio-($C_{1-4}$)alkiltio, ($C_{2-4}$)alkenilo, ($C_{2-4}$)alkinilo, ($C_{2-4}$)alkenoksi ir ($C_{2-4}$)alkinoksi;

$R_4$ ir $R_5$ yra nepriklausomai parinkti iš grupės, susidedančios iš vandenilio, ciano, halogeno, ($C_{1-4}$)alkilo, halogen-($C_{1-4}$)alkilo, ($C_{1-4}$)alkoksi, arba halogen-($C_{1-4}$)alkoksi;

$R_6$ yra ($C_{1-3}$)alkilas arba fluor-($C_{1-3}$)alkilas; ir

kiekvienas iš $R_{11}$ ir $R_{12}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, ($C_{1-3}$)alkilo ir halogen-($C_{1-3}$)alkilo.

4. Junginys pagal 1 punktą, arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, turintis formulę (Ic)



(Ic),

kurioje

$X_1$ yra CH arba N;

$X_3$ yra CH arba N;

$X_4$ yra $CR_4$ arba N;

kur vienas ir ne daugiau kaip vienas iš $X_1$, $X_3$ ir $X_4$ yra N;

$R_2$ yra piridilo arba pirazinilo grupė, kuri yra pasirinktinai pakeista 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš grupės, susidedančios iš ciano, amino, aminokarbonilo, tiokarbamoilo, halogeno, ($C_{1-4}$)alkilo, halogen-($C_{1-4}$)alkilo, hidroksi, okso, ($C_{1-4}$)alkoksi, halogen-($C_{1-4}$)alkoksi, ($C_{1-4}$)alkiltio, halogen-($C_{1-4}$)alkiltio, ($C_{1-4}$)alkoksi-($C_{1-4}$)alkilo, ($C_{1-4}$)alkoksi-($C_{1-4}$)alkoksi, ($C_{1-4}$)alkoksi-($C_{1-4}$)alkiltio, ($C_{1-4}$)alkiltio-($C_{1-4}$)alkilo, ($C_{1-4}$)alkiltio-($C_{1-4}$)alkoksi, ($C_{1-4}$)alkiltio-($C_{1-4}$)alkiltio, -($C_{2-4}$)alkenilo, ($C_{2-4}$)alkinilo, ($C_{2-4}$)alkenoksi ir ($C_{2-4}$)alkinoksi;

$R_4$ ir $R_5$ nepriklausomai, yra vandenilis arba halogenas;

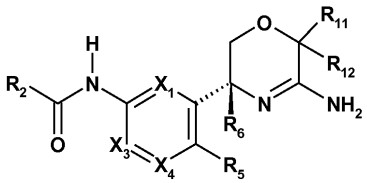
$R_6$ yra ($C_{1-3}$)alkilas arba fluor-($C_{1-3}$)alkilas; ir

kiekvienas iš $R_{11}$ ir $R_{12}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, ($C_{1-3}$)alkilo ir fluor-($C_{1-3}$)alkilo.

5. Junginys pagal bet kurį iš 1-4 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, kur kiekvienas iš $R_{11}$ ir $R_{12}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, metilo, fluormetilo, difluormetilo ir trifluormetilo.

6. Junginys pagal bet kurį iš 1-5 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, kur $R_6$ yra metilas, fluormetilas, difluormetilas arba trifluormetilas.

7. Junginys pagal 1 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, turintis formulę (Id):



(Id),

kurioje

$X_1$ yra CH arba N;

$X_3$ yra CH arba N;

$X_4$ yra $CR_4$ arba N;

kur vienas ir ne daugiau kaip vienas iš $X_1$, $X_3$ ir $X_4$ yra N;

$R_2$ yra piridilo arba pirazinilo grupė, kuri yra pakeista 2 arba 3 pakaitais ir kurioje vienas iš pakaitų yra *para* padėtyje

ir vienas iš pakaitų yra *orto* padėtyje piridilo arba pirazinilo grupėje amido linkerio atžvilgiu, ir kur pakaitai yra nepriklausomai parinkti iš grupės, susidedančios iš ciano, amino, halogeno, ($C_{1-4}$)alkilo, halogen-($C_{1-4}$)alkilo, hidroksi, okso, ($C_{1-4}$)alkoksi ir halogen-($C_{1-4}$)alkoksi;

$R_4$ ir $R_5$ nepriklausomai, yra vandenilis arba halogenas;

$R_6$ yra metilas, fluormetilas, difluormetilas arba trifluormetilas; ir

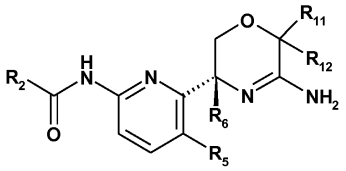
kiekvienas iš $R_{11}$ ir $R_{12}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, metilo, fluormetilo, difluormetilo ir trifluormetilo.

8. Junginys pagal bet kurį iš 1-7 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, kur $R_2$ yra piridin-2-ilo arba pirazin-2-ilo grupė, kuri yra pakeista 2 pakaitais, ir kurioje vienas iš pakaitų yra *para* padėtyje ir vienas iš pakaitų yra *orto* padėtyje piridilo arba pirazinilo grupėje amido linkerio atžvilgiu, ir kur pakaitai yra nepriklausomai parinkti iš grupės, susidedančios iš ciano, amino, fluoro, bromo, chloro, hidroksilo, okso, metilo, fluormetilo, difluormetilo, trifluormetilo, metoksi, fluormetoksi, difluormetoksi ir trifluormetoksi.

9. Junginys pagal bet kurį iš 3-8 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, kur $X_1$ yra N; $X_3$ yra CH; ir $X_4$ yra $CR_4$.

10. Junginys pagal bet kurį iš 1-9 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, kur $R_4$ yra vandenilis.

11. Junginys pagal 1 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, turintis formulę (Ie):




(Ie),

kurioje

$R^2$ yra piridin-2-ilo arba pirazin-2-ilo grupė, kuri yra pakeista 2 pakaitais ir ir kurioje vienas iš pakaitų yra *para* padėtyje ir vienas iš pakaitų yra *orto* padėtyje piridin-2-ilo arba pirazin-2-ilo grupėje amido linkerio atžvilgiu, ir kur pakaitai yra nepriklausomai parinkti iš grupės, susidedančios iš ciano, amino, fluoro, bromo, chloro, hidroksilo, okso, metilo, fluormetilo, difluormetilo, trifluormetilo, metoksi, fluormetoksi, difluormetoksi ir trifluormetoksi;

$R^5$ yra vandenilis arba fluoras;

$R^6$ yra metilas, fluormetilas arba difluormetilas; ir

kiekvienas iš $R^{11}$ ir $R^{12}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, metilo, fluormetilo, difluormetilo ir trifluormetilo.

12. Junginys pagal bet kurį iš 1-11 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, kur $R^5$ yra fluoras.

13. Junginys pagal 1 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, kuris yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:

5-brom-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3-metil-3,6-dihidro-2H-[1,4]-oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

5-chlor-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3-fluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

5-brom-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3-fluormetil-3,6-dihidro-2H[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

5-ciano-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [6-(6-amino-3-fluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

4,6-dideuterio-5-chlor-3-trideuteriometil-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3-fluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

5-tiokarbamoil-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3-fluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

5-ciano-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluor-metil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

5-ciano-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

4,6-dideuterio-5-chlor-3-trideuteriometil-piridin-2-karboksirūgšties [4-(5-amino-3-fluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

5-chlor-piridin-2-karboksirūgšties [4-(5-amino-3-fluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

5-ciano-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [4-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

5-brom-piridin-2-karboksirūgšties [5-(5-amino-3-fluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-6-chloro-piridin-3-il]amido;

3-amino-5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

3-chlor-5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

5-chlor-4,6-dideuterio-3-trideuteriometil-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amin-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

5-brom-3-chloro-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

3-amino-5-(2,2,2-trifluor-etoksi)-pirazin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4] oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

3-chlor-5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

5-metoksi-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5iamino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-amino-5-(2,2,2-trifluor-etoksi)-pirazin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4] oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-amino-5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

5-difluormetoksi-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-chlor-5-difluormetoksi-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3,5-dichlor-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

5-fluormetoksi-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

5-metil-pirazin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-chlor-5-trifluormetil-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-chlor-5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [4-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

3-chlor-5-difluormetoksi-piridin-2- karboksirūgšties [4-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

5-ciano-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [4-(5-amino-6,6-bis-fluormetil-3-metil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

5-ciano-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3-difluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4] oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

3-chlor-5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3-difluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4] oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

3,5-dimetil-pirazin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-amino-5-(3-fluorpropoksi)-pirazin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4] oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-amino-5-(2-metoksi-etil)-5H-pirolo[2,3-b]pirazin-2-karboksirūgšties [6-((5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-amino-5-trifluormetil-pirazin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-amino-5-(2,2-difluor-etil)-5H-pirolo[2,3-b]pirazin-2-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

4-chlor-1-difluormetil-1H-pirazol-3-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-tritfuormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

6-chlor-1-(2,2-difluor-etil)-1H-pirolo[3,2-b]piridin-5-karboksirūgšties [6-(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido; ir

6-chlor-1-(2-metoksi-etil)-1H-pirolo[3,2-b]piridin-5-karboksirūgšties [6(5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido.

14. Junginys pagal 1 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, kuris yra parinktas iš grupės, susidedančios iš:

5-brom-piridin-2-karboksirūgšties [6-((R)-5-amino-3-metil-3,6-dihidro-2H-[1,4]-oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

5-ciano-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluor-metil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il-amido;

5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3S,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

5-ciano-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3S,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

5-ciano-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [4-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

5-ciano-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [4-((3S,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

3-amino-5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

3-chlor-5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3-6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

5-chlor-4,6-dideuterio-3-trideuteriometil-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]amido;

5-brom-3-chloro-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

3-amino-5-(2,2,2-trifluor-etoksi)-pirazin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R),5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H[1,4]oksazin-3-il)-piridin-2-il]-amido;

3-chlor-5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3R, 6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifuorometil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

5-metoksi-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-amino-5-(2,2,2-trifluor-etoksi)-pirazin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-amino-5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3-6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-chlor-5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3S,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

5-difluormetoksi-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4] oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-chlori-5-difluormetoksi-piridin-2-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3,5-dichlor-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

5-fluormetoksi-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4] oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

5-metil-pirazin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimnetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-chlor-5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [4-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

3-chlor-5-difluormetoksi-piridin-2-karboksirūgšties [4-((3S,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4] oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

5-ciano-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [4-((R)-5-amino-6,6-bis-fluormetil-3-metil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

5-ciano-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [5-((R)-5-amino-3-difluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

5-ciano-3-metil-piridin-2- karboksirūgšties [6H((S)-5-amino-3-difluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4] oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

3-chlor-5-ciano-piridin-2-karboksirūgšties [6-((R)-5-amino-3-difluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3,5-dimetil-pirazin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-amino-5-(3-fluor-propoksi)-pirazin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

3-amino-5-(2-metoksi-etil)-5H-pirolo[2,3-b]pirazin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amido;

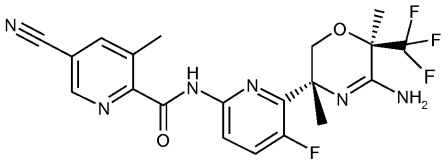
3-amino-5-(2,2-difluor-etil)-5H-pirolo[2,3-b]pirazin-2- karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3;6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

4-chlor-1-difluormetil-1H-pirazol-3-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amno-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4] oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido;

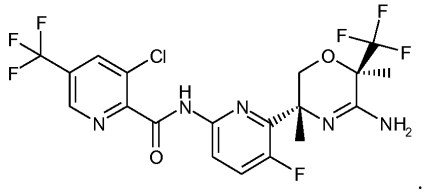
6-chlor-1-(2,2-difluor-etil)-1H-pirolo[3,2-b]piridin-5-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido; ir

6-chlor-1-(2-metoksi-etil)-1H-pirolo[3,2-b]piridin-5-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amido.

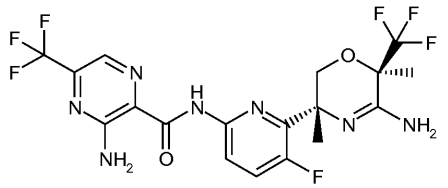
15. Junginys pagal 1 punktą, kuris yra 5-ciano-3-metil-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]-amidas arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, turintis šią formulę



16. Junginys pagal 1 punktą, kuris yra 3-chlor-5-trifluormetil-piridin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amidas arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, turintis šią formulę



17. Junginys pagal 1 punktą, kuris yra 3-amino-5-trifluormetil-pirazin-2-karboksirūgšties [6-((3R,6R)-5-amino-3,6-dimetil-6-trifluormetil-3,6-dihidro-2H-[1,4]oksazin-3-il)-5-fluor-piridin-2-il]amidas arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, turintis šią formulę



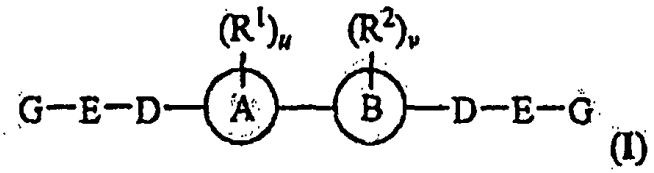
18. Junginys pagal bet kurį iš 1-17 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, skirtas naudoti kaip vaistas.

19. Junginys pagal bet kurį iš 1-17 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska, skirtas naudoti Alzheimerio ligos arba švelnaus pažinimo sutrikimo gydymui arba prevencijai.

20. Farmacinė kompozicija, apimanti junginį pagal bet kurį iš 1-17 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtiną jo druską kaip aktyvųjį farmacinį ingredientą derinyje su bent vienu farmaciniu požiūriu priimtinu nešikliu arba skiedikliu.

21. Farmacinis derinys, apimantis terapiniu požiūriu efektyvų kiekį junginio pagal bet kurį iš 1-17 punktą arba farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos, ir antrosios vaisto medžiagos, skirtas vienalaikiam arba nuosekliam įvedimui.

*(51)* Int.Cl. ***C07D 471/04*** (2006.01)
***C07D 401/14*** (2006.01)
***C07D 403/14*** (2006.01)
***C07D 405/14*** (2006.01)
***C07D 409/14*** (2006.01)
***C07D 413/14*** (2006.01)
***C07D 487/04*** (2006.01)
***C07D 498/04*** (2006.01)
***A01K 31/16*** (2006.01)
***A61K 31/404*** (2006.01)
***A61K 31/438*** (2006.01)
***A61P 31/00*** (2006.01)
*(11)* **2410844**
*(96)* 10756840.4
*(96)* 2010-03-25
*(97)* 2012-02-01
*(97)* 2016-03-23
*(86)* PCT/US2010/028653
*(86)* 2010-03-25
*(87)* WO 2010/111483
*(87)* 2010-09-30
*(30)* 163958 P, 2009-03-27, US
247318 P, 2009-09-30, US
*(72)* COBURN, Craig, A., US
MCCAULEY, John, A., US
LUDMERER, Steven, W., US
LIU, Kun, US
VACCA, Joseph, P., US
WU, Hao, CN
HU, Bin, CN
SOLL, Richard, CN
SUN, Fei, CN
WANG, Xinghai, CN
YAN, Man, CN
ZHANG, Chengren, CN
ZHENG, Mingwei, CN
ZHONG, Bin, CN
ZHU, Jian, CN
*(73)* Merck Sharp & Dohme Corp., Rahway, NJ 07065-0907, US
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Hepatito C viruso replikacijos inhibitoriai
Apibrėžties punktai: 18, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Junginys, turintis struktūrinę formulę (I):



(I)

ir/arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, kur:

kiekvienas $R^1$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno,-$OR^{3a}$, -CN, -$(CH_2)_{0-6}C(O)R^3$;

-$CO_2R^{3a}$, -$C(O)N(R^{3a})2$, -$SR^{3a}$, -$S(O)R^{3a}$, -$S(O_2)^{3a}$, -$(CH_2)_{0-6}(R^{3a})_2$, -$N(R^{3a})SO_2R^{3a}$, -$N(R^{3a})CO_2R^{3a}$, -$N(R^{3a})C(O)_3$, -$N(R^{3a})COR^{3a}$, -$N(R^3a)C(O)N(R^{3a})$, $C_{1-6}$ alkilo, $C_{3-8}$karbociklo, turinčio nuo 0 iki 3 heteroatomų, parinktų iš N, O ir S ir

fenilo, ir $C_{1-6}$ alkilas, $C_{3-8}$karbociklas ir fenilas yra pakeisti nuo 0 iki 3 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, -OR3a, -CN, $-CO_2R^{3a}$, $-C(O)N(R^{3a})_2$, $-N(R^{3a})_2$, $-N(R^{3a})CO_2R^{3a}$, $-SR^{3a}$, $-S(O)R^{3a}$, $-S(O_2)R^{3a}$, $-N(R^{3a}$, $SO_2R^{3a}$, $N(R^{3a})CO_2R^{3a}$, $-N(R^{3a})C(O)N(R^{3a})$, $C_{1-6}$ alkilo, $-O-C_{1-6}$ alkilo, $-S-C_{1-6}$ alkilo ir $C_{3-8}$ cikloalkilo;

*u* yra nuo 0 iki 4,

kiekvienas $R^3$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, $C_{1-6}$ alkilo, -OH, $-O-C_{1-6}$ alkilo ir $C_{3-8}$ cikloalkilo, ir kiekvienas $R^{3a}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, $C_{1-6}$ alkilo ir $C_{3-8}$ cikloalkilo;

kiekvienas $R^2$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, $-OR^{4a}$, -CN, $-CO_2R^{4a}$, $-C(O)R^{4a}$, $-C(O)N(R^{4a})_2$, $-N(R^{4a})_2$, $-N(R^{4a})COR^4$, $-N(R^{4a})CO_2R^{4a}$, $-N(R^{4a})C(O)N(R^{4a})$, $-N(R^{4a})SO_2R^{4a}$, $-SR^{4a}$, $-S(O)R^{4a}$, $-S(O_2)R^{4a}$, $C_{1-6}$ alkilo, pakeisto nuo 0 iki 4 $R^4$ ir $C_{3-8}$ cikloalkilo, pakeisto nuo 0 iki 4 $R^4$,

v yra nuo 0 iki 4,

kiekvienas $R^4$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, -OH, $C_{1-6}$ alkilo ir $C_{3-8}$ cikloalkilo;

kiekvienas $R^{4a}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, $C_{1-6}$ alkilo ir $C_{3-8}$ cikloalkilo;

kur minėtas

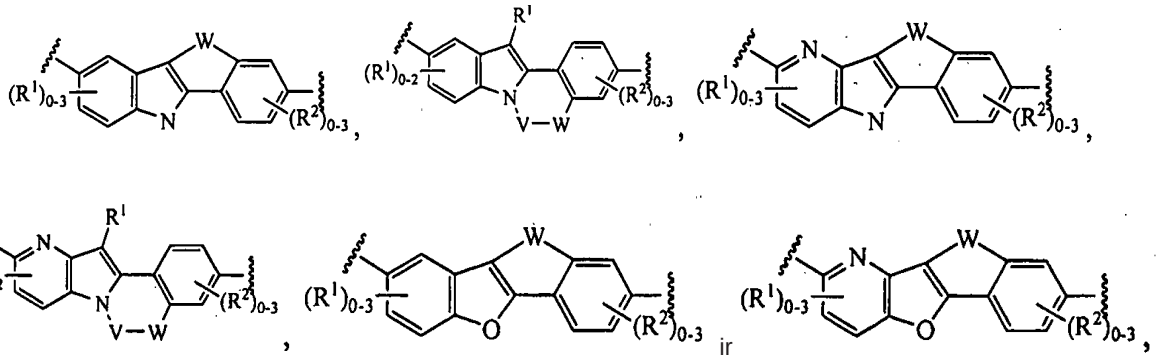



ir minėtas




kartu su vienu minėtu pakaitu $R^1$ ir vienu minėtu pakaitu $R^2$ sudaro 5-9-narį karbociklinį žiedą, turintį 1 arba 2 heteroatomus, nepriklausomai parinktus iš grupės, susidedančios iš N, O ir S,

pavaizduotus grupe, parinkta iš grupės, susidedančios iš:



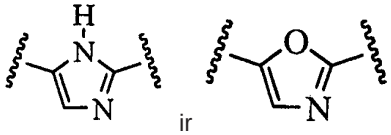

kur

W yra parinktas iš grupės, susidedančios iš $-(CH_2)_{1-3}$-, $-(CH_2)_{0-2}NH(CH_2)_{0-2}$, $-(CH_2)_{0-2}N(C_{1-6}$ alkil)$(CH_2)_{0-2}$-, $-(CH_2)_{0-2}O(CH_2)_{0-2}$- ir $-(CH_2)_{0-2}C(O)(CH_2)_{0-2}$-, kur W yra pakeistas 0-4 $R^w$, kur kiekvienas $R^w$ yra nepriklausomai parinktas iš $C_{1-6}$ alkilo ir $C_{3-8}$ cikloalkilo;

V yra parinktas iš grupės, susidedančios iš -C(O)- ir $-CH_2$-, ir kur V yra $-CH_2$-, V yra pakeistas

0-2 $R^v$, kur kiekvienas $R^v$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios $C_{1-6}$ alkilo ir $C_{3-8}$ cikloalkilo;

kiekvienas D yra grupė, neprilausomai parinkta iš

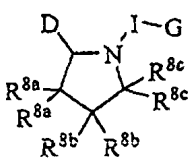


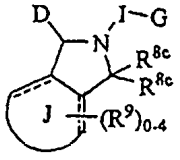

kiekvienas E yra grupė, neprilausomai parinkta iš grupės, susidedančios iš:

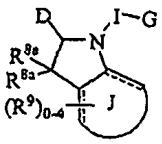
(a) viengubo ryšio,

(b) $-(C(R^7)_2)_{0-2}NR^7C(O)O_{0-1}$-, ir

(c) pirolidinilo darinio, parinkto iš grupės, susidedančios iš:



,


ir


,

I yra dvivalentė grupė, parinkta iš -C(O)-, -$CO_2$- ir -C(O)N($R^7$)-,

J yra kondensuoto žiedo sistema, parinkta iš grupės, susidedančios iš 3-7-nario karbociklo ir 5- arba 6-nario arilo žiedų, turinčių 0-4 heteroatomus, nepriklausomai parinktus iš grupės, susidedančios iš N, O ir S, ir pakeistų prie C arba N atomų $R^9$ pakaitais,

kiekvienas $R^{8a}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, -OH, -$OC_{1-6}$ alkilo ir $C_{1-6}$ alkilo, arba du $R^{8a}$ kartu gali sudaryti okso, kiekvienas $R^{8b}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, -OH, -$OC_{1-6}$ alkilo ir $C_{1-6}$ alkilo, arba du R8b kartu gali sudaryti okso, kiekvienas $R^{8c}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio ir $C_{1-6}$ alkilo,

arba bet kurios dvi grupės, parinktos iš $R^{8a}$, $R^{8b}$ ir $R^{8c}$ kartu gali sudaryti spiro-biciklinį arba tiltelinį biciklinį žiedą;

kiekvienas $R^9$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, $C_{1-6}$ alkilo, -O-$C_{1-6}$ alkilo, -S-$C_{1-6}$ alkilo, -NH-$C_{1-6}$ alkilo ir -NHC(O)-$C_{1-6}$ alkilo,

kiekvienas $R^7$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, $C_{1-6}$ alkilo ir fenilo, ir $C_{1-6}$ alkilas ir fenilas yra pakeisti 0-3 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, $C_{1-6}$ alkilo, -O-$C_{1-6}$ alkilo ir -S-$C_{1-6}$ alkilo; ir kiekvienas G yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš:

(a) vandenilio,

(b) -$OR^{10a}$,

(c) -CN,

(d) -$CO_2R^{10a}$,

(e) -C(O)N(R10)$_2$,

(f) -$SR^{10a}$,

(g) -S(O)$R^{10a}$,

(h) -S($O_2$)$R^{10a}$,

(i) -N($R^{10}$)$_2$,

(j) -N($R^{10}$)$SO_2R^{10a}$,

(k) -$NCO_2R^{10a}$,

(l) =NC(O)N($R^{10}$)$_2$,

(m) $C_{1-6}$ alkilo, turinčio 0-4 pakaitus $R^{11}$,

kiekvienas $R^{11}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš:

(i) -OH,

(ii) -N($R^{10}$)$_2$,

(iii) =$NR^{10}$,

(iv) -O-$C_{1-6}$ alkil,

(v) -C(O)$R^{10}$,

(vi) -S-$C_{1-6}$ alkilo,

(vii) -$SO_2$-$C_{1-6}$ alkilo,

(viii) 3-8-nario karbociklo, turinčio 0-3 heteroatomus, nepriklausomai parinktus iš grupės, susidedančios iš N, O ir S, ir turinčio 0-3 pakaitus $R^{12}$ prie N arba C atomų, ir kiekvienas $R^{12}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, $C_{1-6}$ alkilo, turinčio 0-3 pakaitus, parinktus iš $R^{10}$, -O-$C_{1-6}$ alkilo, -S-$C_{1-6}$ alkilo, -$OR^{10a}$, -CN, -C(O)$R^{10}$, -$CO_2R^{10a}$, -C(O)N($R^{10}$)$_2$, -$SR^{10a}$, -S(O)$R^{10a}$, -S($O_2$)$R^{10a}$, -N($R^{10}$)$SO_2R^{10a}$, -$NCO_2R^{10a}$, -NC(O)N($R^{10}$)$_2$ ir- N($R^{10}$)$_2$, arba dviejų $R^{12}$ kartu sudaro okso, ir

(ix) 5-6-nario arilo, turinčio 0-3 heteroatomus, nepriklausomai parinktus iš grupės, susidedančios iš N, O ir S, ir turintis 0-3 pakaitus $R^{13}$ prie N arba C atomų, ir kiekvienas $R^{13}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, $C_{1-6}$ alkilo, -O-$C_{1-6}$ alkilo ir 3-8-nario karbociklo, turinčio 0-3 heteroatomus, nepriklausomai parinktus iš grupės, susidedančios iš N, O ir S,

(n) 3-8-nario karbociklų, turinčių 0-3 heteroatomus, nepriklausomai parinktus iš grupės, susidedančios iš N, O ir S, ir turinčių 0-3 pakaitus $R^{10}$ prie N arba C atomų; ir

(o) arilo žiedo sistemos G', parinktos iš grupės, susidedančios iš:

(i) 5-7-narių monociklinių žiedų sistemų ir

(ii) 8-10-narių biciklinių žiedų sistemų,

ir arilo žiedo sistema G', turinti 0-4 heteroatomus, nepriklausomai parinktus iš grupės, susidedančios iš N, O ir S, ir pakeistus prie C arba N atomų 0-3 pakaitais $R^{10}$;

kiekvienas $R^{10}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš

(i) vandenilio,

(ii) -CN,

(iii) $C_{1-6}$ alkilo,

(iv) -O-$C_{1-6}$ alkilo,

(v) -S-$C_{0-6}$ alkilo,

(vi) $C_{1-6}$ alkil-O-$R^{14}$,

(vii) -C(O)$R^{14}$,

(viii) -$CO_2R^{14}$,

(ix) -$SO_2R^{14}$,

(x) -N($R^{14}$)$_2$,

(xi) -N($R^{14}$)$SO_2R^{14}$,

(xii) -$NCO_2R^{14}$,

(xiii) -NC(O)N($R^{14}$)$_2$, ir

(xiv) 3-8-narių karbociklų, turinčių 0-3 heteroatomus, nepriklausomai parinktus iš grupės, susidedančios iš N, O ir S arba du $R^{10}$ gali kartu sudaryti okso;

kiekvienas $R^{10a}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš

(i) vandenilio,

(ii) -CN,

(iii) $C_{1-6}$ alkilo,

(iv) $C_{1-6}$ alkil-O-$R^{14}$,

(v) -C(O)$R^{14}$,

(vi) -$CO_2R^{14}$,

(vii) -$SO_2R^{14}$,

(x) -N($R^{14}$)$_2$,

(xi) -N($R^{14}$)$SO_2R^{14}$,

(xii) -$NCO_2R^{14}$,

(xiii) -NC(O)N($R^{14}$)$_2$, ir

(xiv) 3-8-narių karbociklų, turinčių 0-3 heteroatomus, nepriklausomai parinktus iš grupės, susidedančios iš N, O ir S,

ir dvi $R^{10}$ arba $R^{10a}$ grupės kartu su N atomu, su kuriuo jie yra sujungti, sudaro žiedą, kuris gali būti pakeistas 0-3 pakaitais $R^{14}$, ir

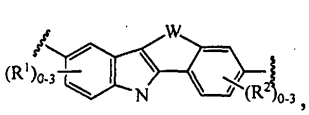
kiekvienas $R^{14}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, $C_{1-6}$ alkilo, $C_{3-8}$ cikloalkilo, -($CH_2$)$_{0-3}$$C_{3-8}$ cikloalkilo ir fenilo; arba junginys yra metil [(2*S*)-1-{(2*S*)-2-[5-(10-{2-[(2*S*)-1-{(2*S*)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1*H*-imidazol-5-il}-6-fenilindolo[1,2-c][1,3]benzoksazin-3-il)-1*H*-imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il]karbamatas.

2. Junginys pagal 1 punktą, kur minėtas

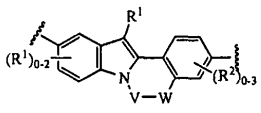



ir

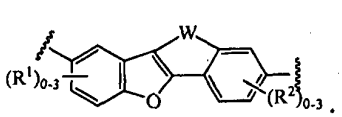
kartu su vienu minėtu pakaitu $R^1$ ir vienu minėtu pakaitu $R^2$, yra pavaizduoti grupe, parinkta iš grupės, susidedančios iš:




,




ir

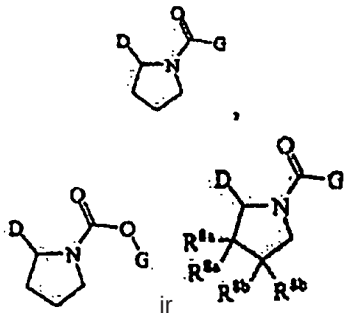



.

3. Junginys pagal 2 punktą, kur W yra parinktas iš grupės, susidedančios iš -$CH_2$-, -NH-, -N($C_{1-6}$ alkil)-, -C(O)-, -$CH_2$NH-, -$CH_2$N($C_{1-6}$ alkil)-, -$CH_2CH_2$-, -C(O)$CH_2$-, -$CH_2$C(O)-, -$CH_2$O-, -$CH_2CH_2CH_2$-, -C(O)$CH_2CH_2$-, -$CH_2$C(O)$CH_2$-

, $-CH_2OCH_2-$, $-CH_2CH_2C(O)-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2NH-$, $-CH_2CH_2N(C_{1-6}\text{alkil})-$, $-CH_2NHCH_2-$, $-CH_2N(C_{1-6}\text{alkil})CH_2-$, $-NHCH_2CH_2-$, ir $-N(C_{1-6}\text{alkil})CH_2CH_2-$

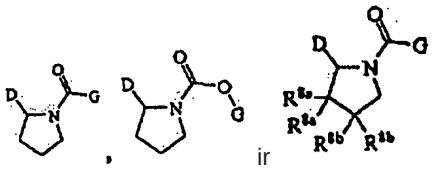
4. Junginys pagal 1, 2 arba 3 punktą, kuri kiekvienas E yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš viengubo ryšio, $-CH_2NHC(O)-$, $-CH_2N(CH_3)C(O)-$, $-C(CH_3)HNHC(O)-$, $-C(CH_3)HN(CH_3)C(O)-$, $-C(CH_3)_2NHC(O)-$, $-C(CH_3)_2N(CH_3)C(O)-$, $-CH_2NHC(O)O-$, $-CH_2N(CH_3)C(O)O-$, $-C(CH_3)HNHC(O)O-$, $-C(CH_3)HN(CH_3)C(O)O-$,- $C(CH_3)_2NHC(O)O-$, $-C(CH_3)_2N(CH_3)C(O)O-$,




ir

kur vienas iš $R^{8a}$ ir $R^{8b}$ yra -OH arba fluoras.

5. Junginys pagal 4 punktą, kur kiekvienas E yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš viengubo ryšio,




ir

kur vienas iš $R^{8a}$ ir $R^{8b}$ yra -OH arba fluoras.

6. Junginys pagal bet kurį iš 1-5 punktų, kur kiekvienas G yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš:

(a) $C_{1-6}$ alkilo, turinčio 0-4 pakaitus $R^{11}$,

(b) 3-8-narių karbociklų, turinčių 0-3 heteroatomus, nepriklausomai parinktus iš grupės, susidedančios iš N, O ir S, ir turinčios 0-3 pakaitus $R^{10}$ prie N arba C atomų; ir

(c) arilo žiedo sistemos G', parinktos grupės, susidedančios iš:

(i) 5-7-narės monociklinio žiedo sistemos ir

(ii) 8-10-narės biciklinio žiedo sistemos,

ir arilo žiedo sistema G', turinti 0-4 heteroatomus, nepriklausomai parinkta iš grupės, susidedančios iš N, O ir S, ir pakeista prie C arba N atomų 0-3 pakaitais $R^{10}$.

7. Junginys pagal bet kurį iš 1-6 punktų, kuri kiekvienas G yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš

(a) vandenilio,

(b) -CN,

(c) $C_{1-5}$ alkilo, turinčio 1-3 pakaitus $R^{11}$,

kiekvienas $R^{11}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš -OH, $-NH_2$, $-NCH_3H$, $-N(CH_3)_2$, $-N(CH_2CH_3)_2$, =NH, $=NCH_3$, -C(O)H, -C(O)OH, $-C(O)CH_3$, $-C(O)OCH_3$, -NHC(O)H, -NHC(O)OH, $-NHC(O)CH_3$, $-NHC(O)OCH_3$, ciklopropilo, ciklobutilo, ciklopentilo, cikloheksilo, piranilo, pirolidinilo, piperidinilo, oksaciklopentilo ir oksacikloheksilo, fenilo, piridinilo, pirimidinilo ir pirolilo, kur

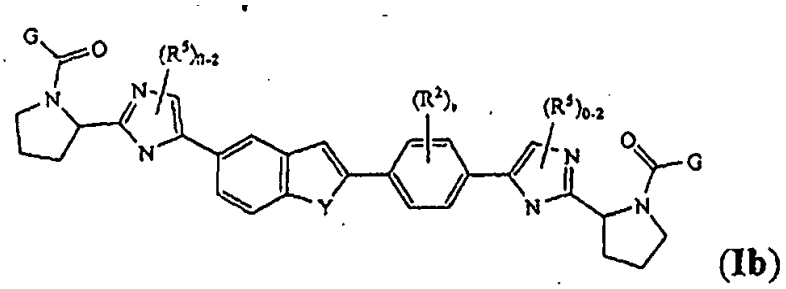
ciklopropilas, ciklobutilas, ciklopentilas, cikloheksilas, piranilas, pirolidinilas, piperidinilas, oksaciklopentilas ir oksacikloheksilas yra pakeisti 0-2 pakaitais $R^{12}$ prie N arba C atomų, ir kiekvienas $R^{12}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, karboksi, $C_{1-6}$ alkilo, $-O-C_{1-6}$ alkilo ir $-S-C_{1-6}$ alkilo; ir

fenilas, piridinilas, pirimidinilas ir pirolilas yra pakeisti 0-3 pakaitais $R^{13}$ prie N arba C atomų, ir kiekvienas $R^{13}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, $C_{1-6}$ alkilo ir 3-8-nario cikloalkilo, turinčio 0-3 heteroatomus, nepriklausomai parinktus iš grupės, susidedančios iš N, O ir S,

(d) ciklopropilo, ciklobutilo, ciklopentilo, cikloheksilo, piranilo, pirolidinilo, piperidinilo, oksaciklopentilo ir oksacikloheksilo, hturinčio 0-3 pakaitus $R^{10}$ prie N arba C atomų, kur minėtas $R^{10}$ nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, karboksi, $C_{1-6}$ alkilo, -O-$C_{1-6}$ alkilo, -S-$C_{1-6}$ alkilo, fenilo ir benzilo, ir (e) arilo žiedo sistemos G', parinktos iš grupės, susidedančios iš: fenilo, piridinilo ir 9-nario biciklinio žiedo sistemos, turinčios 0-2 heteroatomus, nepriklausomai parinktus iš grupės, susidedančios iš N ir O.

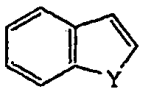
8. Junginys pagal 7 punktą, kur kiekvienas G yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš $C_{1-4}$ alkilo, turinčio 1-2 pakaitus $R^{11}$, kuri kiekvienas $R^{11}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš -OH, -$NH_2$, -$NCH_3H$, -$N(CH_3)_2$, - $N(CH_2CH_3)_2$, -$C(O)OCH_3$, ciklopropilo, ciklobutilo, ciklopentilo, cikloheksilo, piranilo, pirolidinilo, piperidinilo, oksaciklopentilo, oksacikloheksilo, fenilo, piridinilo, pirimidinilo ir pirolilo.

9. Junginys pagal 1 punktą, kur junginys turintis struktūrinę formulę (I) yra junginys, turintis struktūrinę formulę (Ib):

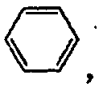


(Ib)

arba jo framaciniu požiūriu priimtina druska, kur minėtas

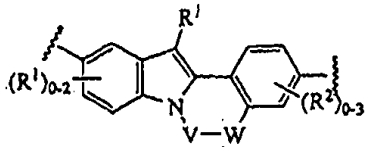


ir minėtas

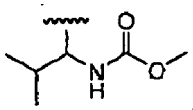


,

kartu su vienu minėtu pakaitu $R^1$ ir vienu minėtu pakaitu $R^2$, yra pavaizduoti



kur V yra -$CH_2$-, W yra -$(CH_2)_{0-2}O(CH_2)_{0-2}$-, $R^1$ yra fluoras, ir abu G pavyzdžiai yra



10. Junginys pagal 4 punktą, kur minėtas

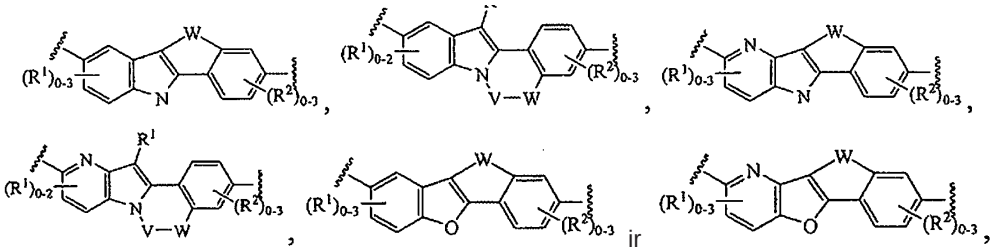


ir minėtas



,

kartu su vienu minėtu pakaitu $R^1$ ir vienu minėtu pakaitu $R^2$, yra pavaizduoti grupe, parinkta iš grupės, susidedančios iš:


ir

kur

W yra parinktas iš grupės, susidedančios iš $-(CH_2)_{1-3}-$, $-(CH_2)_{0-2}NH(CH_2)_{0-2}-$, $-(CH_2)_{0-2}N(C_{1-6}\text{ alkil})(CH_2)_{0-2}-$, $-(CH_2)_{0-2}O(CH_2)_{0-2}-$ ir $-(CH_2)_{0-2}C(O)(CH_2)_{0-2}-$, kur W yra pakeistas 0-4 $R^w$, kur kiekvienas $R^w$ yra nepriklausomai parinktas iš $C_{1-6}$ alkilo ir $C_{3-8}$ cikloalkilo; ir

V yra parinktas iš grupės, susidedančios iš -C(O)- ir $-CH_2-$, ir kur V yra $-CH_2-$, V yra pakeistas 0-2 $R^v$, kur kiekvienas $R^w$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš $C_{1-6}$ alkilo ir $C_{3-8}$ cikloalkilo;

kiekvienas $R^1$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, $-OR^3$, -CN, $-C(O)R^3$, $-CO_2R^3$, $-C(O)N(R^{3a})_2$, $-SR^3$, $-S(O)R^3$, $-S(O_2)R^3$, $-N(R^{3a})_2$, $-(CH_2)_{0-2}N(R^{3a})_2$, $-N(R^{3a})SO_2R^3$, $-N(R^{3a})CO_2R^3$, $-N(R^{3a})COR^3$, $-N(R^{3a})C(O)N(R^{3a})$, $C_{1-6}$ alkilo, $C_{3-8}$karbociklo, turinčio 0-3 heteroatomus, parinktus iš N, O ir S, ir fenilo, ir $C_{1-6}$ alkilas, $C_{3-8}$karbociklas ir fenilas yra pakeisti 0-3 pakaitais, nepriklausomai parinktais iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, $-OR^{3a}$, -CN, $-CO_2R^{3a}$, $-C(O)N(R^{3a})_2$, $-N(R^{3a})_2$, $-N(R^{3a})CO_2R^{3a}$, $-SR^{3a}$, $-S(O)R^{3a}$, $-S(O_2)R^{3a}$, $-N(R^{3a})SO_2R^{3a}$, $-N(R^{3a})CO_2R^{3a}$, $-N(R^{3a})C(O)N(R^{3a})$, $C_{1-6}$ alkilo, $-O-C_{1-6}$ alkilo ir $-S-C_{1-6}$ alkilo,

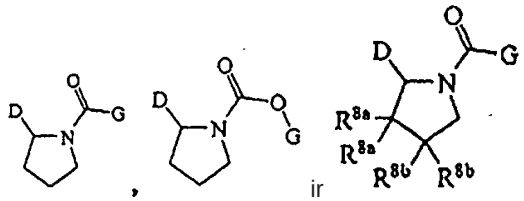
kiekvienas $R^3$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, $C_{1-6}$ alkilo, -OH, $-O-C_{1-6}$alkilo ir $C_{3-8}$ cikloalkilo, ir

kiekvienas $R^{3a}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, $C_{1-6}$ alkilo ir $C_{3-8}$ cikloalkilo;

kiekvienas $R^2$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, $-OR^{4a}$, -CN, $-CO_2R^{4a}$, $-C(O)N(R^{4a})_2$, $-N(R^{4a})_2$, $-N(R^{4a})CO_2R^{4a}$, $-SR^{4a}$, $-S(O)R^{4a}$, $-S(O_2)R^{4a}$, $-N(R^{4a})SO_2R^{4a}$, $-N(R^{4a})CO_2R^{4a}$, $-N(R^{4a})C(O)N(R^{4a})$, $C_{3-6}$ alkilo, pakeisto 0-4 $R^4$ ir $C_{3-8}$ cikloalkilo, pakeisto 0-4 $R^4$,

kiekvienas $R^4$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, -OH, $C_{1-6}$ alkilo ir $C_{3-8}$ cikloalkilo, ir

kur kiekvienas E yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš viengubo ryšio, $-CH_2NHC(O)-$, $-CH_2N(CH_3)C(O)-$, $-C(CH_3)HNHC(O)-$, $-C(CH_3)HN(CH_3)C(O)-$, $-C(CH_3)_2NHC(O)-$, $-C(CH_3)_2N(CH_3)C(O)-$, $-CH_2NHC(O)O-$, $-CH_2N(CH_3)C(O)O-$, $-C(CH_3)HNHC(O)O-$, $-C(CH_3)HN(CH_3)C(O)O-$, $-C(CH_3)_2NHC(O)O-$, $-C(CH_3)_2N(CH_3)C(O)O-$,


ir

kur vienas iš $R^{8a}$ ir $R^{8b}$ yra -OH arba fluoras;

kur kiekvienas G yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios

(a) vandenilio,

(b) -CN,

(c) $C_{1-5}$ alkilo, turinčio 1-3 pakaitus $R^{11}$,

kiekvienas $R^{11}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš -OH, $-NH_2$, $-NCH_3H$, $-N(CH_3)_2$, $-N(CH_2CH_3)_2$, =NH, $=NCH_3$, -C(O)H, -C(O)OH, $-C(O)CH_3$, $-C(O)OCH_3$, -NHC(O)H, -NHC(O)OH, $-NHC(O)CH_3$, $-NHC(O)OCH_3$, ciklopropilo, ciklobutilo, ciklopentilo, cikloheksilo, piranilo, pirolidinilo, piperidinilo, oksaciklopentilo ir oksacikloheksilo, fenilo, piridinilo, pirimidinilo ir pirolilo, kur

ciklopropilas, ciklobutilas, ciklopentilas, cikloheksilas, piranilas, pirolidinilas, piperidinilas, oksaciklopentilas ir oksacikloheksilas yra pakeisti 0-2 pakaitais $R^{12}$ prie N arba C atomų, ir kiekvienas $R^{12}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, karboksi, $C_{1-6}$ alkilo, $-O-C_{1-6}$ alkilo ir $-S-C_{1-6}$ alkilo; ir

fenilas, piridinilas, pirimidinilas ir pirolilas yra pakeisti 0-3 pakaitais $R^{13}$ prie N arba C atomų, ir kiekvienas $R^{13}$ yra nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, C1-6 alkilo ir 3-8-nario cikloalkilo, turinčio 0-3 heteroatomus, nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš N, O ir S,

(d) ciklopropilo, ciklobutilo, ciklopentilo, cikloheksilo, piranilo, pirolidinilo, piperidinilo, oksaciklopentilo ir oksacikloheksilo, turinčio 0-3 pakaitus $R^{10}$ prie N arba C atomų, minėtas $R^{10}$ nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, halogeno, karboksi, $C_{1-6}$ alkilo, $-O-C_{1-6}$ alkilo, $-S-C_{1-6}$ alkilo, fenilo ir benzilo, ir

(e) arilo žiedo sistemos G', parinktos iš grupės, susidedančios iš: fenilo, piridinilo ir 9-nario biciklinio žiedo sistemos, turinčios 0-2 heteroatomus, nepriklausomai parinktus iš grupės, susidedančios iš N ir O.

11. Junginys pagal 1 punktą, parinktas iš:

(2S,2'S)-N,N'-6,11-dihidro-5H-benzo[a]-3,8-diilbis[1-(fenilacetil)pirolidin-2-karboksamido];

dibenzil (2S,2'S)2,2'-(6,-dihidro-5H-benzo[a]kaibazolo-3,8-diildikarbamoil) dipirolidino-1-karboksilato;

di-tret-butil(6,11-dihidro-5H-benzo[a]karbazolo-3,8-diilbis{karbamoil(2S)pirolidino-2,1-diil[(1S)-2-okso-1-feniletan-2,1-diil]})biskarbamato;

(2S,2'S)-N,N',6,11-dihidro-5H-benzo[a]karbazolo-3,8-diilbis{1-[(2R)-2-(dimetilamino)-2-fenilacetil]pirolidino-2-karboksamido};

(2S;2'S)-N,N'-5,6,7,12-tetrahidrobenzo[6,7]cikloheptа[1,2-b]indol-3,9-diilbis{1-[(2R)-2-(dimetilamino)-2-fenilacetil] pirolidino-2-karboksamido};

N-(6,11-dihidro-5H-benzo[a]karbazol-3-il)-1-{(2S)-2-[(3,3-dimetilbutanoil)amino]-2-fenilacetil}-L-prolinamido;

tret-butil{(1R)-2-[(2S)-2-(6,11-dihidro-5H-benzo[a]karbazol-3-ilkarbamoil)pirolidin-1-il]-2-okso-1-feniletil}karbamato;

di-tret-butil(5,6,7,12-tetrahidrobenzo[6,7]cikloheptа[1,2-b]indol-3,9-diilbis{karbamoil(2S)pirolidino-2,1-diil[(1R)-2-okso-1-feniletan-2,1-diil]})biskarbamato;

metil[(2S)-1-{(2S)-2-[5-(10-{2-[(2S)-1-{(2S)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1H-imidazol-5-il} indolo[1,2-c][1,3]benzoksazin-3-il)-1H-imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il]karbamato;

dimetil (indolo[1,2-c][1,3]benzoksazin-3,10-diilbis{1H-imidazol-5,2-diil(2S)pirolidin2,1-diil[(1R)-2-okso-1-feniletan-2,1-diil]})biskarbamato;

metil[(2S)-1-{(2S)-2-[5-(11-{2-[(2S)-1-{(2S)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1H-imidazol-5-il}-6,7-dihidroindolo[1,2-d][1,4]benzoksazepin-3-il)-1H-imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il]karbamato;

metil[(2S)-1-{(2S)-2-[5-(3-{2-[(2S)-1-{(2S)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1H-imidazol-5-il}-6,6-dimetilindolo[1,2-c][1,3]benzoksazin-10-il)-1H-imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il]karbamato;

metil[(2S)-1-{(2S)-2-[5-(12-fiuoro-10-{2-[(2S)-1-{(2S)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1H-imidazol-5-il}-6-metilindolo[1,2-c][1,3]benzoksazin-3-il)-1H-imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il] karbamato;

metil[(2S)-1-{(2S)-2-[5-(3-{2-[(2S)-1-{(2S)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1H-imidazol-5-il} indolo[1,2-c]chinazolin-10-il)-1H-imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il]karbamato;

metil[(2S)-1-{(2S)-2-(5-(12-{2-[(2S)-1-{(2S)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1H-imidazol-5-il}-7,8-dihidro-6H-indolo[1,2-e][1,5]benzoksazocin-3-il)-1H-imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il]karbamato;

metil[(2S)-1-{(2S)-2-[5-(3-{2-[(2S)-1-{(2S)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1H-imidazo1-5-il}-6-okso-5,6-dihidroindolo[1,2-c]chinazolin-10-il)-1H-imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il]karbamato;

metil[(2S)-1-{(2S)-2-[5-(10-{2-[(2S)-1-{(2S)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1H-imidazol-5-il}-6-fenilindolo[1,2-c][1,3]benzoksazin-3-il)-1H-imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il]karbamato;

metil[(2S)-1-{(2S)-2-[5-(3-{2-[(2S)-1-{(2S)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1H-imidazo1-5-il}-6-metilindolo[1,2-c]chinazolin-10-il)-1H-imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il]karbamato;

metil[(2S)-1-{(2S)-2-[5-(10'-{2-[(2S)-1-{(2S)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1H-imidazol-5-il} spiro[ciklohexane-1,6'-indolo[1,2-c][1,3]benzoksazin]-3'-il)-1H-imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il] karbamato;

metil[(2S)-1-{(2S)-2-[5-(1,12-difluoro-10-{2-[(2S)-1-{(2S)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1H-imidazol-5-il}indolo[1,2-c][1,3]benzoksazin-3-il)-1H-imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il]karbamato;

metil[(2S)-1-{(2S)-2-[5-(12-ciano-10-{2-[(2S)-1-{(2S)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1H-imidazol-5-il}indolo[1,2-c][1,3]benzoksazin-3-il)-1H- imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il]karbamato; ir ir jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos.

12. Junginys pagal 11 punktą, kuris yra metil[(2*S*)-1-{(2*S*)-2-[5-(3-{2-[(2*S*)-1-{(2*S*)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1*H*-imidazol-5-il}-6-okso-5,6-dihidroindolo[1,2-c]chinazolin-10-il)-1*H*-imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il]karbamatas ir jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos.

13. Junginys pagal 11 punktą, kuris yra metil [(2*S*)-1-{(2*S*)-2-[5-(10-{2-[(2*S*)-1-{(2*S*)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1*H*-imidazol-5-il}-6-fenilindolo[1,2-c][1,3]benzoksazin-3-il)-1*H*-imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il]karbamatas ir jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos.

14. Junginys pagal 11 punktą, kuris yra metil [(2*S*)-1-{(2*S*)-2-[5-(3-{2-[(2*S*)-1-{(2*S*)-2-[(metoksikarbonil)amino]-3-metilbutanoil}pirolidin-2-il]-1*H*-imidazol-5-il}-6-metilindolo[1,2-c]chinazolin-10-il)-1*H*-imidazol-2-il]pirolidin-1-il}-3-metil-1-oksobutan-2-il]karbamatas ir jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos.

15. Farmacinė kompozicija, apimanti efektyvų kiekį junginio pagal bet kurį iš 1-14 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, ir farmaciniu požiūriu priimtinas nešiklis.

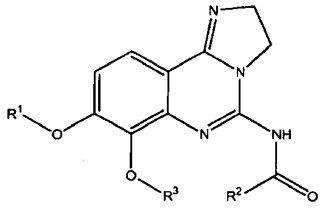
16. Junginys pagal bet kurį iš 1-14 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, skirtas panaudoti žmogaus kūno terapinio gydymo būde.

17. Junginys pagal 16 punktą, kur terapija yra HCV gydymas.

18. Panaudojimas junginio pagal bet kurį iš 1-15 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos gamybai medikamento, skirto HCV gydymui.

---

*(51)* Int.Cl. ***C07D 487/04*** (2006.01)
***A61K 31/519*** (2006.01)
***A61K 31/5377*** (2006.01)
*(11)* **2096919**
*(96)* 07862580.3
*(96)* 2007-12-05
*(97)* 2009-09-09
*(97)* 2016-03-02
*(86)* PCT/US2007/024985
*(86)* 2007-12-05
*(87)* WO 2008/070150
*(87)* 2008-06-12
*(30)* 873090 P, 2006-12-05, US
*(72)* HENTEMANN, Martin, US
WOOD, Jill, US
SCOTT, William, US
MICHELS, Martin, DE
CAMPBELL, Ann-Marie, US
BULLION, Ann-Marie, US
ROWLEY, R. Bruce, US
REDMAN, Aniko, US
*(73)* Bayer Intellectual Property GmbH, 40789 Monheim, DE
*(74)* Liudmila GERASIMOVIČ, 9, IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius, LT
*(54)* Pakeistieji 2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolino dariniai, naudingi hiperproliferacinių ligų ir su angiogeneze susijusių ligų gydymui
Apibrėžties punktai: 47, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Junginys, kurio formulė




arba jo fiziologiniu požiūriu priimtina druska, solvatas, hidratas arba stereoizomeras, kur:
$R^1$ yra $-(CH_2)_n-(CHR^4)-(CH_2)_m-N(R^5)(R^{5'})$;
$R^2$ yra heteroarilas, nebūtinai turintis pakaitais 1, 2 arba 3 $R^6$ grupes;
$R^3$ yra alkilas arba cikloalkilas;
$R^4$ yra vandenilis, hidroksi arba alkoksi ir $R^5$ ir $R^{5'}$ gali būti vienodi arba skirtingi ir nepriklausomai yra vandenilis, alkilas, cikloalkilalkilas arba alkoksialkilas, arba $R^5$ ir $R^{5'}$ gali būti paimti kartu su azoto atomu, prie kurio jie yra prijungti, kad sudarytų 3-7 narių azotą turintį heterociklinį žiedą, nebūtinai turintį bent vieną papildomą heteroatomą,

pasirinktą iš deguonies, azoto arba sieros, ir kuris nebūtinai gali turėti pakaitais vieną arba kelias $R^{6'}$ grupes, arba $R^4$ ir $R^5$ gali būti paimti kartu su atomais, prie kurių jie yra prijungti, kad sudarytų 5- 6 narių azotą turintį heterociklinį žiedą, nebūtinai turintį vieną arba kelis azoto, deguonies arba sieros atomus, ir kuris nebūtinai gali turėti pakaitais vieną arba kelias $R^{6'}$ grupes;

$R^6$ kiekvienu atveju gali būti vienodi arba skirtingi ir yra nepriklausomai halogenas, alkilas, alkenilas, alkinilas, cikloalkilas, cikloalkilalklilas, arilas, arilalkilas, heteroarilas, heteroarilalkilas, heterociklinis žiedas, heterociklilalkilas, alkil-$OR^7$, alkil-$SR^7$, alkil-$N(R^7)(R^{7'})$, alkil-$COR^7$, -CN, -$COOR^7$, -$CON(R^7)(R^{7'})$, -$OR^7$, -$SR^7$, -$N(R^7)(R^{7'})$ arba -$NR^7COR^7$, kurių kiekvienas nebūtinai gali turėti pakaitais vieną arba kelias $R^8$ grupes;

$R^{6'}$ kiekvienu atveju gali būti vienodi arba skirtingi ir yra nepriklausomai alkilas, cikloalkilalkilas arba alkil-$OR^7$;

$R^7$ ir $R^{7'}$ kiekvienu atveju gali būti vienodi arba skirtingi ir yra nepriklausomai vandenilis, alkilas, alkenilas, alkinilas, cikloalkilas, cikloalkilalkilas, cikloalkenilas, arilas, arilalkilas, heteroarilas, heterociklinis žiedas, heterociklilalkilas arba heteroarilalkilas;

$R^8$ kiekvienu atveju yra nepriklausomai nitro, hidroksi, ciano, formilas, acetilas, halogenas, amino, alkilas, alkoksi, alkenilas, alkinilas, cikloalkilas, cikloalkilalkilas, cikloalkenilas, arilas, arilalkilas, heteroarilas, heterociklinis žiedas, heterociklilalkilas arba heteroarilalkilas;

n yra sveikas skaičius nuo 1 iki 4 ir m yra sveikas skaičius nuo 0 iki 4, su išlyga, kad, jei $R^4$ ir $R^5$ yra paimti kartu su atomais, prie kurių jie yra prijungti, kad sudarytų 5- 6- narių azoto turintį žiedą, tai $n + m \leq 4$.

2. Junginys pagal 1 punktą, kur $R^2$ yra azoto turintis heteroarilas, nebūtinai turintis pakaitais 1, 2 arba 3 $R^6$ grupes.

3. Junginys pagal 1 punktą, kur $R^5$ ir $R^{5'}$ nepriklausomai yra alkilas.

4. Junginys pagal 1 punktą, kur $R^5$ ir $R^{5'}$ yra paimti kartu su azoto atomu, prie kurio jie yra prijungti, kad sudarytų 5-6 narių azoto turintį heterociklinį žiedą, turintį bent vieną papildomą heteroatomą, kuris yra pasirinktas iš deguonies, azoto arba sieros, ir kuris nebūtinai gali turėti pakaitais vieną arba kelias $R^{6'}$ grupes.

5. Junginys pagal 1 punktą, kur $R^4$ yra hidroksi.

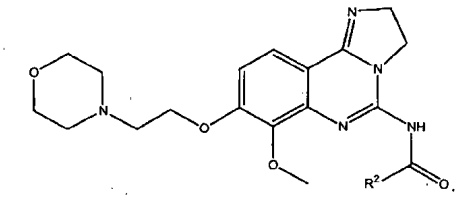
6. Junginys pagal 1 punktą, kur $R^4$ ir $R^5$ yra paimti kartu su atomais, prie kurių jie yra prijungti, kad sudarytų 5-6 narių azoto turintį heterociklinį žiedą, nebūtinai turintį vieną arba kelis azoto, deguonies arba sieros atomus, ir kuris nebūtinai gali turėti pakaitais vieną arba kelias $R^{6'}$ grupes.

7. Junginys pagal 1 punktą, kur $R^3$ yra metilas.

8. Junginys pagal 1 punktą, kur $R^2$ yra piridinas, piridazinas, pirimidinas, pirazinas, pirolas, oksazolas, tiazolas, furanas arba tiofenas, nebūtinai turintis pakaitais 1, 2 arba 3 $R^6$ grupes.

9. Junginys pagal 2 punktą, kur $R^2$ yra piridinas, piridazinas, pirimidinas, pirazinas, pirolas, oksazolas arba tiazolas, nebūtinai turintis pakaitais 1, 2 arba 3 $R^6$ grupes.

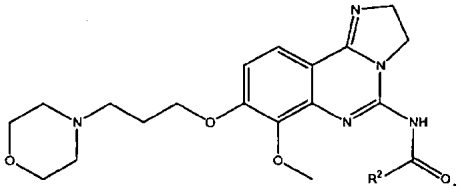
10. Junginys pagal 1 punktą, kurio formulė




11. Junginys pagal 10 punktą, kur $R^2$ yra piridinas, piridazinas, pirimidinas, pirazinas, pirolas, oksazolas, tiazolas, furanas arba tiofenas, nebūtinai turintis pakaitais 1, 2 arba 3 $R^6$ grupes.

12. Junginys pagal 11 punktą, kur $R^2$ yra piridinas, piridazinas, pirimidinas, pirazinas, pirolas, oksazolas arba tiazolas, nebūtinai turintis pakaitais 1, 2 arba 3 $R^6$ grupes.

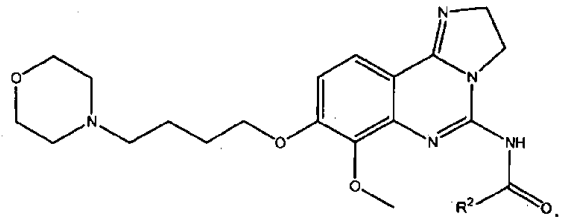
13. Junginys pagal 1 punktą, kurio formulė



14. Junginys pagal 13 punktą, kur $R^2$ yra piridinas, piridazinas, pirimidinas, pirazinas, pirolas, oksazolas, tiazolas, furanas arba tiofenas, nebūtinai turintis pakaitais 1, 2 arba 3 $R^6$ grupes.

15. Junginys pagal 14 punktą, kur $R^2$ yra piridinas, piridazinas, pirimidinas, pirazinas, pirolas, oksazolas arba tiazolas, nebūtinai turintis pakaitais 1, 2 arba 3 $R^6$ grupes..

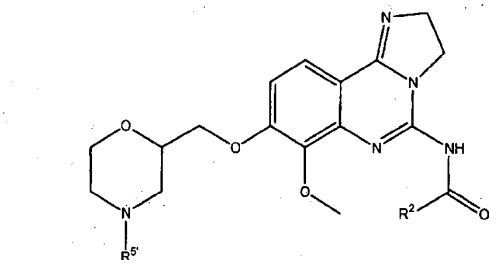
16. Junginys pagal 1 punktą, kurio formulė



17. Junginys pagal 16 punktą, kur $R^2$ yra piridinas, piridazinas, pirimidinas, pirazinas, pirolas, oksazolas, tiazolas, furanas arba tiofenas, nebūtinai turintis pakaitais 1, 2 arba 3 $R^6$ grupes.

18. Junginys pagal 17 punktą, kur $R^2$ yra piridinas, piridazinas, pirimidinas, pirazinas, pirolas, oksazolas arba tiazolas, nebūtinai turintis pakaitais 1, 2 arba 3 $R^6$ grupes.

19. Junginys pagal 1 punktą, kurio formulė

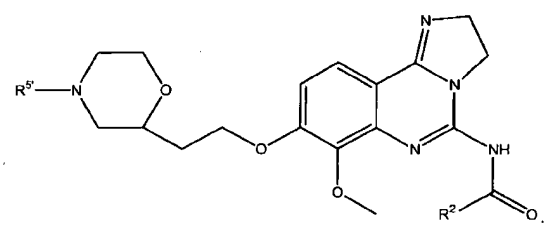


20. Junginys pagal 19 punktą, kur $R^2$ yra piridinas, piridazinas, pirimidinas, pirazinas, pirolas, oksazolas, tiazolas, furanas arba tiofenas, nebūtinai turintis pakaitais 1, 2 arba 3 $R^6$ grupes.

21. Junginys pagal 20 punktą, kur $R^2$ yra piridinas, piridazinas, pirimidinas, pirazinas, pirolas, oksazolas arba tiazolas, nebūtinai turintis pakaitais 1, 2 arba 3 $R^6$ grupes.

22. Junginys pagal 19 punktą, kur $R^{5'}$ yra alkilas.

23. Junginys pagal 1 punktą, kurio formulė



24. Junginys pagal 23 punktą, kur $R^2$ yra piridinas, piridazinas, pirimidinas, pirazinas, pirolas, oksazolas, tiazolas, furanas arba tiofenas, nebūtinai turintis pakaitais 1, 2 arba 3 $R^6$ grupes.

25. Junginys pagal 24 punktą, kur $R^2$ yra piridinas, piridazinas, pirimidinas, pirazinas, pirolas, oksazolas arba tiazolas, nebūtinai turintis pakaitais 1, 2 arba 3 $R^6$ grupes.

26. Junginys pagal 23 punktą, kur $R^5$ yra alkilas.

27. Jungiai pagal bet kurį vieną iš ankstesnių punktų, būtent:

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]pirimidin-5-karboksamidas;

N-(8-{3-[(2R,6S)-2,6-dimetilmorfolin-4-il]propoksi}-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il)nikotinamidas;

N-(8-{3-[(2R,6S)-2,6-dimetilmorfolin-4-il]propoksi}-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il)-2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-karboksamidas;

2-amino-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-1,3-tiazol-5-karboksamidas;

2-amino-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]izonikotinamidas;

2-amino-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-4-metil-1,3-tiazol-5-karboksamidas;

2-amino-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-4-propilpirimidin-5-karboksamidas;

N-{8-[2-(4-etilmorfolin-2-il)etoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}nikotinamidas;

N-{8-[2-(dimetilamino)etoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}pirimidin-5-karboksamidas;

N-(8-{3-[2-(hidroksimetil)morfolin-4-il]propoksi}-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il)nikotinamidas;

N-(8-{3-[2-(hidroksimetil)morfolin-4-il]propoksi}-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il)nikotinamidas;

N-{8-[3-(dimetilamino)propoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}nikotinamido 1-oksidas;

2-amino-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]pirimidin-5-karboksamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-6-(2-pirolidin-1-iletil)nikotinamidas;

6-(ciklopentilamino)-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;

N-[8-(2-hidroksi-3-morfolin-4-ilpropoksi)-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;

N-{7-metoksi-8-[3-(3-metilmorfolin-4-il)propoksi]-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}nikotinamidas;

N-(8-{3-[2-(hidroksimetil)morfolin-4-il]propoksi}-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il)nikotinamidas;

N-(8-{2-[4-(ciklobutilmetil)morfolin-2-il]etoksi}-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il)nikotinamidas;

N-(7-metoksi-8-{2-[4-(2-metoksietil)morfolin-2-il]etoksi}-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il)nikotinamidas;

N-{8-[(4-etilmorfolin-2-il)metoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}nikotinamidas;

N-(7-metoksi-8-{[4-(2-metoksietil)morfolin-2-il]metoksi}-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il)nikotinamidas;

N-{7-metoksi-8-[(4-metilmorfolin-2-il)metoksi]-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}nikotinamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]pirimidin-4-karboksamidas;

2-amino-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]pirimidin-4-karboksamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-1-metil-1H-imidazol-4-karboksamidas;

rel-N-(8-{3-[(2R,6S)-2,6-dimetilmorfolin-4-il]propoksi}-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il)pirimidin-5-karboksamidas;

rel-N-(8-{3-[(2R,6S)-2,6-dimetilmorfolin-4-il]propoksi}-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il)-6-metilnikotinamidas;

rel-6-acetamido-N-(8-{3-[(2R,6S)-2,6-dimetilmorfolin-4-il]propoksi}-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il)nikotinamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-1-metil-1H-imidazol-5-karboksamidas;

6-amino-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-2-metilnikotinamidas;

2-amino-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-4-metilpirimidin-5-karboksamidas;

6-amino-5-brom-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;

2-amino-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-1,3-oksazol-5-karboksamidas;

N-[7-metoksi-8-(morfolin-2-ilmetoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;

2-{[2-(dimetilamino)etil]amino}-N-{8-[3-(dimetilamino)propoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il} pirimidin-5-karboksamidas;

2-amino-N-{8-[3-(dimetilamino)propoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}-1,3-tiazol-5-karboksamidas;

rel-2-amino-N-(8-{3-[(2R,6S)-2,6-dimetilmorfolin-4-il]propoksi}-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il) pirimidin-5-karboksamidas;

rel-6-amino-N-(8-{3-[(2R,6S)-2,6-dimetilmorfolin-4-il]propoksi}-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il) nikotinamidas;

2-[(2-hidroksietil)amino]-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]pirimidin-5-karboksamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-2-[(3-metoksipropil)amino]pirimidin-5-karboksamidas;

2-amino-N-{8-[3-(dimetilamino)propoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}pirimidin-5-karboksamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-2-[(3-morfolin-4-ilpropil)amino] pirimidin-5-karboksamidas;

2-[(2-metoksietil)amino]-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]pirimidin-5-karboksamidas;

2-{[2-(dimetilamino)etil]amino}-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il] pirimidin-5-karboksamidas;

6-amino-N-{8-[3-(dimetilamino)propoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}nikotinamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-2-pirolidin-1-ilpirimidin-5-karboksamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-2-(4-metilpiperazin-1-il)pirimidin-5-karboksamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-2-morfolin-4-ilpirimidin-5-karboksamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-6-piperazin-1-ilnikotinamido hidrochloridas;

6-[(3S)-3-aminopirolidin-1-il]-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il] nikotinamido hidrochlorido hidratas;

6-[(3R)-3-aminopirolidin-1-il]-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il] nikotinamido hidrochloridas;

6-[(4-fluorbenzil)amino]-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il] nikotinamidas;

6-[(2-furilmetil)amino]-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il] nikotinamidas;

6-[(2-metoksietil)amino]-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il] nikotinamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-6-(1H-pirol-1-il)nikotinamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-6-morfolin-4-ilnikotinamidas;

N-{7-metoksi-8-[3-(metilamino)propoksi]-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}nikotinamidas;

6-[(2,2-dimetilpropanoil)amino]-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il] nikotinamidas;

6-[(ciklopropilkarbonil)amino]-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il] nikotinamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-6-(2,2,2-trifluoretoksi) nikotinamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-6-(trifluormetil)nikotinamidas;

6-(izobutirilamino)-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;

N-{7-metoksi-8-[3-(4-metilpiperazin-1-il)propoksi]-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}nikotinamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-2-{[(metilamino)karbonil]amino}-1,3-tiazol-4-karboksamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-6-{[(metilamino)karbonil]amino} nikotinamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-2-(metilamino)-1,3-tiazol-4-karboksamidas;

N-[7-metoksi-8-(2-morfolin-4-iletoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
N-{8-[2-(dimetilamino)etoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}-2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-karboksamidas;
N-{8-[2-(dimetilamino)etoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}-6-metilnikotinamidas;
6-{[(izopropilamino)karbonil]amino}-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-6-pirolidin-1-ilnikotinamidas;
6-(dimetilamino)-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
N-[7-metoksi-8-(3-piperidin-1-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
N-[7-metoksi-8-(2-pirolidin-1-iletoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
N-[7-metoksi-8-(2-piperidin-1-iletoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
6-{[(etilamino)karbonil]amino}-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
6-fluor-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
2-amino-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-1,3-oksazol-4-karboksamidas;
2-(etilamino)-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-1,3-tiazol-4-karboksamidas;
N-[7-metoksi-8-(3-morfoiin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]pirazin-2-karboksamidas;
N-[8-(2-aminoetoksi)-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
6-amino-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]izonikotinamidas;
N-{8-[3-(dietilamino)propoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}nikotinamidas;
N-{8-[2-(diizopropilamino)etoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}nikotinamidas;
N-{8-[2-(dietilamino)etoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}nikotinamidas;
N-{8-[3-(dimetilamino)propoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}nikotinamidas;
N-{8-[2-(dimetilamino)etoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}nikotinamidas;
N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-2-(metilamino)pirimidin-5-karboksamidas;
N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-2-(metiltio)pirimidin-5-karboksamidas;
N-[8-(3-aminopropoksi)-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamido trifluoracetatas;
N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]tiofen-2-karboksamidas;
N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-karboksamidas;
2-metoksi-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]pirimidin-5-karboksamidas;
N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-3-furamidas;
N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]tiofen-3-karboksamidas;
N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-2-metil-1,3-tiazol-4-karboksamidas;
6-metoksi-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
5-metoksi-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-6-metilnikotinamidas;
6-(acetilamino)-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
arba jo fiziologiniu požiūriu priimtina druska, solvatas, hidratas arba stereoizomeras.

28. Junginiai pagal bet kurį vieną iš 1-26 punktų, būtent:
N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-6-metilnikotinamidas;
5-metoksi-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;
N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]-2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-karboksamidas;
N-{8-[2-(dimetilamino)etoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}nikotinamidas;

N-{8-[3-(dimetilamino)propoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}nikotinamidas;

6-{[(izopropilamino)karbonil]amino}-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il] nikotinamidas;

N-{8-[2-(dimetilamino)etoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}-2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-karboksamidas;

N-[7-metoksi-8-(2-morfolin-4-iletoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]nikotinamidas;

rel-6-amino-N-(8-{3-[(2R,6S)-2,6-dimetilmorfolin-4-il]propoksi}-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il) nikotinamidas;

rel-2-amino-N-(8-{3-[(2R,6S)-2,6-dimetilmorfolin-4-il]propoksi}-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il) pirimidin-5-karboksamidas;

2-amino-N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]pirimidin-5-karboksamidas;

N-{8-[2-(dimetilamino)etoksi]-7-metoksi-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il}pirimidin-5-karboksamidas;

N-[7-metoksi-8-(3-morfolin-4-ilpropoksi)-2,3-dihidroimidazo[1,2-c]chinazolin-5-il]pirimidin-5-karboksamidas;

arba jo fiziologiniu požiūriu priimtina druska, solvatas, hidratas arba stereoizomeras.

29. Farmacinė kompozicija, apimanti junginį pagal 1 punktą arba jo fiziologiniu požiūriu priimtiną druską, solvatą, hidratą arba stereoizomerą ir farmaciniu požiūriu priimtiną skiediklį arba nešiklį.

30. Farmacinė kompozicija, pagal 29 punktą, kur junginio yra terapiškai veiksmingas kiekis.

31. Farmacinė kompozicija, pagal 29 punktą, papildomai apimanti bent vieną papildomą veikliąjį junginį.

32. Farmacinė kompozicija, pagal 29 punktą, kur papildomas veiklusis junginys yra anti-hiperproliferacinis, priešuždegiminis, analgetinis, imunoreguliacinis, diuretinis, antiaritminis, anti-hipercholesteroleminis, antidiabetinis, priešdislipideminis, antidiabetinis arba antivirusinis agentas.

33. Farmacinė kompozicija, pagal 32 punktą, kur papildomas veiklusis junginys yra natrio butiratas, trastumazabas, gefitinibas, 17-AAG, sekretinas, alendrono rūgštis, alitretinoinas, alopurinolis, altretaminas, aminogliutetimidas, amifostinas, amrubicinas, amsakrinas, anastrozolas, arglabinas, arseno trioksidas, 5-azacitidinas, azatioprinas, betametazono acetatas, betametazono natrio fosfatas, beksarotenas, bleomicino sulfatas, bortezomibas, busulfanas, kalcitoninas, kapecitabinas, karboplatinas, celmoleikinas, chlorambucilas, cisplatinas, kladribinas, klodrono rūgštis, ciklofosfamidas, citarabinas, dakarbazinas, daktinomicinas, denileukino diftitoksas, dietilstilbestrolis, docetakselis, doksifluridinas, doksorubicinas, dronabinolis, epirubicinas, epoetinas alfa, eptaplatinas, estradiolis, natrio estramustino fosfatas, etinilestradiolis, etidrono rūgštis, etopozidas, fadrozolis, filgrastimas, finasteridas, floksuridinas, flukonazolis, fludarabinas, 5-fluordeoksiuridino monofosfatas, 5-fluoruracilas (5-FU), fluoksimesteronas, flutamidas, formestanas, fotemustinas, fulvestrantas, gamagardas, gemcitabinas, granisetrono HCl, ibritumomabo tiuksetanas, idarubicinas, ifosfamidas, interferonas beta, interleukinas-2, irinotekanas, lentinano sulfatas, letrozolis, levamizolis, levofolino rūgšties kalcio druska, lomustinas, lonidaminas, medroksiprogesterono acetatas, megestrolio acetatas, melfalanas, 6-merkaptopurinas, mesna, metotreksatas, miltefozinas, minociklinas, mitomicinas C, mitotanas, mitoksantronas, nedaplatinas, nilutamidas, oktreotidas, ondansetrono HCl, oksaliplatinas, paklitakselis, pegaspargasas, pentostatinas, pilokarpino HCl, pirarubicinas, plikamicinas, natrio porfimeras, prednimustinas, prednizolonas, prednizonas, prokarbazinas, raltitreksedas, renio-186 etidronatas, rituksimabas, romurtidas, sargramostimas, semustinas, sizofiranas, sobuzoksanas, sparfozino rūgštis**,** streptozocinas, stroncio-89 chloridas, tamoksifenas, tamsulozinas, temozolomidas, tenipozidas, testosterono propionatas, tioguaninas, tiotepa, tiludrono rūgštis, topotekanas, tozitumomabas, trastuzumabas, treosulfanas, tretinoinas, trimetilmelaminas, trimetreksatas, triptorelino acetatas, triptorelino pamoatas, uridinas, valrubicinas, vesnarinonas, vinblastins, vinkristinas, vindezinas, vinorelbinas, zinostatino stimalameras, akolbifenas, aminopterinas, arzoksifenas, azoprisnilas, atamestanas, atrasentanas, BAY 43-9006 (sorafenibas), cetuksimabas, ciproterono acetatas, decitabinas, dutasteridas, eflornitinas, eksatekanas, fenretinidas, histamino dihidrochloridas, ibandrono rūgštis, interferonas gama, iksabepilonas, moliusko limfos hemocianinas, lanreotidas, lazofoksifenas, lonafarnibas, minodronatas, nafarelinas, nemorubicinas, oblimersenas, kvazepamas, raloksifenas, ranpirnazas, 13-cis–retinoinė rūgštis, satraplatinas, seokalcitolis, timozinas alfa 1, tiazofurinas, tipifarnibas, tirapazaminas, toremifenas, valspodaras, vapreotidas, vatalanibas, verteporfinas, vinfluninas, zoledrono rūgštis arba jų deriniai.

34. Įpakuota farmacinė kompozicija, apimanti konteinerį, farmacinę kompoziciją pagal 29 punktą ir farmacinės kompozicijos naudojimo instrukcijas žinduolio ligos arba būklės gydymui.

35. Junginys pagal 1 punktą, skirtas naudoti fosfotidilinozitol-3-kinazės slopinimui ląstelėse.

36. Junginys pagal 1 punktą, skirtas naudoti žinduolių sutrikimo, sąlygoto fosfotidilinozitol-3-kinazės slopinimo, gydymui.

37. Junginys pagal 36 punktą, kur minėtame jo panaudojime fosfotidilinozitol-3-kinazės sąlygotas sutrikimas yra angiogeninis sutrikimas, uždegiminis sutrikimas, autoimuninis sutrikimas, širdies ir kraujagyslių sutrikimas, neurodegeneracinis sutrikimas, metabolinis sutrikimas, nociceptinis sutrikimas, oftalminis sutrikimas, plaučių sutrikimas arba inkstų sutrikimas.

38. Junginys pagal 37 punktą, kur minėtame jo panaudojime širdies ir kraujagyslių sutrikimas yra trombozė, plaučių hipertenzija, širdies hipertrofija, aterosklerozė arba širdies nepakankamumas.

39. Junginys pagal 37 punktą, kur minėtame jo panaudojime uždegiminis sutrikimas yra LOPL (lėtinė obstrukcinė plaučių liga).

40. Junginys pagal 37 punktą, kur minėtame jo panaudojime angiogeninis sutrikimas yra diabetinė retinopatija, išeminė tinklainės venų okliuzija, neišnešiotų naujagimių retinopatija, makulos degeneracija, neovaskuliarinė glaukoma, psoriazė, retrolentalinė fibroplazija, angiofibroma, uždegimas, reumatoidinis artritas, restenozė, in-stento restenozė arba kraujagyslių transplantato restenozė.

41. Junginys pagal 1 punktą, skirtas naudoti žinduolio hiperproliferacinių sutrikimų gydymui.

42. Junginys pagal 41 punktą, kur minėtame jo panaudojime hiperproliferacinis sutrikimas yra vėžys.

43. Junginys pagal 42 punktą, kur minėtame jo panaudojime vėžys yra krūties, kvėpavimo takų, smegenų, reprodukcinių organų, virškinimo trakto, urinarinio trakto, akių, kepenų, odos, galvos ir kaklo, skydliaukės, paraskydliaukės vėžys arba kieto naviko tolimos metastazės.

44. Junginys pagal 42 punktą, kur minėtame jo panaudojime vėžys yra limfoma, sarkoma arba leukemija.

45. Junginys pagal 43 punktą, kur minėtame jo panaudojime minėtas virškinimo trakto vėžys yra koloretalinis vėžys.

46. Junginys pagal 43 punktą, kur minėtame jo panaudojime minėtas kvėpavimo takų vėžys yra nesmulkiųjų ląstelių plaučių karcinoma.

47. Junginys pagal 44 punktą, kur minėtame jo panaudojime minėta limfoma yra ne-Hodžkino limfoma.

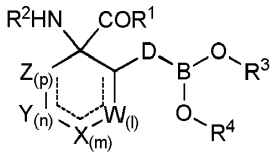
---

*(51)* Int.Cl. ***C07F 5/02*** (2006.01)
***C07F 5/04*** (2006.01)
***A61K 31/69*** (2006.01)
*(11)* **2632927**
*(96)* 11779904.9
*(96)* 2011-10-19
*(97)* 2013-09-04
*(97)* 2016-02-10
*(86)* PCT/US2011/056844
*(86)* 2011-10-19
*(87)* WO 2012/058065
*(87)* 2012-05-03
*(30)* 406760 P, 2010-10-26, US
*(72)* VAN ZANDT, Michael, US
JAGDMANN, JR., Gunnar Erik, US
*(73)* Mars, Incorporated, McLean, VA 22101, US
*(74)* Liucija JANICKAITĖ, 29, Inpatra UAB, Šeškinės g. 59-53, LT-07162 Vilnius, LT

*(54)* Boronatai kaip arginazės inhibitoriai

Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Junginys pagal formulę I,



I

kur

$R^1$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš -OH, $OR^a$, ir $NR^bR^c$;

$R^a$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš vandenilio, linijinės ar šakotos grandinės ($C_1$-$C_6$) alkilo, ($C_3$-$C_8$) cikloalkilo, ($C_3$-$C_{14}$)arilo, ($C_3$-$C_{14}$)heterocikloalkil-($C_1$-$C_6$)alkilen-, ($C_3$-$C_{14}$)heteroaril-($C_1$-$C_6$)alkilen- ir ($C_3$-$C_{14}$)aril($C_1$-$C_6$) alkilen-;

$R^b$ ir $R^c$ kiekvienas nepriklausomai yra pasirinkti iš grupės, susidedančios iš H, -OH, linijinės ar šakotos grandinės ($C_1$-$C_6$) alkilo, -$SO_2$-($C_1$-$C_6$)alkilo, ($C_3$-$C_{14}$)aril-$SO_2$-, ($C_3$-$C_{14}$) heterocikloalkil-($C_1$-$C_6$)alkilen- ir ($C_3$-$C_{14}$)heteroaril-($C_1$-$C_6$) alkilen-;

$R^2$ yra parinktas iš grupės, susidedančios iš H, linijinės ar šakotos grandinės ($C_1$-$C_6$)alkilo ir ($C_1$-$C_6$)alkil-C(O)-;

W, X, Y ir Z kiekvienas nepriklausomai yra parinktas iš grupės, susidedančios iš jungties -C(R')(R"') -, -C(R")$_2$-, -CR"' -, -NR"'-, -N-, -O-, -C(O)- ir -S-, kur ne daugiau kaip trys iš W, X, Y ir Z tuo pat metu žymi jungtį; ir nėra dviejų gretimų narių iš W, X, Y ir Z tuo pačiu metu žyminčių -O-, -S-, -N- arba -NR"'-;

l, m, n ir p nepriklausomai yra sveikieji skaičiai tarp 0 ir 2 imtinai, kur bent vienas iš l, m, n arba p yra ne 0;

pasirinktinai reiškia vieną arba daugiau dvigubų jungčių;

$R^3$ ir $R^4$ kiekvienas nepriklausomai yra pasirinktas iš vandenilio, linijinės ar šakotos grandinės ($C_1$-$C_6$)alkilo ir C(O)-R',

arba $R^3$ ir $R^4$ kartu su boro atomu, prie kurio jie prijungti, sudaro 5-narį arba 6-narį žiedą, kuris yra visiškai prisotintas arba iš dalies prisotintas;

D yra parinktas iš grupės, susidedančios iš linijinės ar šakotos grandinės ($C_3$-$C_5$)alkileno, linijinės ar šakotos grandinės ($C_2$-$C_8$)alkenileno, linijinės ar šakotos grandinės ($C_2$-$C_8$)alkinileno, ($C_3$-$C_{14}$)arileno ir ($C_3$-$C_{14}$)cikloalkileno,

kur viena arba daugiau -$CH_2$- grupių D yra pasirinktinai ir nepriklausomai pakeistos fragmentu, parinktu iš grupės, susidedančios iš O, NR', S, SO, $SO_2$ ir CR'R"; arba

kur bet kurios dvi gretimos -$CH_2$- grupės, pasirinktinai sudaro du ($C_3$-$C_{14}$)-cikloalkilenilo grupės narius; ir

kur dvi gretimos -$CH_2$- grupės tuo pat metu nežymi O, NR', S, SO arba $SO_2$;

R', R" ir R"' yra kiekvienas nepriklausomai parinktas iš grupės, susidedančios iš H, OH, -S(O)$R^d$, S(O)$_2R^d$, ($C_1$-$C_8$) alkilo, ($C_3$-$C_6$)arilo, -$NH_2$, -NH($C_1$-$C_6$)alkilo, -N[($C_1$-$C_6$)alkilo]$_2$, -C(O)N$R^dR^e$, -C(O)($C_1$-$C_6$)alkilo, -C(O)($C_3$-$C_{14}$)arilo, -C(O)O($C_1$-$C_6$)alkilo, -C(O)O($C_3$-$C_{14}$)arilo, ($C_3$-$C_6$)cikloalkilo, ($C_3$-$C_{14}$)heterocikloalkilo, -C(O)($C_3$-$C_{14}$) heterocikloalkilo, ($C_3$-$C_{14}$) heteroarilo, ($C_3$-$C_{14}$)aril($C_1$-$C_6$)alkilen-, -C(O)($C_3$-$C_{14}$)aril-($C_1$-$C_6$)alkilen-, -C(O)($C_3$-$C_{14}$)arilo, ($C_3$-$C_6$)-cikloalkil- ($C_1$-$C_6$) alkilen-, ($C_3$-$C_{14}$) heteroaril- ($C_1$-$C_6$)alkilen-, ($C_3$-$C_{14}$)heterociklo-($C_1$-$C_6$)alkilen-; ir

kur bet kuris alkilas, alkilenas, arilas, heteroarilas, cikloalkilas ar heterocikloalkilas yra pasirinktinai pakeistas vienu arba daugiau narių, parinktų iš grupės, susidedančios iš halogeno, okso grupės, -COOH, -CN, -$NO_2$, -OH, -$NR^dR^e$, -$NR^g$S(O)$_2R^h$, ($C_1$-$C_6$) alkoksi, ($C_3$-$C_{14}$)arilo, ($C_1$-$C_6$) halogenalkilo ir ($C_3$-$C_{14}$)ariloksigrupės;

kur $R^d$, $R^e$, $R^g$ ir $R^h$ kiekvienas nepriklausomai yra pasirinktas iš grupės, susidedančios iš H, linijinės arba šakotos grandinės ($C_1$-$C_6$)alkilo, pasirinktinai pakeisto ($C_3$-$C_{14}$)aril($C_1$-$C_6$) alkilen-, pasirinktinai pakeisto ($C_3$-$C_{14}$)arilo, ($C_1$-$C_6$) hidroksialkilo, ($C_1$-$C_6$)aminoalkilo, $H_2$N($C_1$-$C_6$)alkilen-, pasirinktinai pakeisto ($C_3$-$C_6$) cikloalkilo, pasirinktinai pakeisto ($C_3$-$C_{14}$)heterocikloalkilo, pasirinktinai pakeisto ($C_3$-$C_{14}$)heteroarilo, pasirinktinai pakeisto ($C_3$-$C_{14}$)aril($C_1$-$C_6$)alkilen-, NR'R"C(O)- ir ($C_3$-$C_6$)aril-($C_3$-$C_{14}$)-cikloalkileno-,

arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, stereoizomeru arba tautomeru;

su išlyga, kad formulės I junginys yra ne 1-amino-2-(3-boronopropil)cikloheksano karboksilo rūgštis.

2. Junginys pagal 1 punktą, kur D yra linijinės arba šakotos grandinės ($C_3$-$C_5$)alkilenas.

3. Junginys pagal 2 punktą, kur D yra propilenas.

4. Junginys pagal 3 punktą, kur $R^1$ yra -OH.

5. Junginys pagal 4 punktą, kur kiekvienas iš $R^2$, $R^3$ ir $R^4$ yra vandenilis.

6. Junginys pagal 5 punktą, kur kiekvienas iš W, X, Y ir Z yra -C(R‘’’)$_2$-.

7. Junginys pagal 6 punktą, kur R‘’’ yra H.

8. Junginys pagal 7 punktą, kur l + m + n + p = 3 arba 4.

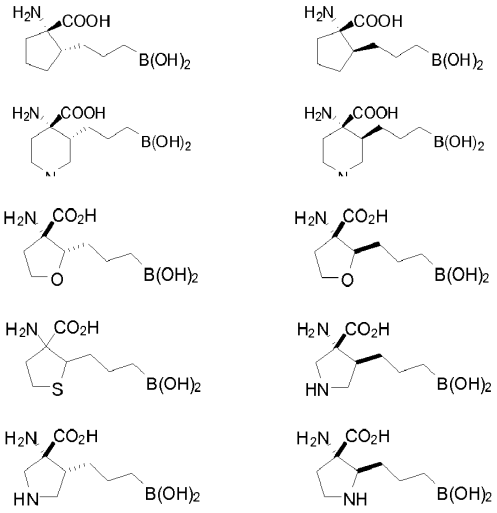
9. Junginys pagal 5 punktą, kur bet kuris vienas iš W, X, Y ir Z yra -NH- ir kiekvienas iš likusių trijų yra -C(R‘’’)$_2$-.

10. Junginys pagal 5 punktą, kur bet kuris vienas iš W, X, Y ir Z yra -N- ir kiekvienas iš likusių trijų yra -CR‘’’-,

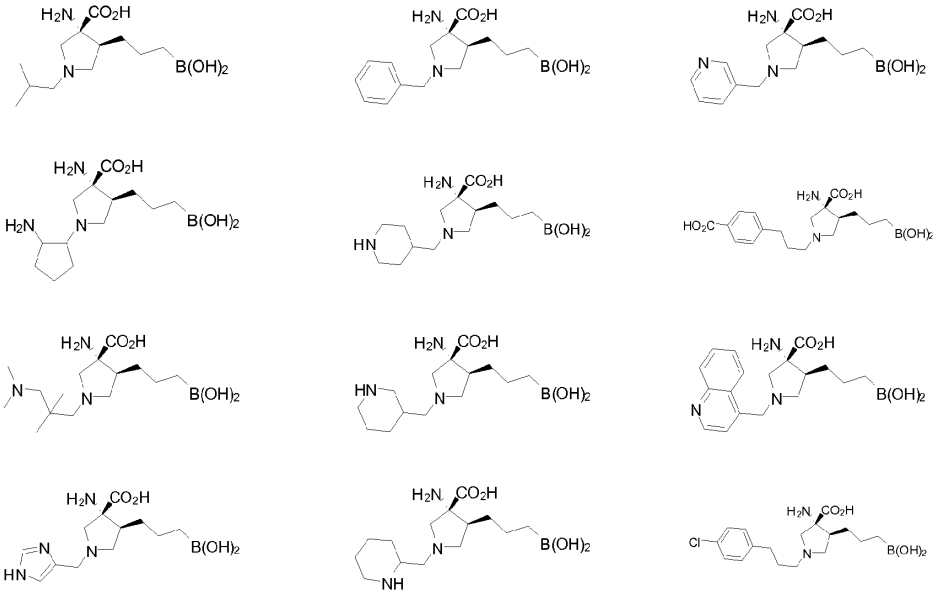


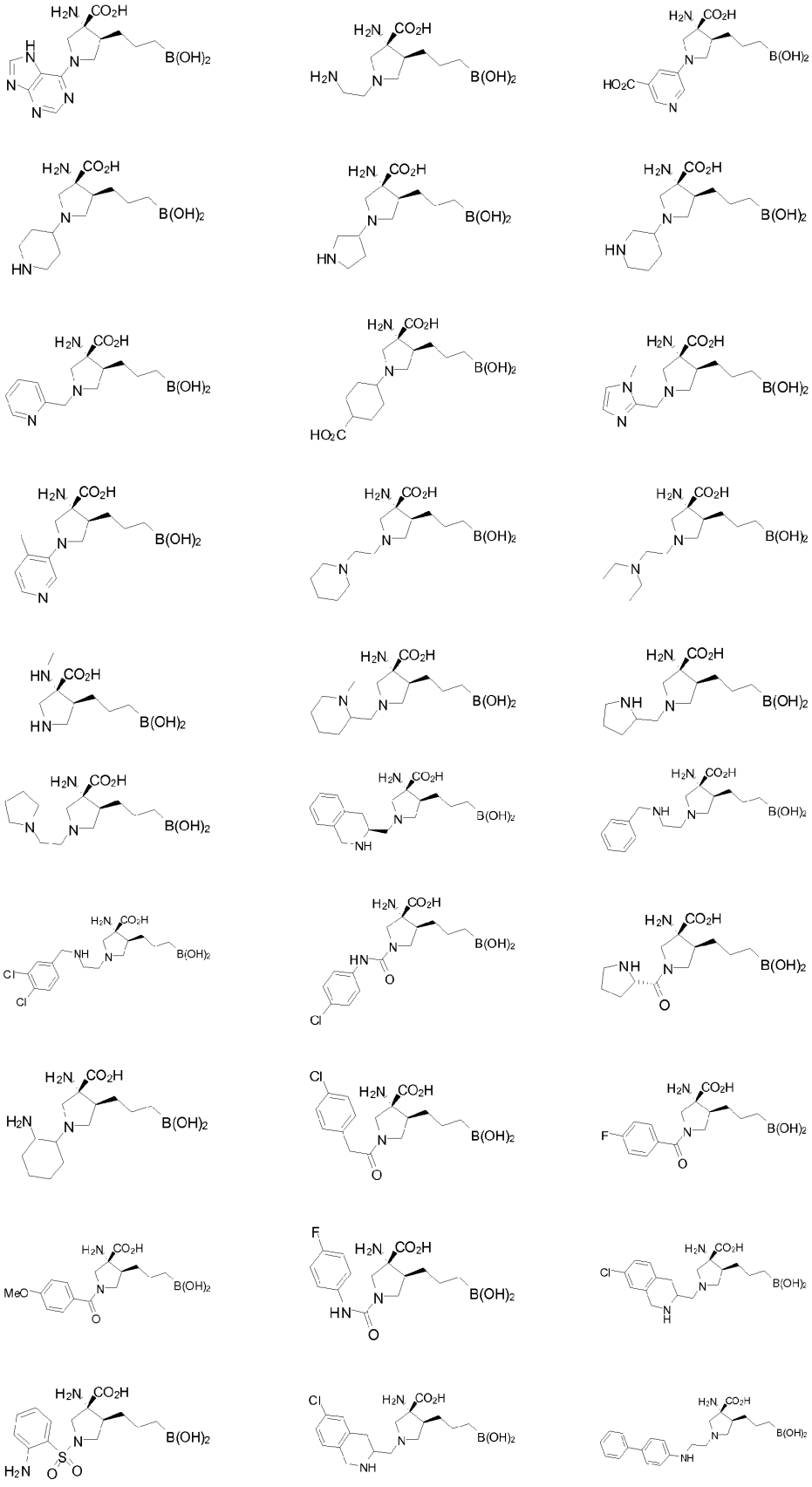
yra ir reiškia vieną arba daugiau dvigubų jungčių.

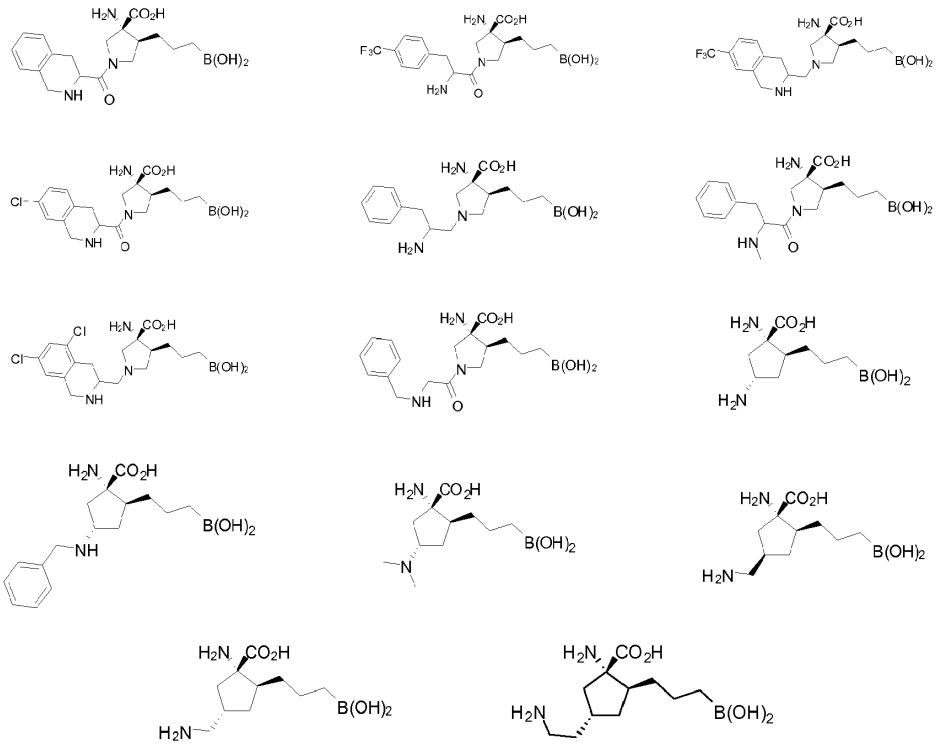
11. Junginys pagal 1 punktą, kuris yra parinktas iš toliau pateiktos lentelės:



12. Junginys pagal 1 punktą, kuris yra parinktas iš toliau pateiktos lentelės:







13. Farmacinė kompozicija, apimanti terapiniu požiūriu efektyvų kiekį bent vieno junginio pagal bet kurį iš 1-12 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtiną druską, stereoizomerą arba tautomerą; ir farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį.

14. Junginys pagal bet kurį vieną iš 1-12 punktų arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska, stereoizomeras arba tautomeras, skirtas panaudoti gydymui arba prevencijai ligos arba būklės, susijusios su ekspresija ar aktyvumu arginase I, arginase II arba jų deriniu subjekte.

15. Junginys, skirtas panaudoti pagal 14 punktą, kur liga arba būklė yra parinkta iš plaučių hipertenzijos, erekcijos disfunkcijos, hipertenzijos, aterosklerozės, inkstų ligų, astmos, T-ląstelių disfunkcijos, išemijos reperfuzijos pažeidimo, neurodegeneracinių ligų, žaizdų gijimo ir fibrozinių ligų.

---

*(51)* Int.Cl. ***C07K 5/06*** (2006.01)
***C07K 5/08*** (2006.01)
***A61K 38/00*** (2006.01)
***A61P 3/04*** (2006.01)
***C07K 5/062*** (2006.01)
***C07K 5/083*** (2006.01)
***C07K 5/087*** (2006.01)
***C07K 5/09*** (2006.01)
***C07K 5/065*** (2006.01)
***C07K 5/072*** (2006.01)
***A61K 38/05*** (2006.01)
***A61K 38/06*** (2006.01)

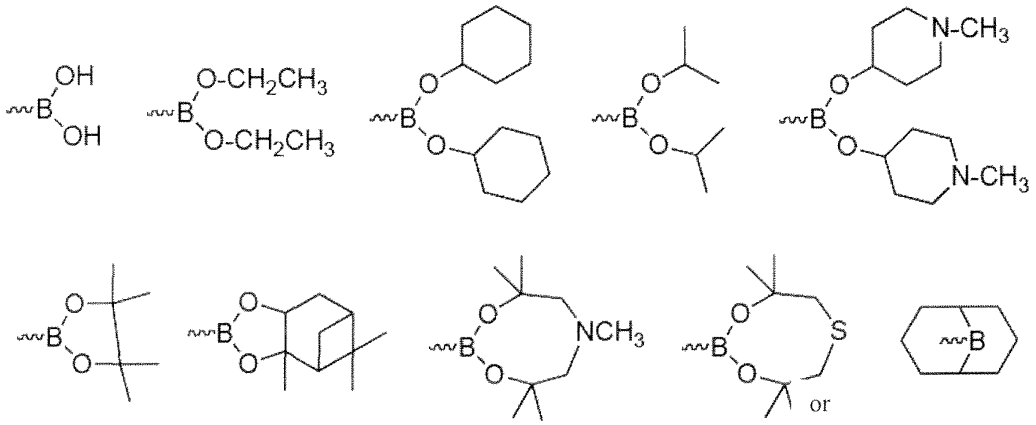
*(11)* **2225261**
*(96)* 08855879.6
*(96)* 2008-12-03
*(97)* 2010-09-08
*(97)* 2016-03-09
*(86)* PCT/EP2008/066740
*(86)* 2008-12-03

*(87)* WO 2009/071601
*(87)* 2009-06-11
*(30)* 996732 P, 2007-12-03, US
*(72)* HAROSH, Itzik, FR
BRAUD, Sandrine, FR
*(73)* OBE THERAPY BIOTECHNOLOGY, 91000 Evry, FR
*(74)* Gražina PEČIULIENĖ, 38, Bajorų kel. 11-18, LT-08466 Vilnius, LT
*(54)* Enteropeptidazės boropeptidiniai inhibitoriai ir jų panaudojimas nutukimo, viršsvorio ir (arba) ligų, susijusių su nenormaliu riebalų metabolizmu, gydymui

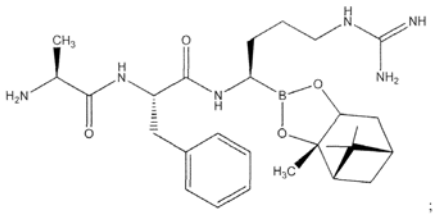
Apibrėžties punktai: 10, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Junginys, parinktas iš grupės, susidedančios iš Glu-Gly-Boro-Arg, Ala-Phe-Boro-Arg, Ac-Glu-Gly-Boro-Arg ir Ac-Ala-Phe-Boro-Arg, kur Ac yra acetilas.

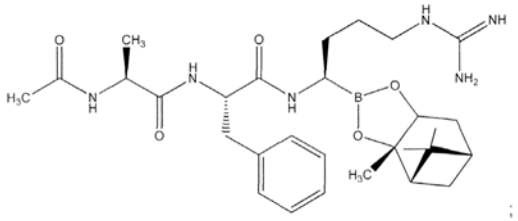
2. Junginys pagal 1 punktą, kur boroarginino fragmentas apima grupę, kurios formulė:



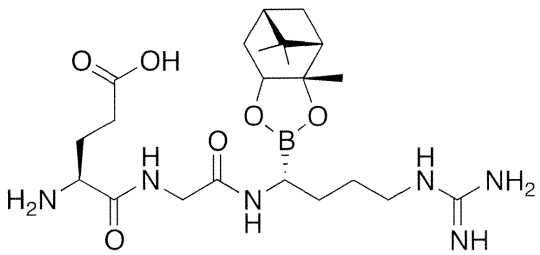

3. Junginys, parinktas iš grupės, susidedančios iš:



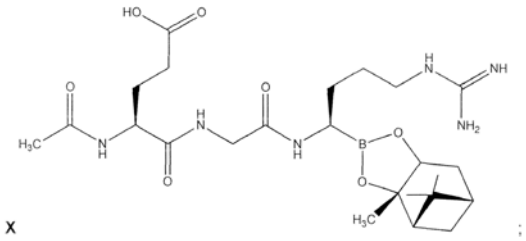

VII ;




VIII ;

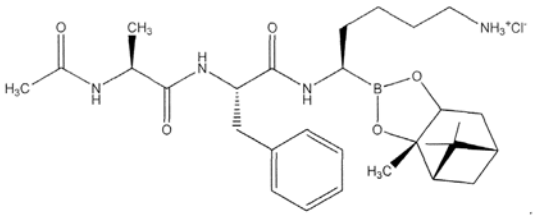



IX ;



X ;

ir



4. Junginys pagal bet kurį iš 1-3 punktą, kuris inhibuoja enteropeptidazės fermentinį aktyvumą, geriau, kuris selektyviai inhibuoja enteropeptidazės fermentinį aktyvumą tarp kitų serino proteazių.

5. Junginys pagal bet kurį iš 1-4 punktą, kuris yra neabsorbuojamas.

6. Junginys pagal bet kurį iš 1-5 punktą, kuris yra laisva bazė arba jo farmaciniu požiūriu priimtina druska.

7. Kompozicija, apimanti bent vieną junginį pagal bet kurį iš 1-6 punktą, pasirinktinai dar apimanti bent vieną farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį.

8. Junginys pagal bet kurį iš 1-6 punktą arba kompozicija pagal 7 punktą, skirti naudoti žinduolio, geriau, žmogaus, nutukimo gydymui.

9. Junginys pagal bet kurį iš 1-6 punktą arba kompozicija pagal 7 punktą, skirti naudoti žinduolio, geriau, žmogaus, viršsvorio gydymui.

10. Junginys pagal bet kurį iš 1-6 punktą arba kompozicija pagal 7 punktą, skirti naudoti žinduolio, geriau, žmogaus, ligų, susijusių su nenormaliu riebalų metabolizmu, gydymui, kur minėta riebalų metabolizmo liga yra parinkta, geriau, iš grupės, susidedančios iš podagros, II tipo diabeto, hiperglikemijos, hiperinsulinemijos, padidinto riebalų rūgščių arba glicerolio kiekio kraujyje, sindromo X, diabetinių komplikacijų, dismetabolinio sindromo ir susijusių ligų, hipercholesterolemijos, aterosklerozės, hipertenzijos, pankreatito, hipertrigliceridemijos, hiperlipidemijos, insulto, koronarinių širdies ligų, periferinių kraujagyslių ligų, periferinių arterijų ligų, vasculiarinių sindromų, su cholesteroliu susijusių sutrikimų ir vaistų indukuotos lipodistrofijos.

---

*(51)* Int.Cl. ***C07K 16/28*** (2006.01)
***A61K 39/395*** (2006.01)
***A61P 5/00*** (2006.01)
*(11)* **2714740**
*(96)* 12729030.2
*(96)* 2012-05-31
*(97)* 2014-04-09
*(97)* 2016-03-30
*(86)* PCT/EP2012/060078
*(86)* 2012-05-31
*(87)* WO 2012/163932
*(87)* 2012-12-06
*(30)* 11168644, 2011-06-03, EP

*(72)* FREIBERG, Christoph, DE
OTTO, Christiane, DE
LINDEN, Lars, DE
HARRENGA, Axel, DE
TRAUTWEIN, Mark, DE
GREVEN, Simone, DE
WILMEN, Andreas, DE
*(73)* Bayer Intellectual Property GmbH, 40789 Monheim, DE
*(74)* Liudmila GERASIMOVIČ, 9, IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius, LT

*(54)* Neutralizuojantis prolaktino receptoriaus antikūnas MAT3 ir jo terapinis panaudojimas
Apibrėžties punktai: 22, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Antikūnas Mat3 arba antigeną surišantis jo fragmentas, kuris priešinasi prolaktino receptoriaus sąlygotam signalo perdavimui, kur antikūnas arba antigeną surišantis jo fragmentas apima:
a) variabilią sunkiąją sritį, kurios aminorūgščių seka atitinka SEQ ID Nr.1, ir
b) variabilią lengvąją sritį, kurios aminorūgščių seka atitinka SEQ ID Nr:2.

2. Antikūnas arba antigeną surišantis jo fragmentas pagal 1 punktą, kur antikūnas arba antigeną surišantis jo fragmentas susideda iš antigeną surišančios srities, kuri specifiškai jungiasi prie žmogaus, beždžionės ir pelės prolaktino receptoriaus (PRLR) ekstraląstelinio domeno vienos ar kelių sričių, ir kur žmogaus PRLR aminorūgščių sekos yra atvaizduotos sekos SEQ ID Nr:12 aminorūgščių sekomis nuo 1 iki 210 pozicijų ir sekos SEQ ID Nr:12 žmogaus polimorfiniais variantais; beždžionės PRLR sekos atvaizduotos SEQ ID NO:11 aminorūgščių sekomis nuo 1 iki 210 pozicijų ir pelės PRLR atitinka seką SEQ ID NO:13.

3. Antikūnas arba antigeną surišantis jo fragmentas pagal 2 punktą, kur afiniškumas žmogaus, beždžionės ir pelės PRLR ekstraląsteliniam domenui sudaro 100 nM, mažiau nei 30 nM, arba yra 10 nM afiniškumas, ir kur afiniškumas buvo matuotas paviršiaus plazmono rezonanso metodu, pavyzdžiui, Biacore.

4. Antikūnas arba antigeną surišantis jo fragmentas pagal 1 punktą, kur antikūnas turi antigeną surišančią sritį, kuri specifiškai jungiasi prie žmogaus PRLR ekstraląstelinio domeno vienos ar kelių sričių, ir kur afiniškumas sudaro 10 nM arba 1 nM, ir kur afiniškumas buvo matuotas paviršiaus plazmono rezonanso metodu, pavyzdžiui, Biacore.

5. Antikūnas arba antigeną surišantis jo fragmentas pagal bet kurį iš 1-4 punktų, kur sunkiosios grandinės pastovūs domenai yra modifikuoti arba nemodifikuoti IgG1, IgG2, IgG3 arba IgG4.

6. Išskirta nukleorūgščių seka, koduojanti antikūną arba antigeną surišantį jo fragmentą pagal bet kurį iš 1-5 punktų.

7. Išskirta nukleorūgščių seka pagal 6 punktą, kur ši išskirta nukleorūgščių seka atitinka SEQ ID Nr.3 ir Nr. 4.

8. Ekspresijos vektorius, apimantis nukleorūgščių seką pagal 6 arba 7 punktą.

9. Šeimininko ląstelė, apimanti vektorių pagal 8 punktą arba nukleorūgšties molekulę pagal 6 arba 7 punktą, kur šeimininko ląstelė yra aukštesnio lygio eukariotinė šeimininko ląstelė, žemesnio lygio eukariotinė šeimininko ląstelė arba prokariotinė ląstelė.

10. Šeimininko ląstelė pagal 9 punktą, kur aukštesnio lygio eukariotinė šeimininko ląstelė yra žinduolio ląstelė.

11. Šeimininko ląstelė pagal 9 punktą, kur žemesnio lygio eukariotinė šeimininko ląstelė yra mielių ląstelė.

12. Šeimininko ląstelė pagal 9 punktą, kur, prokariotinė ląstelė yra bakterinė ląstelė.

13. Šeimininko ląstelės pagal bet kurį iš 9-12 punktų naudojimo būdas, siekiant gaminti antikūną arba antigeną surišantį jo fragmentą, kuriame kultivuoja šeimininko ląstelę pagal 9 punktą tinkamomis sąlygomis ir išskiria minėtą antikūną.

14. Antikūnas arba antigeną surišantis jo fragmentas, gauti būdu pagal 13 punktą.

15. Antikūnas arba antigeną surišantis jo fragmentas pagal bet kurį iš 1-5 punktų, kurie yra išgryninti iki homogeniškumo 95 masės %.

16. Antikūnas arba antigeną surišantis jo fragmentas pagal bet kurį iš 1-5 punktų, skirti naudoti kaip vaistas.

17. Farmacinė kompozicija, apimanti antikūną arba antigeną surišantį jo fragmentą pagal bet kurį iš 1-5 punktų ir farmaciniu požiūriu priimtiną nešklį, įskaitant ekscipientus ir pagalbines medžiagas.

18. Rinkinys, apimantis antikūną pagal bet kurį iš 1-5 punktų, turintis antikūno Mat3 terapeutiškai veiksmingą kiekį, supakuotą konterineryje, kur minėtas rinkinys nebūtinai turi antrą terapinį agentą, ir papildomai apimantis etiketę, pritvirtinta prie konteinerio ar supakuota su konteineriu, kur etiketėje aprašytas konteinerio turinys ir nurodytos indikacijos ir/arba yra instrukcijos kaip naudoti konteinerio turinį, gydant endometriozę, adenomiozę, gerybinę krūties ligą ir mastalgiją, laktacijos slopinimą, hiper- ir normoprolaktineminį plaukų netekimą, gerybinę prostatos hiperplaziją, fibroidus arba naudoti nehormoninei moterų kontracepcijai, arba gydyti moteris kombinuota hormonų terapija, estrogeno plius progestino terapija, slopinti krūtų epitelinių ląstelių proliferaciją arba antiestrogenui atsparaus krūtų vėžio gydymui ir profilaktikai.

19. Antikūnas arba antigeną surišantis jo fragmentas pagal bet kurį iš 1-5 punktų, skirti naudoti kaip vaistas endometriozės ir adenomiozės, endometriosis interna gydymui ir/arba profilaktikai.

20. Antikūnas arba antigeną surišantis jo fragmentas pagal bet kurį iš 1-5 punktų, skirti naudoti kaip vaistas gerybinės krūties ligos ir mastalgijos gydymui.

21. Antikūnas arba antigeną surišantis jo fragmentas pagal bet kurį iš 1-5 punktų, skirti naudoti kaip vaistas antiestrogenui atsparaus krūtų vėžio gydymui arba profilaktikai.

22. Farmacinė kompozicija pagal 17 punktą, apimanti PRLR antikūną arba antigeną surišantį jo fragmentą pagal bet kurį iš 1-5 punktų, derinyje su bent vienu kitu agentu.

---

*(51)* Int.Cl. ***C07K 16/28*** (2006.01)
***C07K 16/32*** (2006.01)
***A61K 39/395*** (2006.01)
***A61P 35/00*** (2006.01)
*(11)* **2516469**
*(96)* 10798541.8
*(96)* 2010-12-17
*(97)* 2012-10-31
*(97)* 2016-03-30
*(86)* PCT/EP2010/070062
*(86)* 2010-12-17
*(87)* WO 2011/076683
*(87)* 2011-06-30
*(30)* 09015831, 2009-12-22, EP
*(72)* BOSSENMAIER, Birgit, DE
DIMOUDIS, Nikolaos, DE
FRIESS, Thomas, DE
GEORGES, Guy, DE
KOLM, Irene, DE
KRELL, Hans-Willi, DE
LIFKE, Valeria, DE
MOESSNER, Ekkehard, CH
*(73)* Roche Glycart AG, 8952 Schlieren-Zuerich, CH
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Anti-HER3 antikūnai ir jų panaudojimas
Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Antikūnas, kuris rišasi prie HER3, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad
sunkiosios grandinės kintamas domenas VH yra SEQ ID Nr. 8 ir lengvosios grandinės kintamas domenas VL yra SEQ ID Nr. 9 arba lengvosios grandinės kintamas domenas VL yra SEQ ID Nr. 10 arba lengvosios grandinės kintamas domenas VL yra SEQ ID Nr. 11.

2. Antikūnas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad
sunkiosios grandinės kintamas domenas VH yra SEQ ID Nr. 8 ir lengvosios grandinės kintamas domenas VL yra SEQ ID Nr. 9 arba lengvosios grandinės kintamas domenas VL yra SEQ ID Nr. 11.

3. Antikūnas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad
sunkiosios grandinės kintamas domenas VH yra SEQ ID Nr. 8 ir lengvosios grandinės kintamas domenas VL yra SEQ ID Nr. 10.

4. Antikūnas pagal bet kurį iš 1-3 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad antikūnas yra monokloninis.

5. Antikūnas pagal bet kurį iš 1-4 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad antikūnas yra IgG1 poklasio.

6. Antikūnas pagal bet kurį iš 1-4 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad antikūnas yra glikozilintas cukraus grandine ties Asn297, kur fukozės kiekis minėtoje cukraus grandinėje yra 65 % arba mažesnis.

7. Antikūnas pagal 6 punktą, kur fukozės kiekis minėtoje cukraus grandinėje yra tarp 5 ir 65 %.

8. Farmacinė kompozicija, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad apima antikūną pagal bet kurį iš 1-7 punktų.

9. Antikūnas pagal bet kurį iš 1-7 punktų, skirtas panaudoti vėžio gydymui.

10. Panaudojimas antikūno pagal bet kurį iš 1-7 punktų gamybai vaisto, skirto vėžio gydymui.

11. Nukleorūgštis, koduojanti antikūno, besirišančio prie žmogaus HER3, sunkiąją ir lengvąją grandines, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad minėtas antikūnas apima VH kintamą domeną SEQ ID Nr. 8; ir lengvosios grandinės VL kintamą domeną SEQ ID Nr. 9, SEQ ID Nr. 10 arba SEQ ID Nr. 11.

12. Raiškos vektorius, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad apima nukleorūgštį pagal 11 punktą, skirtas antikūno pagal bet kurį iš 1-7 punktų raiškai prokariotinėje arba eukariotinėje šeimininko ląstelėje.

13. Prokariotinė arba eukariotinė šeimininko ląstelė, apimanti vektorių pagal 12 punktą.

14. Rekombinantinio antikūno pagal bet kurį iš 1-7 punktų gamybos būdas, b e s i s k i r i a n t i s nukleorūgšties pagal 11 punktą raiška prokariotinėje arba eukariotinėje ląstelėje šeimininkėje ir minėto antikūno išgavimu iš minėtos ląstelės arba ląstelių kultūros supernatanto.

---

*(51)* Int.Cl. ***C07K 16/40*** (2006.01)
***A61P 3/06*** (2006.01)
***A61K 39/395*** (2006.01)
***A61K 45/06*** (2006.01)
***A61K 31/22*** (2006.01)
***A61K 31/366*** (2006.01)
***A61K 31/40*** (2006.01)
***A61K 31/405*** (2006.01)
***A61K 31/44*** (2006.01)
***A61K 31/47*** (2006.01)
***A61K 31/505*** (2006.01)
***A61K 31/66*** (2006.01)
***A61K 39/00*** (2006.01)
***C12N 15/113*** (2006.01)
*(11)* **2215124**
*(96)* 08798550.3
*(96)* 2008-08-22
*(97)* 2010-08-11

*(97)* 2016-02-24
*(86)* PCT/US2008/074097
*(86)* 2008-08-22
*(87)* WO 2009/026558
*(87)* 2009-02-26
*(30)* 10630 P, 2008-01-09, US
86133 P, 2008-08-04, US
957668 P, 2007-08-23, US
8965 P, 2007-12-21, US
*(72)* JACKSON, Simon, Mark, US
WALKER, Nigel Pelham, Clinton, US
PIPER, Derek, Evan, US
SHAN, Bei, US
SHEN, Wenyan, US
CHAN, Joyce Chi, Yee, US
KING, Chadwick, Terence, CA
KETCHEM, Randal, Robert, US
MEHLIN, Christopher, US
CARABEO, Teresa, Arazas, US
CAO, Qiong, US
*(73)* Amgen Inc., Thousand Oaks, CA 91320-1799, US
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Antigeną surišantys baltymai prieš subtilizino/keksino tipo 9 proproteino konvertazę (pcsk9)
Apibrėžties punktai: 23, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Monokloninis antikūnas arba jo fragmentas, kuris suriša žmogaus PCSK9 ir neutralizuoja tokiu būdu, kad minėto antikūno arba jo fragmento perteklius geba sumažinti PCSK9, surišto su LDLR, kiekį konkurenciniame surišimo tyrime *in vitro*, kur minėtas monokloninis antikūnas arba jo fragmentas dėl rišimosi prie PCSK9 konkuruoja su

(a) antikūnu, apimančiu sunkiosios grandinės kintamosios srities aminorūgščių seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 49; ir lengvosios grandinės kintamosios srities aminorūgščių seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 23; arba

(b) antikūnu, apimančiu sunkiosios grandinės kintamosios srities aminorūgščių seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 67; ir lengvosios grandinės kintamosios srities aminorūgščių seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 12.

2. Antigeną surišantis baltymas, kur

(A) minėtas antigeną surišantis baltymas specifiškai rišasi su žmogaus PCSK9 ir neutralizuoja tokiu būdu, kad minėto antigeną surišančio baltymo perteklius geba sumažinti PCSK9, surišto su LDLR, kiekį konkurenciniame surišimo tyrime *in vitro*, kur minėtas antigeną surišantis baltymas apima bet kurį iš

(i)

(a) lengvosios grandinės kintamosios srities ir sunkiosios grandinės kintamosios srities derinį, parinktą iš derinių grupės, susidedančios iš:

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 9 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 71;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 10 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 72;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 12 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 67;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 16 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 52;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 17 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 51;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 20 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 54;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 21 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEO ID Nr. 55;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 22 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 56;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 23, ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 49;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 24 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 57;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 26 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 50;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 30 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 64;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 31 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 62;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 33 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 65;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 35 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 79;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 36 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 80;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 37 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 76;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 38 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 77;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 39 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 78;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 40 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 83;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 461 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 459;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 465, ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 463;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 473 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr.471;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 477 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr.475;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 485 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr.483;

(ii)

(a) CDRH1, apimančios SEQ ID Nr. 308, CDRH2, apimančios SEQ ID Nr. 175, ir CDRH3, apimančios SEQ ID Nr. 180; arba

(b) CDRH1, apimančios SEQ ID Nr. 368, CDRH2, apimančios SEQ ID Nr. 175, ir CDRH3, apimančios SEQ ID Nr. 180; ir CDRL1, apimančios SEQ ID Nr. 158, CDRL2, apimančios SEQ ID Nr. 162, ir CDRL3, apimančios SEQ ID Nr. 395;

(iii) a CDRH1 apimančios SEQ ID Nr. 368, CDRH2 apimančios SEQ ID Nr. 174, ir CDRH3 apimančios SEQ ID Nr. 180, ir CDRL1 apimančios SEQ ID Nr. 158, CDRL2 apimančios SEQ ID Nr. 162, ir CDRL3 apimančios SEQ ID Nr. 164; arba

(iv) CDRH1, apimančios GFTFSSYWMS, CDRH2, apimančios, SIKQDGSEKYYVDSVKG, ir CDRH3, apimančios DLVLMVYDIDYYYYGMDV, ir CDRL1, apimančios RSSQSLLHSNGYNYLD, CDRL2, apimančios LGSNRAS, ir CDRL3 apimančios MOALOTPLT;

arba

(B) minėtas antigeną surišantis baltymas apima

(a) lengvosios grandinės kintamąją sritį, apimančią aminorūgščių seką SEQ ID Nr. 23, ir sunkiosios grandinės kintamąją sritį, apimančią aminorūgščių seką SEQ ID Nr. 49; arba

(b) lengvosios grandinės kintamąją sritį, apimančią aminorūgščių seką SEQ ID Nr. 23, kurioje pirmoji liekana yra glutamo rūgštis vietoj glutamino, ir sunkiosios grandinės kintamąją sritį, apimančią aminorūgščių seką SEQ ID Nr.

49, kurioje pirmoji liekana yra glutamo rūgštis vietoj glutamino.

3. Antigeną surišantis baltymas pagal 2(A)(i) punktą, apimantis lengvosios grandinės kintamosios srities ir sunkiosios grandinės kintamosios srities derinį, kur lengvosios grandinės kintamoji sritis ir sunkiosios grandinės kintamoji sritis yra parinktos iš derinių grupės, susidedančios iš:

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 10 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 72;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 12 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 67;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 17 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 51;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 23, ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 49;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 35 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 79;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 461 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 459;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 465, ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 463; ir

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr. 485 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pasižyminčią bent 90% identiškumu sekai SEQ ID Nr.483,

kur antigeną surišantis baltymas specifiškai rišasi su PCSK9.

4. Antigeną surišantis baltymas pagal 3 punktą, kur lengvosios grandinės kintamoji sritis ir sunkiosios grandinės kintamoji sritis yra parinktos iš derinių grupės, susidedančios iš:

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 10 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 72;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 12 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 67;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 17 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 51;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 23 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 49;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 35 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 79;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 461 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 459;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 465, ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 463; ir

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 485 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr.483,

kur antigeną surišantis baltymas specifiškai rišasi su PCSK9.

5. Antigeną surišantis baltymas pagal 2(A)(ii) punktą, apimantis:

(a) lengvosios grandinės kintamąją sritį, apimančią aminorūgščių seką SEQ ID Nr. 23, ir sumkiosios grandinės kintamąją sritį, apimančią aminorūgščių seką SEQ ID Nr. 49; arba

(b) lengvosios grandinės kintamąją sritį, apimančią aminorūgščių seką SEQ ID Nr. 23, kurioje pirmoji liekana yra glutamo rūgštis vietoj glutamino, ir sunkiosios grandinės kintamąją sritį, apimančią aminorūgščių seką SEQ ID Nr. 49, kurioje pirmoji liekana yra glutamo rūgštis vietoj glutamino.

6. Antigeną surišantis baltymas pagal 2(B)(b) arba 5(b) punktus, papildomai apimantis glicino liekaną minėtos lengvosios grandinės kintamosios srities C-gale.

7. Antigeną surišantis baltymas pagal 2(A)(iii) punktą, apimantis lengvosios grandinės kintamąją sritį, apimančią aminorūgščių seką SEQ ID Nr. 17, ir sunkiosios grandinės kintamąją sritį, apimančią aminorūgščių seką SEQ ID Nr. 51.

8. Antigeną surišantis baltymas pagal 2(A)(iv) punktą, apimantis lengvosios grandinės kintamąją sritį, apimančią aminorūgščių seką SEQ ID Nr. 461, ir sunkiosios grandinės kintamąją sritį, apimančią aminorūgščių seką SEQ ID Nr. 459.

9. Antigeną surišantis baltymas pagal bet kurį iš 2-8 punktą, papildomai apimantis:

(a) lengvosios grandinės pastoviąją seką SEQ ID Nr. 156;

(b) lengvosios grandinės pastoviąją seką SEQ ID Nr. 157;

(c) sunkiosios grandinės pastoviąją seką SEQ ID Nr. 154;

(d) sunkiosios grandinės pastoviąją seką SEQ ID Nr. 155;

(e) lengvosios grandinės pastoviąją seką SEQ ID Nr. 156 ir sunkiosios grandinės pastoviąją seką SEQ ID Nr. 154,

(f) lengvosios grandinės pastoviąją seką SEPA ID Nr. 157 ir sunkiosios grandinės pastoviąją seką SEQ ID Nr. 154;

(g) lengvosios grandinės pastoviąją seką SEQ ID Nr. 156 ir sunkiosios grandinės pastoviąją seką SEQ ID Nr. 155; arba

(h) lengvosios grandinės pastoviąją seką SEQ ID Nr. 157 ir sunkiosios grandinės pastoviąją seką SEQ ID Nr. 155.

10. Antikūnas arba jo fragmentas, arba antigeną surišantis baltymas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kur antikūnas arba jo fragmentas, arba antigeną surišantis baltymas pasižymi bent viena iš šių charakteristikų:

(a) rišasi su PCSK9 variantu, kuris turi D374Y taškinę mutaciją;

(b) yra parinktas iš grupės, susidedančios iš žmogaus antikūno, humanizuoto antikūno, chimerinio antikūno, monokloninio antikūno, multispecifinio antikūno, rekombinantinio antikūno, antigeną surišančio antikūno fragmento, vienos grandinės antikūno, diakūno, Fab fragmento, F(ab)2 fragmento, IgG1 antikūno, IgG2 antikūno, IgG3 antikūno ir IgG4 antikūno;

(c) rišasi su PCSK9 su $K_d$ kuri yra mažesnė nei 1 nM, yra mažesnė nei 100 pM, yra mažesnė nei 10 pM, arba yra mažesnė nei 5 pM; arba

(d) gali blokuoti PCSK9 D374Y rišimąsi su LDLR, esant $IC_{50}$ mažesnei nei 200 pM.

11. Antikūnas arba jo fragmentas, arba antigeną surišantis baltymas pagal bet kurį ankstesnį punktą, kuris, kai rišasi su PCSK9:

(a) rišasi su PCSK9 su tokia pačia $K_d$ kaip ir palyginamasis antikūnas;

(b) inhibuoja PCSK9 rišimąsi su LDLR, esant tokiai pat $IC_{50}$ , kaip ir minėto palyginamojo antikūno atveju; arba

(c) konkuruoja su minėtu palyginamuoju antikūnu dėl rišimosi su PCSK9,

kur minėtas palyginamasis antikūnas apima derinį iš lengvosios grandinės ir sunkiosios grandinės kintamųjų sričių sekų, parinktų iš grupės, susidedančios iš

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 10 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 72;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 12 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 67;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 17 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 51;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 23, ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 49;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 35 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 79;

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 461 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 459; ir

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą ID Nr. 465, ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 463; ir

lengvosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 485 ir sunkiosios grandinės kintamosios srities, turinčios seką, pavaizduotą SEQ ID Nr.483.

12. Nukleorūgštis, koduojanti antikūną arba jo fragmentą arba antigeną surišantį baltymą pagal bet kurį ankstesnį punktą.

13. Rekombinantinis raiškos vektorius, apimantis nukleorūgšties molekulę pagal 12 punktą.

14. Ląstelė šeimininkė, apimanti vektorių pagal 13 punktą.

15. Hibridoma, gebanti produkuoti antikūną pagal 10 arba 11 punktą.

16. Antikūno arba jo fragmento, arba antigeną surišančio baltymo pagal bet kurį iš 1-11 punktą gamybos būdas, apimantis minėto antikūno arba jo fragmento, arba antigeną surišančio baltymo gavimo iš ląstelės šeimininkės, kuri sekretuoja minėtą antikūną arba jo fragmentą arba antigeną surišantį baltymą, pakopą.

17. Antikūnas arba jo fragmentas, arba antigeną surišantis baltymas, gautas vykdant rekombinantinės DNR raišką ląstelėje šeimininkėje pagal 14 punktą arba hibridomoje pagal 15 punktą.

18. Būdas pagal 16 punktą arba antikūnas arba jo fragmentas, arba antigeną surišantis baltymas pagal 17 punktą, kur ląstelė šeimininkė yra parinkta iš grupės, susidedančios iš kininio žiurkėno kiaušidžių (CHO) ląstelių, HeLa ląstelių, naujagimio žiurkėno inkstų (BHK) ląstelių, bezdžionės inkstų ląstelių (COS), žmogaus kepenų ląstelių karcinomos ląstelių ir žmogaus inkstų epitelio 293 ląstelių.

19. Farmacinė kompozicija, apimanti bent vieną antikūną arba jo fragmentą arba bent vieną antigeną surišantį baltymą pagal bet kurį iš 1-11, 17 arba 18 punktą, ir farmaciniu požiūriu priimtiną užpildą.

20. Farmacinė kompozicija pagal 19 punktą, kur farmacinė kompozicija yra įvedama prieš, vienu metu su, arba nuosekliai po įvedimo bent vieno kito terapinio agento, kur, pasirinktinai, kitas terapinis agentas yra statinas.

21. Rinkinys, skirtas su cholesteroliu susijusių sutrikimų gydymui, apimantis kompoziciją pagal 19 arba 20 punktą.

22. Antikūnas arba jo fragmentas, arba antigeną surišantis baltymas pagal bet kurį iš 1-11, 17 arba 18 punktą, skirtas naudoti būklės, susijusios padidintu cholesterolio kiekiu subjekto serume, gydymui arba prevencijai.

23. Antikūnas arba jo fragmentas, arba antigeną surišantis baltymas, skirtas naudoti pagal 22 punktą, kur būklė yra parinkta iš hipercholesterolemijos, širdies ir kraujagyslių ligos, metabolinio sindromo, diabeto, insulto ir dislipidemijos.

---

*(51)* Int.Cl. ***C08B 37/00*** (2006.01)
***A61K 31/737*** (2006.01)
***A61P 19/02*** (2006.01)
***A61P 39/06*** (2006.01)
***A61P 13/10*** (2006.01)
***C07H 11/00*** (2006.01)
***C07H 13/02*** (2006.01)

*(11)* **2303930**

*(96)* 08800116.9

*(96)* 2008-10-08

*(97)* 2011-04-06

*(97)* 2016-02-17

*(86)* PCT/AU2008/001481

*(86)* 2008-10-08

*(87)* WO 2010/000013

*(87)* 2010-01-07

*(30)* 2008903436, 2008-07-04, AU

*(72)* STAJIC, Vladimir, AU
CHEETHAM, Norman, AU
BELL, Alan, AU

*(73)* Parnell Technologies Pty Ltd, Alexandria, NSW 2015, AU

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

*(54)* Sulfatinio polisacharido junginys, jo gavimo būdas ir panaudojimas

Apibrėžties punktai: 8, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Mišinio, apimančio sulfatinio glikano molekules, gavimo būdas, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtos molekulės apima:

(A) vieną ar daugiau linijinių 1-4 konjuguotų beta-D-ksilozės vienetų; ir

(B) bent vieną 4-O-metil-β-D-gliukuroninės rūgšties vienetą, prijungtą prie kiekvieno 8-10 (vidutiniškai) ksilozės vieneto 2-C atomo,

kur būdas apima:

a) ksilano sulfatinimą atliekant reakciją su:

(i) piridino chlorsulfoninės rūgšties kompleksu dimetilformamide (DMF);

(ii)piridino SO3 kompleksu dimetilformamide; arba

(iii) aukščiau minėtų (i) ir (ii) mišiniu, siekiant gauti piridinio ksilansulfatą;

b) pakeičiant piridiniumo joną priešingu jonu, kad susidarytų ne piridinio ksilansulfato druska, po to pašalinimą piridino ir DMF :

c) atliekant ne piridininio ksilansulfato druskos rūgštinę hidrolizę, norint pakoreguoti jos galutinę santykinę molekulinę masę;

d) atliekant ne piridinio ksilansulfato druskos ultrafiltraciją, siekiant pašalinti neorganines priemaišas ir skilimo produktus; ir

e) atliekant bent vieną ne piridinio ksilansulfato druskos resulfatinimo/hidrolizės ciklą, po kurio ji virsta natrio druska ir pašalininimą piridino bei DMF, kad susidarytų nefrakcionuotos nuosėdos.

2. Būdas pagal 1 punktą, kur priešingas jonas yra neorganinis metalas arba organinis šarmas.

3. Mišinio, apimančio sulfatinio glikano molekules, gavimo būdas, kur minėtos molekulės apima:

(A) vieną ar daugiau linijinių 1-4 konjuguotų beta-D-ksilozės vienetų; ir

(B) bent vieną 4-O-metil-β-D-gliukuroninės rūgšties vienetą prijungtą prie kiekvieno 8-10 (vidutiniškai) ksilozės vieneto 2-C atomo,

būdas, apimantis:

(a) hidrolizę, kur hidrolizė atliekama bent vieną kartą būdo metu ir kur hidrolizė atliekama su:

(i) ksilanu;

(ii) ksilano sulfatu; arba

(iii) bet kuriuo iš aukščiau paminėtų junginių atskirame hidrolizės žingsnyje; ir

(b) sulfatinimą, kur sulfatinimas atliekamas bent du kartus būdo metu, kur sulfatinimas atliekamas su:

(i) ksilanu;

(ii) ksilano sulfatu; arba

(iii) bet kuriuo iš aukščiau paminėtų junginių viename ar daugiau atskiruose sulfatinimo žingsniuose.

4. Mišinys, gaunamas būdu pagal bet kurį iš 1 - 3 punktų, kur sulfatinio glikano molekulių molekulinis svoris yra nuo 1000 iki 6000.

5. Mišinys pagal 4 punktą, kur sulfatinio glikano molekulių molekulinis svoris yra nuo 1000 iki 4000.

6. Terapinė kompozicija skirta parenteriniam vartojimui, apimanti sulfatinio glikano molekules vandeniniame tirpale, kai sulfatinės glikano molekulės paruoštos būdu pagal bet kurį iš 1-3 punktų.

7. Terapinė kompozicija pagal 6 punktą, kuri yra kontroliuojamo atpalaidavimo kompozicija.

8. Terapinė kompozicija pagal 6 arba 7 punktą skirta naudoti osteoartrito gydymui.

*(51)* Int.Cl. ***C12H 1/04*** (2006.01)
***B01J 20/10*** (2006.01)
*(11)* **2049645**
*(96)* 07786398.3
*(96)* 2007-07-27
*(97)* 2009-04-22
*(97)* 2016-04-06
*(86)* PCT/EP2007/006687
*(86)* 2007-07-27
*(87)* WO 2008/017393
*(87)* 2008-02-14
*(30)* 836091 P, 2006-08-07, US
*(72)* LÜERS, Georg, DE
JALALPOOR, Massoud, DE
SEDLMAYER, Dominik, DE
SEEWALD, Andreas, DE
*(73)* Grace GmbH & Co. KG, 67545 Worms, DE
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Alaus skaidrinimo priemonė silicio dioksido kserogelio, pasižyminčio didele filtravimo geba, pagrindu
Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 0.

*(57)* 1. Kompozicija, tinkama gėrimų apdorojimui, apimanti kserogelio daleles, turinčias porų tūrį nuo 0,2 iki 2,0 ml/g, ir vidutinį dalelės dydį nuo 5 iki 40 mikronų, kur kompozicija apima 20 masės % arba mažiau labai smulkių dalelių.

2. Kompozicija pagal 1 punktą, kur minėtas kserogelis apima drėgmę kiekiu 20 masės % arba mažiau.

3. Kompozicija pagal 1 punktą, kur minėtas kserogelis apima silicio dioksidą.

4. Kompozicija pagal 1 punktą, kur minėtas vidutinis dalelių dydis svyruoja nuo 10 iki 25 mikronų.

5. Kompozicija pagal 1 punktą, kur kompozicija apima 18 masės % arba mažiau labai smulkių dalelių.

6. Kompozicija pagal 1 punktą, kur kompozicija apima 15 masės % arba mažiau labai smulkių dalelių.

7. Kompozicija pagal 1 punktą, kur minėtas ir paviršiaus plotas nuo 400 iki 800 $m^2/g$.

8. Kompozicija pagal 1 punktą, kur minėta kompozicija apima filtravimo gebą bent 40 mDarcy.

9. Kompozicijos, tinkamos gėrimų apdorojimui, gavimo būdas, apimantis:
hidrogelio paruošimą;
hidrogelio kaitinimą, kad susidarytų kserogelis;
kserogelio malimą, susidarant dalelėms; ir
labai smulkių dalelių pašalinimą iš kompozicijos taip, kad kompozicija apima kserogelio daleles su porų tūriu nuo 0,2 iki 2,0 ml/g, ir vidutiniu dalelių dydžiu nuo 5 iki 40 mikronų, ir kompozicija apima 20 masės % arba mažiau labai smulkių dalelių.

10. Būdas pagal 9 punktą, kur minėtas kserogelis apima drėgmę kiekiu 20 masės % arba mažiau.

11. Būdas pagal 9 punktą, kur minėtas vidutinis dalelių dydis svyruoja nuo 10 iki 25 mikronų.

12. Gėrimo apdorojimo būdas, apimantis:
kserogelio kompozicijos pateikimą;
gėrimo pateikimą; ir
minėto gėrimo filtravimą per minėtą kserogelio kompoziciją,

kur minėta kompozicija apima kserogelio daleles su porų tūriu nuo 0,2 iki 2,0 ml/g, vidutiniu dalelių dydžiu nuo 5 iki 40 mikronų, kur kompozicija apima 20 masės % arba mažiau labai smulkių dalelių.

13. Būdas pagal 12 punktą, kur minėtas gėrimas apima alų, vyną arba vaisių sultis.

14. Būdas pagal 12 punktą, kur kompozicija apima 18 masės % arba mažiau labai smulkių dalelių.

15. Būdas pagal 12 punktą, kur kompozicija apima 15 masės % arba mažiau labai smulkių dalelių.

---

*(51)* Int.Cl. ***C12N 9/78*** (2006.01)
***A61K 47/48*** (2006.01)
***A61K 38/00*** (2006.01)
*(11)* **2147116**
*(96)* 08746255.2
*(96)* 2008-04-18
*(97)* 2010-01-27
*(97)* 2016-03-02
*(86)* PCT/US2008/060805
*(86)* 2008-04-18
*(87)* WO 2008/131208
*(87)* 2008-10-30
*(30)* 913009 P, 2007-04-20, US
*(72)* FILPULA, David R., US
YOUNGSTER, Stephen K., US
*(73)* Sigma-Tau Rare Disease Ltd, London EC1A 2DY, GB
*(74)* Marija LENKUTIENĖ, 6, Patentinių paslaugų centras, UAB, J. Basanavičiaus g. 11/1, LT-03108 Vilnius, LT
*(54)* Stabili rekombinantinė adenozino deaminazė
Apibrėžties punktai: 22, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Rekombinantinė adenozino deaminazė, kur oksiduojama aminorūgšties liekana, ekspresuojama laukinio tipo adenozino deaminazėje yra pakeista neoksiduojama aminorūgšties liekana; kur neoksiduojama aminorūgšties liekana yra serinas, o oksiduojama aminorūgšties liekana yra cisteinas, kur minėtas cisteinas yra išsidėstęs subrendusio adenozino deaminazės baltymo 74 aminorūgšties padėtyje.

2. Rekombinantinė adenozino deaminazė pagal apibrėžties 1 punktą, kuri yra rekombinantinė žmogaus adenozino deaminazė arba rekombinantinė jaučio adenozino deaminazė.

3. Rekombinantinė adenozino deaminazė pagal apibrėžties 2 punktą, kuri yra transliuojama nuo DNR molekulės pagal SEQ ID NO: 2 arba SEQ ID NO: 4.

4. Rekombinantinė adenozino deaminazė pagal apibrėžties 2 punktą, kuri apima SEQ ID NO: 1 arba SEQ ID NO: 3.

5. Rekombinantinė adenozino deaminazė pagal apibrėžties 4 punktą, kuri apima SEQ ID NO: 1 su aminorūgšties pakaita, parinkta iš grupės, susidedančios iš Gln vietoje $Lys_{198}$; Ala vietoje $Thr_{245}$; Arg vietoje $Gly_{351}$, ir jų deriniais.

6. Polialkilenoksido - adenozino deaminazės konjugatas, kur adenozino deaminazė yra rekombinantinė adenozino deaminazė pagal apibrėžties 1 punktą.

7. Polialkilenoksido - adenozino deaminazės konjugatas pagal apibrėžties 6 punktą, kur polialkilenoksidas yra polietilenglikolis.

8. Polialkilenoksido - adenozino deaminazės konjugatas pagal apibrėžties 7 punktą, kur polietilenglikolis yra konjuguotas prie rekombinantinės adenozino deaminazės per linkerį, parinktą iš grupės, susidedančios iš sukcinimidilkarbonato, tiazolidintiono, uretano ir amidinių linkerių.

9. Polialkilenoksido - adenozino deaminazės konjugatas pagal apibrėžties 7 punktą, kur polietilenglikolis yra kovalentiškai prijungtas prie rekombinantinės adenozino deaminazės Lys epsilon amino grupės.

10. Polialkilenoksido - adenozino deaminazės konjugatas pagal apibrėžties 7 punktą, kur rekombinantinė adenozino deaminazė apima vieną arba daugiau polietilenglikolio grandinių, prijungtų prie rekombinantinės adenozino deaminazės vienos arba daugiau Lys liekanų epsilon amino grupių.

11. Polialkilenoksido - adenozino deaminazės konjugatas pagal apibrėžties 7 punktą, kur rekombinantinė adenozino deaminazė apima maždaug nuo 11 iki maždaug 18 polietilenglikolio grandinių, prijungtų prie rekombinantinės adenozino deaminazės vienos arba daugiau Lys liekanų epsilon amino grupių.

12. Polialkilenoksido - adenozino deaminazės konjugatas pagal apibrėžties 7 punktą, kur polietilenglikolis yra konjuguotas prie rekombinantinės adenozino deaminazės per sukcinimidilkarbonato linkerį.

13. Polialkilenoksido - adenozino deaminazės konjugatas pagal apibrėžties 7 punktą, kur polietilenglikolio molekulinė masė yra nuo 2 000 iki 100 000.

14. Polialkilenoksido - adenozino deaminazės konjugatas pagal apibrėžties 7 punktą, kur polietilenglikolio molekulinė masė yra nuo 4 000 iki 45 000.

15. Rekombinantinė adenozino deaminazė pagal apibrėžties 1 punktą, skirta naudoti adenozino deaminazės sąlygotos žinduolių būklės gydymui.

16. Rekombinantinė adenozino deaminazė pagal apibrėžties 15 punktą, kur adenozino deaminazės sąlygota būklė yra sunkus kompleksinis imuniteto sutrikimas.

17. Rekombinantinės adenozino deaminazės išgryninimo būdas pagal apibrėžties 6 punktą, apimantis baltymo išgryninimą jonų mainų chromatografijos būdu.

18. Rekombinantinės adenozino deaminazės pagal apibrėžties 6 punktą, apimančios SEQ ID NO: 1 seką, išgryninimo būdas, apimantis baltymo išgryninimą hidrofobinių sąveikų chromatografijos būdu.

19. Rekombinantinė adenozino deaminazė pagaminta pagal apibrėžties 17 punkto būdą.

20. Rekombinantinė adenozino deaminazė pagaminta pagal apibrėžties 18 punkto būdą.

21. Išskirta DNR, kuri koduoja rekombinantinę adenozino deaminazę, turinčią aminorūgščių seką SEQ ID NO: 1 arba SEQ ID NO: 3.

22. Išskirta DNR pagal apibrėžties 21 punktą, kur rekombinantinė adenozino deaminazė turi aminorūgšties pakaitą, parinktą iš grupės, susidedančios iš Gln vietoje $Lys_{198}$; Ala vietoje $Thr_{245}$; Arg vietoje $Gly_{351}$, ir jų derinius.

---

*(51)* Int.Cl. ***C12N 15/09*** (2006.01)
***A61K 31/337*** (2006.01)
***A61K 31/475*** (2006.01)
***A61K 39/395*** (2006.01)
***A61P 35/00*** (2006.01)
***A61P 43/00*** (2006.01)
***C07K 16/28*** (2006.01)
***C12N 1/15*** (2006.01)
***C12N 1/19*** (2006.01)
***C12N 1/21*** (2006.01)
***C12N 5/10*** (2006.01)
***C12P 21/08*** (2006.01)

***A61K 31/439*** (2006.01)
***A61K 31/4545*** (2006.01)
***A61K 31/4745*** (2006.01)
***A61K 31/513*** (2006.01)
***A61K 31/555*** (2006.01)
***C07K 14/705*** (2006.01)
***C07K 16/30*** (2006.01)
***A61K 39/00*** (2006.01)

*(11)* **2636736**
*(96)* 11836421.5
*(96)* 2011-10-27
*(97)* 2013-09-11
*(97)* 2016-03-23
*(86)* PCT/JP2011/074866
*(86)* 2011-10-27
*(87)* WO 2012/057288
*(87)* 2012-05-03
*(30)* 2010243549, 2010-10-29, JP
*(72)* OHTSUKA, Toshiaki, JP
TAKIZAWA, Takeshi, JP
OGUNI, Akiko, JP
MATSUOKA, Tatsuji, JP
YOSHIDA, Hiroko, JP
MATSUI, Yumi, JP
*(73)* Daiichi Sankyo Company, Limited, Tokyo 103-8426, JP
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Naujas anti-DR5 antikūnas
Apibrėžties punktai: 23, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Antikūnas, gebantis prisirišti prie DR5, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad:
sunkiosios grandinės seka turi kintamą sritį, turinčią CDRH1, CDRH2 ir CDRH3 ir CDRH1 apima aminorūgščių seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 82, CDRH2 apima vieną iš aminorūgščių sekų, pavaizduotą SEQ ID Nr. 89 ir 83 ir CDRH3 apima aminorūgščių seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 84 ir
lengvosios grandinės seka turi kintamą sritį, turinčią CDRL1, CDRL2 ir CDRL3 ir CDRL1 apima bet kokią aminorūgščių seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 87, 85, 86, 88 ir 79, CDRL2 apima aminorūgščių seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 80 ir CDRL3 apima aminorūgščių seką, pavaizduotą SEQ ID Nr. 81 arba antikūno funkcinis fragmentas, turintis antigeną surišantį aktyvumą.

2. Antikūnas arba antikūno funkcinis fragmentas, turintis antigeną surišantį aktyvumą, pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad turi sunkiosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 20 aminorūgščių 20-141 liekanas ir lengvosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 16 aminorūgščių 21-134 liekanas.

3. Antikūnas arba antikūno funkcinis fragmentas, turintis antigeną surišantį aktyvumą, pagal 1 arba 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad antikūnas yra chimerinis antikūnas.

4. Antikūnas arba antikūno funkcinis fragmentas, turintis antigeną surišantį aktyvumą, pagal 3 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad turi sunkiosios grandinės seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 20 aminorūgščių 20-471 liekanas ir lengvosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 16 aminorūgščių 21-239 liekanas.

5. Antikūnas arba antikūno funkcinis fragmentas, turintis antigeną surišantį aktyvumą, pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad antikūnas yra humanizuotas.

6. Antikūnas arba antikūno funkcinis fragmentas, turintis antigeną surišantį aktyvumą, pagal 5 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad turi:

(a) sunkiosios grandinės kintamos srities seką, parinktą iš grupės, susidedančios iš šių aminorūgščių sekų:

a1) aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 70, apimančios aminorūgščių 20-141 liekanas;

a2) aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 42, apimančios aminorūgščių 20-141 liekanas;

a3) aminorūgščių sekos, turinčios mažiausiai 95 % homologiją su aminorūgščių seka, parinkta iš a1) ir a2);

a4) aminorūgščių sekos, turinčios mažiausiai 99 % homologiją su aminorūgščių seka, parinkta iš a1) ir a2); ir

a5) aminorūgščių sekos, įskaitant nuo vienos iki keleto aminorūgščių liekanų pakeitimą, pašalinimą arba pridėjimą bent vienoje iš aminorūgščių sekų, parinktų iš a1) ir a2); ir

(b) lengvosios grandinės kintamos srities seką, parinktą iš grupės, susidedančios iš šių aminorūgščių sekų:

b1) aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 62, apimančios aminorūgščių 21-134 liekanas;

b2) aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 52, apimančios aminorūgščių 21-134 liekanas;

b3) aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 58, apimančios aminorūgščių 21-134 liekanas;

b4) aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 66, apimančios aminorūgščių 21-134 liekanas;

b5) aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 28, apimančios aminorūgščių 21-134 liekanas;

b6) aminorūgščių sekos, turinčios mažiausiai 95 % homologiją su bet kuria iš aminorūgščių sekų, parinktų iš b1) – b5);

b7) aminorūgščių sekos, turinčios mažiausiai 99 % homologiją su bet kuria iš aminorūgščių sekų, parinktų iš b1) – b5);

b8) aminorūgščių sekos, įskaitant nuo vienos iki keleto aminorūgščių liekanų pakeitimą, pašalinimą arba pridėjimą bent vienoje iš aminorūgščių sekų, parinktų iš b1) – b5).

7. Antikūnas arba antikūno funkcinis fragmentas, turintis antigeną surišantį aktyvumą, pagal 6 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad turi: i) sunkiosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 70, aminorūgščių 20-141 liekanas ir lengvosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 62, aminorūgščių 21-134 liekanas; ii) sunkiosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 70, aminorūgščių 20-141 liekanas ir lengvosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 52, aminorūgščių 21-134 liekanas; iii) sunkiosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 70, aminorūgščių 20-141 liekanas ir lengvosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 58, aminorūgščių 21-134 liekanas; iv) sunkiosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 42, aminorūgščių 20-141 liekanas ir lengvosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 28, aminorūgščių 21-134 liekanas; v) sunkiosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 70, aminorūgščių 20-141 liekanas ir lengvosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 66, aminorūgščių 21-134 liekanas; vi) sunkiosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 70, aminorūgščių 20-471 liekanas ir lengvosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 62, aminorūgščių 21-239 liekanas; vii) sunkiosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 70, aminorūgščių 20-471 liekanas ir lengvosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 58, aminorūgščių 21-239 liekanas; ix) sunkiosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 42, aminorūgščių 20-471 liekanas ir lengvosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 28, aminorūgščių 21-239 liekanas; arba x) sunkiosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 70, aminorūgščių 20-471 liekanas ir lengvosios grandinės kintamos srities seką, apimančią aminorūgščių sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 66, aminorūgščių 21-239 liekanas.

8. Antikūno funkcinis fragmentas, turintis antigeną surišantį aktyvumą, pagal bet kurį iš 1-7 punktų, kuris yra parinktas iš grupės, susidedančios iš Fab, F(ab‘)2, Fab‘ ir Fv.

9. Farmacinė kompozicija, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad apima bent vieną iš antikūnų arba antikūnų funkcinių fragmentų, turinčių antigeną surišantį aktyvumą, pagal bet kurį iš 1-8 punktų.

10. Farmacinė kompozicija pagal 9 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad ji yra farmacinė kompozicija, skirta vėžio gydymui ir/arba prevencijai.

11. Farmacinė kompozicija, skirta vėžio gydymui ir/arba prevencijai, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad apima bent vieną iš antikūnų arba antikūnų funkcinių fragmentų, turinčių antigeną surišantį aktyvumą, pagal bet kurį iš 1-8 punktų ir bent vieną narį, parinktą iš grupės, susidedančios iš paklitakselio, karboplatinos, CPT-11 ir vinblastino.

12. Farmacinė kompozicija pagal 10 arba 11 punktą, kur vėžys yra parinktas iš grupės, susidedančios iš plaučių vėžio, prostatos vėžio, skydliaukės vėžio, skrandžio vėžio, kepenų vėžio, kiaušidžių vėžio, tiesiosios žarnos vėžio, krūties vėžio, kasos vėžio, gimdos vėžio, melanomos, glioblastomos ir kraujo ląstelių vėžio.

13. Antikūnas arba antikūno, turinčio antigeną surišantį aktyvumą, fragmentas pagal bet kurį iš 1-8 punktų, skirtas panaudoti vėžio gydymui ir/arba prevencijai.

14. Antikūnas arba antikūno fragmentas, turinčio antigeną surišantį aktyvumą, pagal bet kurį iš 1-8 punktų, fragmentas, skirtas panaudoti vėžio gydymui ir/arba prevencijai, b e s i s k i r i a n t i s antikūno arba antikūno, turinčio antigeną surišantį aktyvumą, pagal bet kurį iš 1-8 punktų ir bent vieno nario, parinkto iš grupės, susidedančios iš paklitakselio, karboplatinos, CPT-11, vinblastino ir 5-FU vienalaikiu arba nuosekliu įvedimu.

15. Produktas, parinktas iš grupės, susidedančios iš paklitakselio, karboplatinos, CPT-11, vinblastino ir 5-FU, skirtas panaudoti vėžio gydymui ir/arba prevencijai, b e s i s k i r i a n t i s antikūno arba jo funkcinio fragmento, turinčio antigeną surišantį aktyvumą, pagal bet kurį iš 1-8 punktų vienalaikiu arba nuosekliu įvedimu.

16. Antikūnas arba produktas, skirtas panaudoti pagal bet kurį iš 13-15 punktų, kur vėžys yra parinktas iš grupės, susidedančios iš plaučių vėžio, prostatos vėžio, skydliaukės vėžio, skrandžio vėžio, kepenų vėžio, kiaušidžių vėžio, tiesiosios žarnos vėžio, krūties vėžio, kasos vėžio, inkstų vėžio, gimdos vėžio, melanomos, fibrosarkomos, glioblastomos ir kraujo ląstelių vėžio.

17. Polinukleotidas, koduojantis antikūną pagal bet kurį iš 2, 4, 6 arba 7 punktų.

18. Polinukleotidas pagal 17 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad turi: i) nukleotidų seką, apimančią nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 19, 58-423 nukleotidus ir nukleotidų seką, apimančią nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 15, 61-402 nukleotidus; arba ii) nukleotidų seką, apimančią nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 19, 58-1413 nukleotidus ir nukleotidų seką, apimančią nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 15, 61-717 nukleotidus.

19. Polinukleotidas pagal 17 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad turi:

(a) polinukleotidą, parinktą iš grupės, susidedančios iš šių nukleotidų sekų:

a1) nukleotidų sekos, apimančios nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 69, 58-423 nukleotidus;

a2) nukleotidų sekos, apimančios nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 41, 58-423 nukleotidus;

a3) nukleotidų sekos polinukleotido, kuris hibridizuojasi su polinukleotidu, apimančiu nukleotidų seką, komplementarią nukleotidų sekai, parinktai iš a1) ir a2), esant griežtoms sąlygoms; ir

a4) nukleotidų sekos, turinčios nuo vieno iki keleto nukleotidų pakeitimą, pašalinimą arba pridėjimą nukleotidų sekose, parinktose iš a1) ir a2); ir

(b) polinukleotidą, parinktą iš grupės, susidedančios iš šių nukleotidų sekų:

b1) nukleotidų sekos, apimančios nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 61, 61-402 nukleotidus;

b2) nukleotidų sekos, apimančios nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 51, 61-402 nukleotidus;

b3) nukleotidų sekos, apimančios nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 57, 61-402 nukleotidus;

b4) nukleotidų sekos, apimančios nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 65, 61-402 nukleotidus;

b5) nukleotidų sekos, apimančios nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 27, 61-402 nukleotidus;

b6) nukleotidų sekos polinukleotido, kuris hibridizuojasi su polinukleotidu, apimančiu nukleotidų seką, komplementarią nukleotidų sekai, parinktai iš b1)-b5), esant griežtoms sąlygoms; ir

b7) nukleotidų sekos, turinčios nuo vieno iki keleto nukleotidų pakeitimą, pašalinimą arba pridėjimą bet kurioje iš nukleotidų sekų, parinktų iš b1) - b5).

20. Polinukleotidas pagal 19 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad turi:

(i) polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 69, 58-423 nukleotidus ir polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 61, 61-402 nukleotidus; ii) polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 69, 58-423 nukleotidus ir polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 51, 61-402 nukleotidus; iii) polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 69, 58-423 nukleotidus ir polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 57, 61-402 nukleotidus; iv) polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 41, 58-423 nukleotidus ir polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 27, 61-402 nukleotidus; v) polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 69, 58-423 nukleotidus ir polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos

SEQ ID Nr. 65, 61-402 nukleotidus; vi) polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 69, 58-1413 nukleotidus ir polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 61, 61-717 nukleotidus; vii) polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 69, 58-1413 nukleotidus ir polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 51, 61-717 nukleotidus; viii) polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 69, 58-1413 nukleotidus ir polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 57, 61-717 nukleotidus; ix) polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 41, 58-1413 nukleotidus ir polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 27, 61-717 nukleotidus; arba x) polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 69, 58-1413 nukleotidus ir polinukleotidą, apimantį nukleotidų sekos, pavaizduotos SEQ ID Nr. 65, 61-717 nukleotidus.

21. Vektorius, apimantis bet kurį iš polinukleotidų pagal 17-20 punktus.

22. Transformuota ląstelė šeimininkė, apimanti bet kurį iš polinukleotidų pagal 17-20 punktus, arba vektorius pagal 21 punktą.

23. Antikūno pagal bet kurį iš 2, 4, 6 arba 7 punktų gamybos būdas, apimantis ląstelės šeimininkės pagal 22 kultivavimo pakopą ir antikūno išskyrimą iš gauto kultivuoto produkto.

---

*(51)* Int.Cl. ***C12Q 1/68*** (2006.01)
*(11)* **2504449**
*(96)* 10784391.4
*(96)* 2010-11-19
*(97)* 2012-10-03
*(97)* 2016-03-23
*(86)* PCT/US2010/057405
*(86)* 2010-11-19
*(87)* WO 2011/066186
*(87)* 2011-06-03
*(30)* 264643 P, 2009-11-25, US
*(72)* RAMU, Senthil, US
JACOBSON, Joseph, US
CHU, Larry Li-Yang, US
*(73)* Gen9, Inc., Cambridge, MA 02139, US
*(74)* Jurga PETNIŪNAITĖ, 51, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Būdai ir aparatai ant kietos matricos esančios DNR klaidų sumažinimui
Apibrėžties punktai: 16, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Didelio tikslumo oligonukleotidų sukūrimo ant kieto paviršiaus būdas, apimantis:

a) daugybės su paviršiumi surištų viengrandžių oligonukleotidų, apimančių apibrėžtą seką, poveikį polimerazės fermentu, esant sąlygoms, tinkamoms vykti nuo šablono priklausomai sintezės reakcijai, tokiu būdu siekiant gauti aibę dvigrandžių oligonukleotidų, kurie kiekvienas apima su paviršiumi surištą oligonukleotidą ir susintetintą komplementarų oligonukleotidą;

b) dvigrandžių oligonukleotidų aibės denatūraciją tokiu būdu, kad susintetinti oligonukleotidai atpalaiduojami į tirpalą nuo su paviršiumi surištų oligonukleotidų;

c) susintetintų oligonukleotidų pakartotinį surišimą su oligonukleotidais, surištais su paviršiumi, tokiu būdu gaunant pakartotinai surištus dvigrandžius oligonukleotidus; ir

d) pakartotinai surištų dvigrandžių oligonukleotidų kontaktavimą su komponente, atpažįstančia klaidingą suporavimą ir skaldančia, esant sąlygoms, tinkamoms pakartotinai surištų dvigrandžių oligonukleotidų, turinčių klaidingą suporavimą, skaldymui.

2. Didelio tikslumo oligonukleotidų sukūrimo ant kieto paviršiaus būdas, apimantis:

a) pirmosios aibės oligonukleotidų sintezę grandinės ilginimo reakcijoje, naudojant antrąją oligonukleotidų aibę kaip šabloną, kur antroji oligonukleotidų aibė yra imobilizuota kietame paviršiuje ir apima klaidų neturinčius oligonukleotidus ir, pasirinktinai, vieną arba daugiau klaidą turintį oligonukleotidą, kur grandinės ilginimo reakcijoje gaunama pirmoji dupleksų aibė;

b) pirmosios dupleksų aibės denatūraciją, siekiant atpalaiduoti pirmąją nukleotidų aibę nuo antrosios oligonukleotidų aibės;

c) pirmosios oligonukleotidų aibės kontaktavimą su antrąja oligonukleotidų aibe hibridizacijos sąlygomis, kad susidarytų antroji dupleksų aibė, kurioje, kai antroji oligonukleotidų aibė apima vieną arba daugiau klaidingų oligonukleotidų, sudarančių klaidingą seką, klaidą turinčioje padėtyje, o antroji dupleksų aibė apima klaidingą suporavimą turintį heterodupleksą;

d) duplekso, turinčio bent vieną klaidingo suporavimo dalį, atskėlimą, klaidingą suporavimą atpažįstančios ir skaldančios komponentės pagalba, tokiu būdu sukuriant didelio tikslumo dvigrandžius oligonukleotidus; ir

e) pasirinktinai, didelio tikslumo dvigrandžių oligonukleotidų selektyvią denatūraciją.

3. Nukleorūgšties polimerų surinkimo būdas, apimantis šias pakopas:

a) dvigrandžių didelio tikslumo oligonukleotidų dviejų arba daugiau pulų sukūrimą būdu pagal 1 punktą;

b) norimo pulo su didelio tikslumo oligonukleotidais denatūraciją, tokiu būdu atpalaiduojant į tirpalą viengrandžius didelio tikslumo oligonukleotidus ;

c) viengrandžių didelio tikslumo oligonukleotidų pulų apjungimą reakcijos mišinyje; ir

d) sukūrimą reakcijos mišinyje sąlygų, tinkamų vienam arba daugiau iš hibridizacijos, ligavimo arba grandinės pailginimo.

4. Būdas pagal 2 punktą, kur antroji oligonukleotidų aibė yra susintetinta ant kieto paviršiaus cheminiu būdu ir imobilizuota ant kieto paviršiaus pagal vieną arba daugiau sudedamųjų dalių.

5. Būdas pagal 2 punktą, kur antroji oligonukleotidų aibė yra prijungta prie kieto paviršiaus pagal vieną arba daugiau sudedamųjų dalių, ir kur po veiksmo b) viena arba daugiau iš pirmųjų oligonukleotidų aibių difunduoja iš prijungimo vietos.

6. Būdas pagal bet kurį iš 1-2 punktą, kur klaidingą suporavimą atpažįstanti ir atskelianti komponentė apima klaidingo suporavimo endonukleazę.

7. Būdas pagal bet kurį iš 1-2 punktą, kur klaidingą suporavimą atpažįstanti ir atskelianti komponentė atlieka cheminį skaldymą.

8. Bent vieno oligonukleotido su iš anksto nustatyta seka sukūrimo ant kieto paviršiaus būdas, apimantis:

a) dvigrandžių oligonukleotidų pirmosios aibės sintezę ant kieto paviršiaus, naudojant antrąją oligonukleotidų aibę kaip šabloną;

b) pirmosios oligonukleotidų aibės atpalaidavimą nuo antrosios oligonukleotidų aibės atskiroje mikrotalpoje;

c) antrosios oligonukleotidų aibės kontaktavimą su pirmąja oligonukleotidų aibe hibridizacijos sąlygomis, siekiant suformuoti dvigrandžių oligonukleotidų antrąją aibę atskiroje mikrotalpoje;

d) dvigrandžių oligonukleotidų antrosios aibės kontaktavimą ir skaldymą, atliekamą agento, susirišančio su klaidingai suporuotą vieta, kur klaidingai suporuotą vietą surišantis agentas selektyviai rišasi ir suskaldo dvigrandžius oligonukleotidus, apimančius klaidingai suporuotas bazes; ir

e) dvigrandžių oligonukleotidų, apimančių klaidingai suporuotas bazes, pašalinimą, tokiu būdu gaunant oligonukleotidus be klaidų.

9. Būdas pagal 8 punktą, kur klaidingai suporuotą vietą surišantis agentas yra klaidingo suporavimo atžvilgiu specifinė endonukleazė, ir skaldo klaidingo suporavimo srityje.

10. Būdas pagal 9 punktą, kur klaidingo suporavimo atžvilgiu specifinė endonukleazė yra CEL fermentas.

11. Būdas pagal 8 punktą, kur pirmosios aibės oligonukleotidų atpalaidavimo etapas vyksta denatūravimo sąlygomis.

12. Būdas pagal 8 punktą, kur antroji oliginukleotidų aibė siejasi su diskrečia paviršiaus ypatybe, ir kur ypatybė yra selektyviai hidratuota, tokiu būdu pateikiant antrąją oligonukleotidų aibę atskiroje talpoje.

13. Būdas pagal 12 punktą, kur ypatybė yra selektyviai hidratuota lašinant tirpalą, apimantį polimerazę, dNTPs, tirpalą, skatinantį pradmens pailginimą, bent vieną pradmenį, kur pradmuo yra komplementarus pradmenį surišančiai sričiai, esančioje antrojoje oligonukleotidų aibėje.

14. Būdas pagal 8 punktą, dar atpalaiduojantis neturinčius klaidų oligonukleotidus į tirpalą.

15. Būdas pagal 1, 2 arba 8 punktą, kur kietas pagrindas yra mikrogardelė.

16. Būdas pagal 2 punktą, kur klaidingą suporavimą turintis heterodupleksas yra susuformuojamas tarp klaidą turinčio oligonukleotido iš antrosios oligonukleotidų aibės ir vieno neturinčio klaidų oligonukleotido iš oligonukleotidų, neturinčių klaidų, pirmosios oligonukleotidų aibės.

---

*(51)* Int.Cl. ***E01F 9/529*** (2006.01)
*(11)* **2373847**
*(96)* 09835661.1
*(96)* 2009-12-18
*(97)* 2011-10-12
*(97)* 2016-04-13
*(86)* PCT/US2009/068699
*(86)* 2009-12-18
*(87)* WO 2010/075206
*(87)* 2010-07-01
*(30)* 341220, 2008-12-22, US
*(72)* METTLER, Charles M., US
BROWN, Gregory H., US
*(73)* Plastic Safety Systems, Inc., Cleveland, Ohio 44104, US
*(74)* Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
*(54)* Portatyvinis greitkelio įspėjamasis įrenginys
Apibrėžties punktai: 16, brėžiniai: 11.
*(57)* 1. Portatyvinis greitkelio įspėjamasis įrenginys, apimantis bent vieną pailgą garsinę juostą (1), turinčią iš esmės didesnį ilgį nei plotį ir iš esmės didesnį plotį nei storį, ir galo bei šonines briaunas (6, 7, 4, 5), kuriame garsinė juosta (1) yra pagaminta iš lanksčios polimerinės medžiagos, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad apsauginė juosta (1) turi iš esmės plokščią viršaus ir apačios paviršius (2, 3) ir daugybė skersine kryptimi išdėstytų plokštelių arba strypų (8) yra įstatyti garsinės juostos (1) viduje tam, kad numatytų garsinės juostos (1) balastą, plokštelės arba strypai (8) eina skersai per garsinės juostos (1) plotį tam, kad leistų garsinę juostą (1) suvynioti išilgai nuo galo iki galo, kai nenaudojamas, ir suteikti standumą skersine kryptimi.

2. Įrenginys pagal 1 punktą, dar b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad iš esmės plokščias viršaus paviršius yra numatytas be jokių išsikišimų, besidriekiančių virš viršaus paviršiaus.

3. Įrenginys pagal 1arba 2 punktą, dar b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad metalinės plokštės arba strypai (8) yra įstatyti apytikriai garsinės juostos (1) storio centre.

4. Įrenginys pagal 1arba 2 punktą, dar b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad viena iš apsauginės juostos šoninių briaunų (4’) yra nuožulni ir metalo plokščių arba strypų (8’) vienas galas (11) yra panašiai nuožulnus ir driekiasi dalinai į garsinės juostos (1) nuožulnią šoninę erdvę (4’).

5. Įrenginys pagal 1arba 2 punktą, dar b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad garsinė juosta (1) turi plotį tarp 20,32 cm (8colių) ir 40,64 cm (16 colių) ir storį tarp 1,2 cm (1/2 colio) ir 2,54 cm (1 colio) ir geriau, kai plotis apytikriai 30,48 cm (12 colių), ilgis apytikriai 3,35 m (11pėdų), ir storis apytikriai 1,91 cm (3/4 colių).

6. Įrenginys pagal 1arba 2 punktą, dar b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad plokštelės arba strypai (8) turi plotį tarp 3,81 cm (1 1/2 colių) ir 6,35 cm (2 ½ colių) ir tarpas ten tarp jų 3,81 cm (1 1/2 colio) ir 5,08 cm (2 colių), geriau, kai apytikriai 4,76 cm (1 7/8 coliai).

7. Įrenginys pagal 6 punktą, dar b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad garsinė juosta (1) turi plotį apytikriai 30,48 cm (12 colių) ir storį apytikriai 1,91 cm (3/4 colių), ir plokštelės ir strypai (8) turi storį apytikriai 0,95 cm (3/8 colių), ilgį apytikriai 26,35 cm (10 3/8 colių), ir plotį apytikriai 5,08 cm (2 colių), ir čia yra tarpai apytikriai 4,76 cm (1 7/8 colių) tarp kiekvienos iš plokštelių arba strypų (8), įstatytų į garsinę juostą (1).

8. Įrenginys pagal 1arba 2 punktą, dar b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad garsinės plokštės (1) bent vienas iš viršaus ir apačios paviršių (2, 3) turi tekstūrą (9) per visą viršaus paviršių (2) ir (arba) pagrindo paviršių (3).

9. Įrenginys pagal 1arba 2 punktą, dar b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad garsinės plokštės (1) pagrindo paviršius (3) turi atvirą rombo formos išdėstymą (10) per minėtą pagrindo paviršių, kuris suteikia kanalus, einančius per visą pagrindo paviršiaus plotį tam, kad leistų pasišalinti vandeniui iš garsinio strypo apačios, kai patalpintas priešais važiuojamąją kelio dalį.

10. Įrenginys pagal 1arba 2 punktą, dar b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad garsinė juosta (1») turi apatinį storį (15), kuris yra padarytas iš minkštesnės polimerinės medžiagos negu garsinės juostos (1») viršutinis storis (16), kuris yra pagamintas iš kietesnės polimerinės medžiagos negu apatinis storis.

11. Įrenginys pagal 1arba 2 punktą, dar b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad garsinė juosta (1») turi įvairaus kietumo polimerinių medžiagų viršutinį ir apatinį storius (15, 16).

12. Įrenginys pagal 11 punktą, dar b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad garsinės juostos (1») polimerinės medžiagos apatinis storis (15) turi mažesnį kietumą, nei polimerinės medžiagos viršutinis storis (16).

13. Įrenginys pagal 12 punktą, dar b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad garsinės juostos (1») polimerinės medžiagos viršutinis storis (16) yra iš esmės didesnis už garsinės juostos polimerinės medžiagos apatinį storį (15).

14. Įrenginys pagal 12 punktą, dar b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad garsinės juostos (1») polimerinės medžiagos viršutinis storis (16) yra apytikriai 1,59 cm (5/8 colių) storio ir garsinės juostos polimerinės medžiagos apatinis storis (15) yra apytikriai 0,32 cm (1/8 colių) storio.

15. Įrenginys pagal 12 punktą, dar b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad garsinės juostos (1») polimerinės medžiagos apatinis storis (15) turi kietumą pagal Šorą A tarp 40 ir 60 ir garsinės juostos polimerinės medžiagos viršutinis storis (16) turi kietumą pagal Šorą A tarp 65 ir 80.

16. Įrenginys pagal 1arba 2 punktą, dar b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad garsinė juosta (1) turi rankenos lizdą (18), einantį per garsinę juostą greta vienos arba abiejų garsinės juostos galinių briaunų.

---

*(51)* Int.Cl. ***E04C 2/04*** (2006.01)
*(11)* **2155983**
*(96)* 08775458.6
*(96)* 2008-06-04
*(97)* 2010-02-24
*(97)* 2016-03-16
*(86)* PCT/FI2008/050333
*(86)* 2008-06-04
*(87)* WO 2008/148940
*(87)* 2008-12-11
*(30)* 20070243 U, 2007-06-07, FI
*(72)* SEVÓN, Jukka, FI
LEHTINEN, Markku, FI
NIKULA, Merja, FI
*(73)* Paroc Group Oy, 00180 Helsinki, FI
Valkeakosken Betoni Oy, 37600 Valkeakoski, FI
Narmapinnoitus OY, 20360 Turku, FI
*(74)* Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
*(54)* Ugniai atspari vėdinimo konstrukcija pastatui
Apibrėžties punktai: 4, brėžiniai: 1.
*(57)* 1. Ugniai atspari vėdinama konstrukcija (7) pastatui, kuri kaip vidinės sienos aptaisymą apima betono elementą (1) ir mineralinės vatos sluoksnį (8), kuris yra pririštas prie betono elemento išorinės pusės ir kuris ant jo išorinės pusės

turi kietą apsaugos nuo vėjo dangą (3), pritaikytą statybinio skiedinio būsenoje prie mineralinės vatos sluoksnio ir laidžią drėgmei ir neužsidegančiai, taip pat fasado elementą (4), kuris yra apsaugotas tvirtiklių priemonėmis (5) ir tarpikliais (6) per vėjo apsaugos dangą (3), ir izoliaciją (8) prie vidinės betono aptaisymo (1) taip, kad tarp fasado elemento (4) ir vėjo apsaugos dangos (3) pasiliktų reikalingas ventiliacijai oro tarpas (9).

2. Konstrukcija (7) pagal 1 punktą, kurioje apsaugos nuo vėjo danga (3) susideda iš mineralinės kilmės medžiagos.

3. Konstrukcija (7) pagal 2 punktą, kurioje mineralinės kilmės substancija susideda iš pirmojo sluoksnio tinko drėbsnio.

4. Konstrukcija (7) pagal bet kurį 1 – 3 punktą, kurioje izoliacija (8) yra pritaikyta prie betono vidinio aptaisymo elemento (1) betono elemento liejimo proceso metu.

---

*(51)* Int.Cl. ***E04C 2/292*** (2006.01)
*(11)* **2432948**
*(96)* 10710937.3
*(96)* 2010-02-04
*(97)* 2012-03-28
*(97)* 2016-05-04
*(86)* PCT/SI2010/000005
*(86)* 2010-02-04
*(87)* WO 2010/090607
*(87)* 2010-08-12
*(30)* 200900028, 2009-02-04, SI
*(72)* POPIT, Tomaz, SI
DRCAR, Janez, SI
ZUPANC, Bostjan, SI
*(73)* Trimo d.d., 8210 Trebnje, SI
*(74)* Liucija JANICKAITĖ, 29, Inpatra UAB, Šeškinės g. 59-53, LT-07162 Vilnius, LT
*(54)* Modulinis sluoksniuotas panelis ir jo surinkimo būdas
Apibrėžties punktai: 18, brėžiniai: 10.
*(57)* 1. Modulinis sluoksniuotas panelis (1) su sandarinimo elementais, minėtas modulinis sluoksniuotas panelis (1), apimantis apatinę plokštę (9), dangą (5), izoliacinį užpildą (8) tarp minėtos apatinės plokštės (9) ir minėtos dangos (5), vidinį sandūros tarpiklį (10), išilginį sandūros tarpiklį (11) ant minėto modulinio sluoksniuoto panelio (1) išorinės pusės, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtas modulinis sluoksniuotas panelis (1) papildomai turi išorinio kampo tarpiklį (6) ir vidinio kampo tarpiklį (7), kurių kiekvienas yra įdėtas į išorinės dangos (5) kampą, minėtas vidinio kampo tarpiklis (7) turi ertmę gretimo modulinio sluoksniuoto panelio išorinio kampo tarpikliui (6) įterpti, kur membrana (702) yra numatyta minėto vidinio kampo tarpiklio (7) ertmėje, ir kur išorinio kampo tarpiklis (6) ir vidinio kampo tarpiklis (7) - kiekvienas yra numatytas su atlanku (603, 703).

2. Panelis pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kampiniai tarpikliai (6, 7), kurie įterpiami į išorinio panelio kampus, yra iš gumos arba dirbtinių medžiagų, skirtų sandarinimui, medžiagų derinio ir medžiagų, integruotų į membraną (702), kietumas numatytas intervale nuo 40 iki 90 Šoro vertės, pageidautina, 70 Šoro, esant sienos storiui nuo 0,3 mm iki 2 mm, kai gumos kietumas yra nuo 20 iki 90 Šoro vertės, papildomai tuo, kad asimetriniai atlankai (603, 703), integruoti į kampinius tarpiklius (6, 7), numatant santykinę poziciją tarp dviejų atitvarų ant kampinių tarpiklių (6, 7), kur atitvarai yra ploni, kintamo storio nuo 0,1 mm iki 3 mm, pločio nuo 0,1 iki 30 mm ir ilgio nuo 5 iki 150 mm ir elastingi, kadangi medžiagos kietumas yra 40-90 Šorų ir toliau, kad jie sulenkti į vidų ir sudaro vertikalų vientisą sandarinimo paviršių ant skersinio tarpiklio (4) intarpo, sudaryto iš įvairių lygių standumo arba pritaikomumo medžiagos, ir tarpiklio (401) pagrindinė dalis yra iš kietesnės medžiagos, kurios kietumas yra nuo 40 iki 90 Šorų, o minkštesnio tarpiklio (402) intarpo kietumu yra nuo 10 iki 30 Šorų, tuo būdu skersinis tarpiklis (4) turi drenažo griovelį (406) ir drenažo kanalą (405).

3. Panelis pagal bet kurį vieną iš 1- 2 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kampinis tarpiklis (6, 7), užpildomas trūkstama dangos (5) dalimi, yra iš vientisos gumos, jungiančios išilginį ir skersinį dangos (5) sujungimą į vientisą dangą, tuo tarpu metalo lakštas abiejuose suformuotuose kanaluose yra trumpesnis kaip minėtos dangos (5) ilgis arba plotis, kuri yra optimaliame intervale, kai trūksta medžiagos nuo 30 iki 200 mm (x).

4. Panelis pagal bet kurį vieną iš 1-3 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jį sudaro į išorinio panelio kampus įterpti kampiniai tarpikliai (6, 7), pagaminti iš gumos arba kitos medžiagos, arba medžiagos derinio su savybėmis, leidžiančiomis dangos (5) sandarinimą, tuštumų ar formos trūkumų užpildymą, tuo tarpu išilginio kanalo (503) išėjime yra suformuotas 1-5 mm gylio įspaudas į metalo lakštą (502), leidžiantis pritaikyti kampinio tarpiklio (6) ir dangos (5) sujungimą išilginėje jungtyje.

5. Panelis pagal bet kurį vieną iš 1-4 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kampinis tarpiklis (6, 7) užpildo trūkstamą medžiagą, papildomai sudaro išorinio panelio (2) vientisumą, sandarina kampą arba apsaugo nuo vandens pratekėjimo pagal išorinį panelį (2) dėl trūkstamos medžiagos ir apsaugo išpjautas medžiagos dalis nuo korozijos.

6. Panelis pagal bet kurį vieną iš 1-5 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis turi papildomą linijinį elementą (3) ir priemones, skirtas padengti tarpus tarp gretimų modulinių sluoksniuotų panelių (1).

7. Panelis pagal bet kurį vieną iš 1-6 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis turi linijinius elementus (3), tarnaujančius kaip lengvų elementų nešiklius.

8. Panelis pagal bet kurį vieną iš 1-7 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis turi pritvirtinamą sistemą kaip priemonę, skirtą pritvirtinti linijinius elementus (3) ant modulinio sluoksniuoto panelio (1) dangos (5).

9. Panelis pagal bet kurį vieną iš 1-8 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad tvirtinamų elementų (13) tvirtinimas vykdomas dviejų medžiagų šalto lydymo priemonėmis, jų nesuardant.

10. Panelis pagal bet kurį vieną iš 1-9 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad moduliniame sluoksniuotame panelyje (1) yra integruoti sandarinimo elementai, ir tvirtinamas tik minėtas modulinis sluoksniuotas panelis (1) ant pastato arba apsaugoma tvirtinimo padėtis nuo vandens pralaidumo ir dėl estetinių priežasčių.

11. Panelis pagal bet kurį vieną iš 1-10 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kampiniame tarpiklyje (7) yra pastatyta membraną (702) išilginio tarpiklio (11) pirminės ir galutinės padėties pakeitimui kompensuoti.

12. Panelis pagal bet kurį vieną iš 1-4 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad skersiniame tarpiklyje (4) antrojo lygio vandens drenažas yra drenažo kanalas, kuris numatytas nustumti vandenį nuo pastato vertikalios plokštumos pratekėjimo atveju.

13. Panelis pagal bet kurį vieną iš 1-4 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad dangos (5) metalo lakštas yra nelaidus, bet pritaikytas, kad būtų hermetiškas vandeniui ir orui ir tuo pačiu metu turėtų būtiną tvirtinimo elementų dekoratyvinių skersinių (13) apkrovos nešimo gebą.

14. Modulinio sluoksniuoto panelio pagal bet kurį iš 1-13 punktų surinkimo būdas, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kampinis tarpiklis (6) yra įstatomas į dangos (501) kampą su papildomu hermetiku ir laikinai pritvirtinamas prie dangos (5), prijungus dangos (503) išilginį kanalą, sudaromas pritaikomas ryšys ir tuo pačiu metu dangos tarpiklio (7) išilginiame kanale fiksuojamas išilginis tarpiklis (11).

15. Būdas pagal 14 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad dviejų gretimų panelių surinkimo metu vidinis tarpiklis yra fiksuojamas sujungime, sudarant sandarumą iš vidinės pusės, tuo būdu netiksli išilginio tarpiklio (11) pradinė ir galutinė padėtis yra kompensuojama kampiniame tarpiklyje (7) įstatyta membrana (702), ir toliau ant ir išilginės jungties (11) tarpiklio padėtis kampiniame tarpiklyje (7) esančios membranos (702) pagalba yra perkeliama, kad tarpiklio storiu į vidų ir todėl suteikiama papildoma tarpiklio storio kompensacija fasado sujungimui ir sandarinimui.

16. Būdas pagal bet kurį vieną iš 14-15 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad tik modulinio sluoksniuoto panelio (1) surinkimas yra vykdomas ant pastato su jau integruotais tarpikliais išilginiame sujungime ir kampiniuose tarpikliuose (6, 7), tuo tarpu skersinis tarpiklis (4) yra įterpiamas surinkimo metu.

17. Būdas pagal bet kurį vieną iš 14-16 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad integruotų asimetrinių atlankų (603, 703) sistema kampinio elemento (6, 7) santykinės padėties kompensavimui, paslenkant dviejų gretimų modulinių sluoksniuotų panelių (1), sujungtų tarpusavyje naudojant „įlaidas-griovelis“ sistemą, yra vykdoma, išilginės padėties pasislinkimas rodomas santykinės padėties poslinkiu dviejų plonų ir elastingų atitvarų ant kampinių tarpiklių (6, 7), kurie yra išlenkiami į vidų įterpiant skersinį tarpiklį (4) ir todėl sudaro horizontalų vientisą sandarinimo paviršių.

18. Būdas pagal bet kurį vieną iš 14-16 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad į modulinio sluoksniuoto panelio (1) dangos (5) skersinio sujungimo kanalą (504) yra integruojamas orui ir vandeniui nelaidus tvirtinimo profilis (12), naudojant šalto lydymo (121) būdą, ir papildomai šis tvirtinimo profilis (12) yra naudojamas tvirtinimo taško apkrovai paskirstyti.

---

*(51)* Int.Cl. ***E04G 21/32*** (2006.01)
*(11)* **2824255**
*(96)* 13176281.7
*(96)* 2013-07-12
*(97)* 2015-01-14
*(97)* 2016-02-24
*(72)* Cooper, Paul, SE
*(73)* Safety Solutions Jonsereds AB, 832 96 Frösön, SE
*(74)* Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Tvirtinimo sistema
Apibrėžties punktai: 13, brėžiniai: 4.

*(57)* 1. Tvirtinimo sistema (100) apsauginiam tinklui tvirtinti prie atraminio paviršiaus, apimanti tvirtinimo bloką (110), sudarytą iš bent vienos prikabinamosios dalies (111), pritaikytos bent daliai apsauginio tinklo įstatyti, ir atraminio bloko (120), pritaikyto sukabinti su minėtu atraminiu paviršiumi, kur tvirtinimo blokas (110) yra pritaikytas sukabinti su minėtu atraminiu bloku (120) naudojant fiksuojamąjį elementą (115), kur minėtas fiksuojamasis elementas (115) turi pailgą angą (117), pritaikytą minėto atraminio bloko (120) daliai įstatyti, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad minėtas fiksuojamasis elementas (115) yra sudarytas taip, jog pailgoji anga (117) yra išlenkta nustatytu kampu α.

2. Tvirtinimo sistema pagal 1 arba 2 punktą, kur minėtas fiksuojamasis elementas iš esmės yra U pavidalo.

3. Tvirtinimo sistema pagal 2 punktą, kuri apima dvi tvirtinimo dalis ir kur minėtos tvirtinimo dalys yra prijungtos prie atitinkamų minėtos U pavidalo dalies šakų.

4. Tvirtinimo sistema pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, kur nustatytasis kampas α yra nuo 20 iki 70 laipsnių pasirinktinai.

5. Tvirtinimo sistema pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, kur minėtas fiksuojamasis elementas apima kreipiamąją dalį.

6. Tvirtinimo sistema pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, kur minėta bent viena fiksuojamoji dalis apima kablio formos elementą.

7. Tvirtinimo sistema pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, kur minėtas tvirtinimo blokas yra sudarytas iš lenkto plieninio strypo.

8. Tvirtinimo sistema pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, kur atraminis blokas (120) apima pagrindinę dalį (123) su išpjova (121) ir kur minėtas fiksuojamasis elementas (115) bei minėta išpjova (121) yra pritaikyti sukabinti sumontavus sistemą.

9. Tvirtinimo sistema pagal 8 punktą, kur minėta išpjova (121) bent per dalį apskritimo yra minėtoje pagrindinėje dalyje.

10. Tvirtinimo sistema pagal 8 arba 9 punktą, kur minėtos išpjovos (121) apatinė dalis yra suapvalinta.

11. Tvirtinimo sistema pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, kur minėtas atraminis blokas (120) apima bent vieną stabdomąjį elementą (123) minėtos fiksuojamojo elemento (115) judėjimui pirmyn minėto atraminio paviršiaus atžvilgiu riboti.

12. Tvirtinimo sistema pagal bet kurį iš pirmesnių punktų, kur minėto atraminio bloko (120) minėta pagrindinė dalis iš esmės yra cilindro formos.

13. Apsauginio tinklo sistema (200), apimanti apsauginį tinklą (50) ir daugybę tvirtinimo sistemų (100) pagal bet kurį iš pirmesnių punktų.

---

*(51)* Int.Cl. ***E05B 19/26*** (2006.01)
***E05B 47/00*** (2006.01)
*(11)* **2468987**
*(96)* 11450152.1
*(96)* 2011-12-13
*(97)* 2012-06-27
*(97)* 2016-03-30
*(30)* 21212010, 2010-12-22, AT
*(72)* Enne, Reinhard J. Ing., AT
*(73)* EVVA Sicherheitstechnologie GmbH, 1120 Wien, AT
*(74)* Vitalija BANAITIENĖ, 55, UAB TARPINĖ, A.P.Kavoliuko g. 24-152, LT-04328 Vilnius, LT
*(54)* Užrakto cilindras
Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 4.

*(57)* 1. Užrakto cilindras ir raktas, kur minėtas užrakto cilindras suformuotas su korpusu ir galinčia pasisukti cilindro šerdimi (9), turinčia rakto kanalą (10), kur numatyti bent vienas paslankiai išdėstytas užklausos elementas (12), kurį gali perkelti magnetinė jėga ir bent vienas skenavimo elementas, skenuojantis užklausos elemento (12) padėtį, o minėtas skenavimo elementas sąveikaudamas su bent vienu užrakto cilindro fiksavimo elementu, sukelia atrakinimą arba užrakinimą, kur užrakto cilindras, ypač cilindro šerdis (9) turi priemonę, kitokią negu užklausos elementas (12), skirtą sukurti magnetinį srautą, sklindantį per rakto kanalą (10) ir verčiantį bent vieną paslankiai išdėstytą užklausos elementą (12) judėti, ir kur raktas yra suformuotas su galvute ir rakto liežuvėliu, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad rakto liežuvėlis (3) sudarytas iš medžiagos, turinčios didelę magnetinę varžą ir jame yra įterpta bent viena mažesnės magnetinės varžos neįmagnetinta zona (4), kuri suformuoja rakto paviršiuje bent vieną lauko įėjimo vietą (5) ir bent vieną lauko išėjimo vietą (6), kur esant padėčiai kai raktas (1) yra įkištas į rakto kanalą (10), kiekvienas užklausos elementas (12), kuris gali būti perkeltas magnetinės jėgos pagalba, yra susietas su rakto (1) mažesnės magnetinės varžos neįmagnetinų zonų (4) lauko išėjimo vietomis (6).

2. Užrakto cilindras ir raktas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad priemonė, skirta magnetiniam srautui sukurti, apima nuolatinį magnetą arba elektromagnetą.

3. Užrakto cilindras ir raktas pagal 1 arba 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad daugybė paslankiai išdėstytų užklausos elementų (12), kuriuos gali perkelti magnetinė jėga, yra išdėstyti palei rakto kanalą (10) išilginę tįsą.

4. Užrakto cilindras ir raktas pagal 1, 2 arba 3 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad užklausos elementai (12) yra išdėstyti tik vienoje rakto kanalo (10) pusėje.

5. Užrakto cilindras ir raktas pagal bet kurį 1 - 3 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad užklausos elementai (12) yra išdėstyti dviejose priešais esančiose rakto kanalo (10) pusėse.

6. Užrakto cilindras ir raktas pagal bet kurį 1 - 5 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kiekvienas užklausos elementas sudarytas iš magnetinio rotoriaus (12).

7. Užrakto cilindras ir raktas pagal bet kurį 1 - 6 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad cilindro šerdis (9), ypač cilindo šerdies išorinis paviršius yra sudarytos iš medžiagos, turinčios didelę magnetinę varžą, ypač iš tokios medžiagos, kaip varis, turintis didesnę magnetinę varžą negu geležis.

8. Užrakto cilindras ir raktas pagal bet kurį 2 - 7 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad cilindro šerdis (9) apima bent vieną zoną iš feromagnetinės medžiagos ir sąveikaujančią su nuolatiniu magnetu, kad suformuotų magnetinę grandinę.

9. Užrakto cilindras ir raktas pagal bet kurį 1 - 8 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad bent viena mažesnės magnetinės varžos zona (4) apima lauko įėjimo vietą (5) ir lauko išėjimo vietą (6), esančias priešais išdėstytose rakto (1) pusėse.

10. Užrakto cilindras ir raktas pagal bet kurį 1 - 9 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad lauko įėjimo vieta (5) yra išdėstyta taip, kad būtų per atstumą atžvilgiu lauko išėjimo vietos (6) skersnine kryptimi rakto paviršiaus normalei.

11. Užrakto cilindras ir raktas pagal bet kurį 1 - 10 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad mažesnės magnetinės varžos neįmagnetinta zona (4) lauko išėjimo vietoje (6) turi skerspjūvį kuris yra pasuktas atžvilgiu skerspjūvio lauko įėjimo vietoje (5).

12. Užrakto cilindras ir raktas pagal bet kurį 1 - 11 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad mažesnės magnetinės varžos neįmagnetinta zona (4) turi stačiakampį skrespjūvį lauko įėjimo vietoje (5) ir pasirinktinai lauko išėjimo vietoje (6).

13. Užrakto cilindras ir raktas pagal bet kurį 1 - 12 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad raktas (1) apima mechaninį kodavimą, ypač profilio, galintį įvesti į veikiantį sujungimą su mechaniniais užklausos elementais.

14. Užrakto cilindras ir raktas pagal bet kurį 1 - 12 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad esant padėčiai kai raktas (1) yra įvestas į rakto kanalą (10), kiekvienas užklausos elementas (12), kuris gali būti perkeltas magnetinės jėgos pagalba, yra susietas su rakto (1) mažesnės magnetinės varžos neįmagnetintų sričių (4) lauko įėjimo vietomis (5).

15. Užrakto cilindras ir raktas pagal bet kurį 1 - 14 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad lauko įėjimo vietos (5) kaip ir lauko išėjimo vietos (6) užklausos elementai (12) yra išdėstomi betarpiškai greta.

---

*(51)* Int.Cl. ***F03D 80/00*** (2006.01)
*(11)* **2521859**
*(96)* 11700820.1
*(96)* 2011-01-10
*(97)* 2012-11-14
*(97)* 2016-04-06
*(86)* PCT/EP2011/050202
*(86)* 2011-01-10
*(87)* WO 2011/083156
*(87)* 2011-07-14
*(30)* 102010000756, 2010-01-08, DE
*(72)* RÖER, Jochen, 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 jėgainė
Apibrėžties punktai: 6, brėžiniai: 5.
*(57)* 1. Vėjo jėgainė, turinti gondolą (16), turinčią bent vieną skystinio aušinimo komponentą ir turinčią šilumokaitį (28), kur šilumokaitis (28) yra integruotas į gondolos (16) išorinį profilį, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad šilumokaitis (28) yra išdėstytas ant nešiklio, o nešiklis yra sukonstruotas kaip atskira gondolos sudedamoji dalis.

2. Vėjo jėgainė pagal 1 punktą, kur šilumokaitis (28) turi bent vieną briaunuotą vamzdį (34).

3. Vėjo jėgainė pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, kur šilumokaitis (28) turi briaunuotą vamzdį (34), kuris yra suvytas bent dalinai nenutrūkstamai.

4. Vėjo jėgainė pagal bet kurį 1 punktą arba 2 punktą, kur šilumokaitis (28) turi daugybę briaunuotų vamzdžių (34), kurie yra išdėstyti lygiagrečiai.

5. Vėjo jėgainė pagal bet kurį iš 2-5 punktų, papildomai turinti prispaudžiančius laikiklius (36), kurie išdėstyti gondolas išilginės ašies kryptimi, ir kurie išlaiko briaunuotą vamzdį (34) arba briaunuotus vamzdžius (34) jų montavimo padėtyje.

6. Vėjo jėgainė pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, papildomai turinti ventiliatorių (38), kuris yra išdėstytas tokiu būdu, kad traukiamas oras sklinda apie šilumokaitį (28).

---

*(51)* Int.Cl. ***F04D 25/08*** (2006.01)
***F04D 29/54*** (2006.01)
***F04D 29/60*** (2006.01)

*(11)* **2488759**

*(96)* 10778840.8

*(96)* 2010-10-13

*(97)* 2012-08-22

*(97)* 2016-02-10

*(86)* PCT/DK2010/050266

*(86)* 2010-10-13

*(87)* WO 2011/044910

*(87)* 2011-04-21

*(30)* 200901119, 2009-10-13, DK

*(72)* KAMPF, Lars, Verner, DK

*(73)* Novenco A/S, 4700 Naestved, DK

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

*(54)* Ašinio ventiliatoriaus konstrukcijos sistema

Apibrėžties punktai: 6, brėžiniai: 5.

*(57)* 1. Ašinio ventiliatoriaus (1) konstrukcijos sistema, kur minėtas ašinis ventiliatorius (1) apima iš esmės apskritą cilindrinį ortakį (3), sukonfigūruotą aplink tą pačią centrinę ašį, kaip ir ventiliatoriaus rotorius (5), minėtas ventiliatoriaus rotorius (5) turi rotoriaus stebulę (4), iš esmės sutampančią su ortakio (3) centrine ašimi ir yra įrengtas kaip variklinės pavaros (6) varančiojo veleno tąsa bei su juo sujungtas, kur už ventiliatoriaus variklio (5) yra variklio gaubtas variklinei pavarai sumontuoti ir laikyti, apimantis iš esmės apskritą cilindrinį vidinį vamzdį (24), kurio priešakinis galas yra nukreiptas į rotoriaus stebulę (4), o priešingas galas – tolyn nuo rotoriaus stebulės (4), ir kuris laikomas ortakyje (3) briaunomis (20) taip, kad vidinio vamzdžio (24) centrinė ašis sutampa su ortakio (3) centrine ašimi; kur variklio gaubtas papildomai apima vieną ar daugiau tvirtinimo elementų (25, 25a), sukonfigūruotų variklinei pavarai (6) tvirtinti prie vidinio vamzdžio (24), b e s i s k i r i a n t i tuo, kad sistema apima bent vieną mažą ir bent vieną didelę variklinę pavarą (6, 6a), abi minėtos variklinės pavaros (6, 6a) yra pritaikytos tvirtinti prie tvirtinimo elementų (25, 25a); kur mažosios variklinės pavaros (6a) didžiausias skersmuo, išmatuotas statmenai varančiojo veleno centrinei ašiai, yra mažesnis už atitinkamą didžiosios variklinės pavaros (6) didžiausią skersmenį; kur vidinio vamzdžio (24) vidinis skersmuo yra didesnis už mažosios variklinės pavaros (6a) didžiausią skersmenį ir mažesnis už didžiosios variklinės pavaros (6) didžiausią skersmenį; kur tvirtinimo elementai (25, 25a) apima pirmąjį tvirtinimo elementą (25a), pritaikytą mažajam varikliui (6a) tvirtinti prie vidinio vamzdžio (24) taip, kad bent dalis mažojo variklio (6a), kurios skersmuo yra didesnis, būtų visiškai įstatyta į vidinį vamzdį (24), ir antrąjį tvirtinimo elementą (25), pritaikytą didesniajam varikliui (6) tvirtinti prie vidinio vamzdžio taip, kad bent dalis didesniojo variklio (6), kurios skersmuo yra didesnis, per visą ilgį tęstųsi už galinio vidinio vamzdžio (24) galo.

2. Sistema pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad vidinis vamzdis (24) ir pirmasis tvirtinimo elementas (25a) yra sukonfigūruoti taip, kad pirmasis tvirtinimo elementas būtų sumontuotas arčiausiai vidinio vamzdžio (24) priešakinio galo.

3. Sistema pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad vidinis vamzdis (24) ir antrasis tvirtinimo elementas (25) yra sukonfigūruoti taip, kad antrasis tvirtinimo elementas būtų sumontuotas arčiausiai galinio vidinio vamzdžio (24) galo.

4. Sistema pagal 3 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad bent vienas iš tvirtinimo elementų (25, 25a) turi apskritą išorinę jungę, kurios išorinis skersmuo yra toks pat, kaip ir vidinio vamzdžio (24) vidinis skersmuo tam, kad tvirtinimo elementas (25, 25a) remtųsi į vidinį vamzdį (24) po sumontavimo jame.

5. Sistema pagal vieną ar daugiau pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad priešakinio vidinio vamzdžio (24) galo skersmuo atitinka tos rotoriaus stebulės (4) dalies, kuri yra arčiausiai priešakinio vidinio vamzdžio (24) galo, skersmenį.

6. Sistema pagal vieną ar daugiau pirmesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad bent kai kurios pavienės briaunos yra sukonfigūruotos kaip kreipiamieji paviršiai (20) ašinio ventiliatoriaus pučiamam orui.

*(51)* Int.Cl. ***F24C 7/00*** (2006.01)
*(11)* **2315976**
*(96)* 09749932.1
*(96)* 2009-05-22
*(97)* 2011-05-04
*(97)* 2016-02-10
*(86)* PCT/EP2009/056254
*(86)* 2009-05-22
*(87)* WO 2009/141442
*(87)* 2009-11-26
*(30)* 0809322, 2008-05-22, GB
*(72)* BETZ, Martin, IE
O`NEILL, Noel, IE
FISCHER, Wolfram, IE
MURRAY, Gareth, IE
*(73)* Basic Holdings, Dublin, IE
*(74)* Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
*(54)* Elektros krosnis, apimanti liepsnos efekto generatorių

Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 6.

*(57)* 1. Elektros krosnis, apimanti krosnies korpusą, apimantį kuro talpyklą ir liepsnos efekto generatorių (100), užtvirtintą krosnies korpuse, jo apatinėje dalyje taip, kad rūko arba kiti garų efektai, kurie išeina iš liepsnos efekto generatoriaus (100), eina aukštyn į krosnies korpusą, kur jie tampa panašūs į liepsnos efektus, liepsnos efekto generatorius apima:

a. rūko generatorių (110), kur rūkas turi būti generuojamas iš skysčio,

b. rūko rezervuarą (120), į kurį turi pereiti generuojamas rūkas, ir turintį išėjimo angą (122), iš kurios rūkas turi, tuomet kai leidžiama, eiti aukštyn į krosnį, kurioje yra patalpintas generatorius, ir

c. skysčio rezervuarą (140) skysčiui tiekti į rūko generatorių, ir b e s i s k i r i a n t i tuo, kad liepsnos efekto generatorius yra numatytas modulinėje konstrukcijoje su kiekvienu iš rūko generatoriaus (110) ir skysčio rezervuaro (140), kurie aiškiai atskiri elementai, kurie turi būti sujungti kartu tam, kad funkciškai apibrėžtų fluido taką atitinkamos skystos arba dujų formos iš skysčio rezervuaro per generatorių ir į rūko rezervuarą; ir skysčio rezervuaras (140) yra numatytas krosnies korpuso priekyje žemiau kuro talpyklos, kur krosnies korpuso dalis yra judri liepsnos efekto generatoriaus atžvilgiu tam, kad sudarytų prieigą į krosnies vidaus dalį tam, kad funkciškai suteiktų prieigą prie skysčio rezervuaro (140) ir jo pašalinimą iš rūko generatoriaus (110).

2. Krosnis pagal 1 punktą dar apima atskirą šliūžę (160) su kuria rūko generatorius kooperuojasi ir jungiasi, šliūžė yra sukonstruota pastoviam pritvirtinimui prie krosnies korpuso taip, kad suteiktų tikslų reguliavimą liepsnos efekto generatoriui (110) elektros krosnies korpuso viduje.

3. Krosnis pagal 1 punktą, kurioje rūko rezervuaras yra atskiras nuo ir sujungtas su rūko generatoriumi.

4. Krosnis pagal 1 punktą, kurioje generatorius (100) montaže suteikia sandarintą mazgą, per kurį generuojamas rūkas, turi tik išeiti per nustatytą išėjimą, numatytą rūko rezervuare.

5. Krosnis pagal bet kurį ankstesnį punktą, kurioje rūko generatorius (110) naudoja skystį, iš kurio generuoja rūką dėl skysčio sumaišymo ultragarsiniu generatoriumi (111).

6. Krosnis pagal bet kurį ankstesnį punktą, kurioje skysčio rezervuaras (140) yra sujungtas su rūko generatoriumi (110) per viršutinio aptaiso montažą, skysčio srauto valdymas iš skysčio rezervuaro į rūko generatorių yra veikiamas naudojant vožtuvo montažą, kuris įgalina vandens srautą tekėti, kai tik rezervuaras patalpinamas ant rūko generatoriaus.

7. Krosnis pagal 6 punktą, kurioje rūko generatorius apima lygio indikatorių arba jungiklį (113), kuris kontroliuoja rūko generatoriaus veikimą tuo metu, kai iš anksto numatytas skysčio tūris yra tiekiamas per rūko generatorių.

8. Krosnis pagal bet kurį ankstesnį punktą, kurioje rūko generatorius apima lygio indikatorių, sujungtą su

išoriškai matomu indikatoriumi, numatytu ant krosnies išorinio paviršiaus, kurioje yra naudojamas liepsnos efekto generatorius taip, kad būtų matoma krosnies naudotojui, kai pranešama, kad skysčio lygis pasiekė lygius, kai skysčio rezervuarą reikia papildyti.

9. Krosnis pagal bet kurį ankstesnį punktą, kurioje rūko generatorius apima du arba daugiau keitiklių (111), suformuotų veikti nepriklausomai.

10. Krosnis pagal bet kurį ankstesnį punktą, kurioje kiekvienas iš elementų, kurie formuoja liepsnos generatorių, yra numatyti moduliniuose bendrai valdomuose elementuose, kurie, kai surinkti, fluidui teikia skysčio ryšį, numatytą skysčio rezervuare per jo išleidimo angą į rūko generatorių, kur turi būti pagamintas rūkas, ir tuomet į rūko rezervuarą arba skirstytuvą, iš kurio jis gali palikti liepsnos generatorių.

11. Krosnis pagal bet kurį ankstesnį punktą apima ventiliatorių (130) arba kitą rūko maišytuvą, kuris numatytas sugeneruoto rūko pagalbiniam paskirstymui už liepsnos generatoriaus.

12. Krosnis pagal bet kurį ankstesnį punktą, kurioje krosnies korpuso dalis yra judri kitos krosnies korpuso dalies atžvilgiu tam, kad suteiktų priėjimą prie krosnies vidinės dalies.

13. Krosnis pagal bet kurį ankstesnį punktą dar apima vieną arba daugiau šviesos šaltinių (230), kurie turi būti nukreipti į išeinantį rūką iš liepsnos efekto generatoriaus taip, kad suteiktų efektus liepsnai, šviesos šaltiniai yra sukonstruoti taip, kad būtų užpakalyje išeinančio iš liepsnos efekto generatoriaus rūko tokiu būdu, kad jie funkcionaliai švytėtų per išeinantį rūką ir link korpuso priekio.

14. Krosnis pagal 13 punktą, kurioje šviesos šaltinio spalvos turi varijuoti naudojant skirtingas spalvotas šviesas, naudojant filtrus arba panašiai, arba naudojant elektroniškai valdomus šviesos šaltinius, kurių galingumas keičiasi keičiantis valdymo signalams.

---

*(51)* Int.Cl. ***G01N 33/53*** (2006.01)
***G01N 33/567*** (2006.01)
***G01N 33/573*** (2006.01)
***A61K 31/435*** (2006.01)
*(11)* **2787345**
*(96)* 14168748.3
*(96)* 2007-05-16
*(97)* 2014-10-08
*(97)* 2016-02-24
*(30)* 801089 P, 2006-05-16, US
853631 P, 2006-10-23, US
*(72)* Lockhart, David, US
Castelli, Jeff, US
*(73)* Amicus Therapeutics, Inc., Cranbury, NJ 08512, US
*(74)* Liudmila GERASIMOVIČ, 9, IĮ „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius, LT
*(54)* Fabri ligos gydymo priemonės
Apibrėžties punktai: 7, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Kompozicija, skirta naudoti Fabri ligos gydymui, kur kompozicija yra peroralinė dozavimo forma, apimanti nešiklį ir 1-deoksigalaktonojirimiciną arba jo druską, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad 1-deoksigalaktonojirimicinas arba jo druska yra skirtini Fabri liga sergančiam pacientui 150 mg kiekiu kas antrą dieną.

2. Kompozicija, skirta naudoti Fabri ligos gydymui pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad 1-deoksigalaktonojirimicinas arba jo druska yra skirtini bent 12 savaičių laikotarpiu.

3. Kompozicija, skirta naudoti Fabri ligos gydymui pagal 1 arba 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad 1-deoksigalaktonojirimicinas apima migalastato hidrochloridą.

4. Kompozicija, skirta naudoti Fabri ligos gydymui pagal bet kurį vieną iš 1-3 punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad peroralinė dozavimo forma apima tabletę, kapsulę arba tirpalą.

5. Kompozicija, skirta naudoti Fabri ligos gydymui pagal bet kurį vieną iš 1-4 punktų, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad 1-deoksigalaktonojirimicinas arba jo druska sustiprina α-galaktozidazės A aktyvumą.

6. 1-deoksigalaktonojirimicinas arba jo druska, skirti naudoti Fabri ligos gydymui, b e s i s k i r i a n t y s tuo, kad 1-deoksigalaktonojirimicinas arba jo druska yra skirtini peroraliai Fabri liga sergančiam pacientui 150 mg kiekiu kas antrą dieną bent 12 savaičių laikotarpiu.

7. 1-deoksigalaktonojirimicinas arba jo druska, skirti naudoti Fabri ligos gydymui pagal 6 punktą, b e s i s k i r i a n t y s tuo, kad 1-deoksigalaktonojirimicino druska apima migalastato hidrochloridą.

---

*(51)* Int.Cl. ***G01N 33/94*** (2006.01)
***C07K 16/16*** (2006.01)
*(11)* **2297585**
*(96)* 09761850.8
*(96)* 2009-06-05
*(97)* 2011-03-23
*(97)* 2016-03-02
*(86)* PCT/FI2009/050481
*(86)* 2009-06-05
*(87)* WO 2009/150295
*(87)* 2009-12-17
*(30)* 20085579, 2008-06-12, FI
*(72)* TAKKINEN, Kristiina, FI
SÖDERLUND, Hans, FI
PULLI, Timo, FI
*(73)* Teknologian tutkimuskeskus VTT Oy, 02150 Espoo, FI
*(74)* Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija „Žabolienė ir partneriai METIDA“, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
*(54)* Narkotinių medžiagų vartojimo nustatymas
Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 0.
*(57)* 1. Antikūno fragmentas, specifiškai atpažįstantis imuninį kompleksą tarp tetrahidrokanabinolio (THC) ir anti-THC, ir apimantis antikūno lengvosios grandinės ir sunkiosios grandinės komplementarumą apsprendžiančias sritis (CDRs), kur minėtos lengvosios grandinės sritys turi SEQ ID Nr. 3 23-35, 51-57 ir 93-100 aminorūgščių aminorūgščių sekas ir minėtos sunkiosios grandinės sritys turi SEQ ID Nr. 4 29-35, 50-60 ir 99-109 aminorūgščių aminorūgščių sekas.

2. Antikūno fragmentas pagal 1 punktą, apimantis SEQ ID Nr. 3 1-111 aminorūgštis, ir SEQ ID Nr. 4 1-120 aminorūgštis.

3. Antikūno fragmentas pagal 2 punktą, kur fragmentas apima amino SEQ ID Nr. 3 ir SEQ ID Nr. 4 aminorūgščių sekas.

4. Tyrimo priemonių rinkinys, apimantis antikūno fragmentą pagal bet kurį iš 1 – 3 punktų, ir kitą antikūno fragmentą, specifiškai prisirišantį prie THC, ir apimantis SEQ ID Nr. 1 ir SEQ ID Nr. 2 aminorūgščių sekas.

5. Tyrimo priemonių rinkinys pagal 4 punktą, apimantis reagentus, skirtus nekonkuruojančiam homogeniniam imuniniam tyrimui.

6. Tyrimo priemonių rinkinys pagal 5 punktą, apimantis reagentus, skirtus nuo laiko priklausančios fluorescencijos rezonansinės energijos perdavimui (TR-FRET).

7. Tyrimo priemonių rinkinys pagal bet kurį iš 4 – 6 punktų, apimantis reagentus, skirtus pakartotinio piktnaudžiavimo narkotikais tyrimui.

8. Antikūno fragmentas pagal bet kurį iš 1 – 3 punktų panaudojimas kartu su antikūno fragmentu, kuris specifiškai prisiriša prie THC, ir kuris apima SEQ ID Nr. 1 ir SEQ ID Nr. 2 aminorūgščių sekas, skirtas THC kūno skysčio mėginyje, paimtame iš asmens, tiriamo dėl narkotikų vartojimo, nustatymui.

9. Imuninis tyrimas, skirtas analitės iš asmens paimtame kūno skysčio mėginyje nustatymui, kur mėginys yra veikiamas reagentų pora, apimančia pirmąjį antikūno fragmentą, kuris specifiškai prisiriša prie analitės, ir antrąjį antikūno fragmentą, kuris specifiškai prisiriša prie analitės ir pirmojo antikūno fragmento komplekso, ir antrojo antikūno fragmento prisirišimo prie minėto komplekso nustatymą, tokiu būdu nustatant analitės buvimą mėginyje, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėta analitė yra THC ir minėtas pirmasis antikūno fragmentas, specifiškai prisirišantis prie THC, apima SEQ ID Nr. 1 ir SEQ ID Nr. 2 aminorūgščių sekas ir minėtas antrasis antikūno fragmentas apima antikūno lengvosios grandinės ir sunkiosios grandinės komplementarumą apsprendžiančias sritis (CDRs), kur minėtos lengvosios grandinės sritys turi SEQ ID Nr. 3 23-35, 51-57 ir 93-100 aminorūgščių aminorūgščių sekas ir minėtos sunkiosios grandinės sritys turi SEQ ID Nr. 4 29-35, 50-60 ir 99-109 aminorūgščių aminorūgščių sekas.

10. Imuninis tyrimas pagal 9 punktą, apimantis nekonkuruojantį homogeninį imuninį tyrimą, geriau TR-FRET, panaudojimą.

11. Imuninis tyrimas pagal bet kurį iš 9 arba 10 punktą, kur analizuojamas mėginys yra parinktas iš grupės, susidedančios iš kraujo, šlapimo ir burnos skysčio.

12. Imuninis tyrimas pagal 9, kur THC yra nustatomas iš seilių.

13. Polinukleotidas, koduojantis antikūno fragmentą pagal bet kurį iš 1 – 3 punktų.

14. Ląstelė šeimininkė, ekspresuojanti antikūno fragmentą pagal bet kurį iš 1 – 3 punktų.

---

*(51)* Int.Cl. ***G02F 1/35*** (2006.01)
***G02B 27/09*** (2006.01)
*(11)* **2194426**
*(96)* 09175373.1
*(96)* 2009-11-09
*(97)* 2010-06-09
*(97)* 2016-03-23
*(30)* 2008089, 2008-11-13, LT
*(72)* Michailovas, Andrejus, LT
Mikalauskas, Saulius, LT
Regelskis, Kestutis, LT
Smilgevicius, Valerijus, LT
*(73)* UAB „Ekspla“, 02300 Vilnius, LT
*(74)* Virgina Adolfina DRAUGELIENĖ, 8, UAB TARPINĖ, A.P.Kavoliuko g. 24-152, LT-04328 Vilnius, LT
*(54)* Lazerinių pluoštų kombinavimo būdas ir įrenginys
Apibrėžties punktai: 15, brėžiniai: 9.
*(57)* 1. Lazerinių pluoštų kombinavimo būdas, apimantis kelių pradinių lazerinių pluoštų nukreipimą į optinę netiesinę terpę, kurioje vyksta pluoštų kombinavimas, gaunant pakeisto bangos ilgio lazerinį pluoštą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad optinė netiesinė terpė yra kvadratinio jautrio medžiaga, kurioje, panaudojant netiesinę sąveiką, pradinius lazerinius pluoštus sumuoja poromis sudedant jų dažnius ir gaunant suminio dažnio pluoštus, kur bent du minėtus suminio dažnio pluoštus, tenkinant fazinio sinchronizmo sąlygą, sukombinuoja į vieną pluoštą toje pačioje kvadratinio jautrio medžiagoje (3).

2. Būdas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtą lazerinių pluoštų sumavimą ir kombinavimą vykdo lygiagrečiai vienoje kvadratinio jautrio medžiagoje (3).

3. Būdas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtą lazerinių pluoštų sumavimą ir kombinavimą vykdo nuosekliai keliais etapais vienos kvadratinio jautrio medžiagos (3) skirtingose vietose, kur į kiekvieną iš minėtų vietų

nukreipia bent vieną naują pradinių lazerinių pluoštų (4', 4'', 4''', ..., $4^n$) porą, kur kiekvienos poros lazeriniai pluoštai persikloja, o jų dažniai sumuojasi gaunant suminio dažnio pluoštus (5', 5'', 5''', ..., $5^n$), atitinkamai, kurie nuosekliai kombinuojami tokiu būdu, kad suminio dažnio pluoštas (5' arba 6'), gautas kvadratinio jautrio medžiagos (3) pirmoje vietoje, yra kombinuojamas su kitu suminio dažnio pluoštu (5''), gautu tolimesnėje kvadratinio jautrio medžiagos (3) vietoje sumuojant kitos poros pradinius lazerinius pluoštus (4''), bei gaunant sukombinuotą pluoštą (6''), kuris kombinuojamas nuosekliai tolimesnėje kvadratinio jautrio medžiagos (3) vietoje su kitu suminio dažnio pluoštu (5'''), gautu iš kitos pradinių lazerinių pluoštų (4''') poros gaunant sukombinuotą pluoštą (6''') ir taip toliau iki tol, kol visi pradiniai lazeriniai pluoštai yra poromis susumuojami, o visi suminio dažnio pluoštai yra sukombinuojami į vieną norimų parametrų pluoštą.

4. Lazerinių pluoštų kombinavimo būdas, apimantis kelių pradinių lazerinių pluoštų nukreipimą į optinę netiesinę terpę, kurioje vyksta pluoštų kombinavimas, gaunant pakeisto bangos ilgio vieną lazerinį pluoštą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad optinę netiesinę terpę sudaro atskirų kvadratinio jautrio medžiagų (3', 3'', ..., $3^n$), išdėstytų ant vienos optinės ašies, seka, kur, panaudojant netiesinę sąveiką, pradinius lazerinius pluoštus (4', 4'', ..., $4^n$) sudedant jų dažnius sumuoja poromis, bent po vieną porą kiekvienoje atskiroje kvadratinio jautrio medžiagoje (3', 3'', ..., $3^n$), taip gaunant suminio dažnio pluoštus (5', 5'', ..., $5^n$), atitinkamai, o gautus suminio dažnio pluoštus (5', 5'', ..., $5^n$), tenkinant fazinio sinchronizmo sąlygą, sukombinuoja į vieną pluoštą ($6^n$) minėtoje kvadratinio jautrio medžiagų (3', 3'', ..., $3^n$) sekoje.

5. Būdas pagal 4 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad į kiekvieną minėtą atskirą kvadratinio jautrio medžiagą (3', 3'', ..., $3^n$) nukreipia vieną pradinių lazerinių pluoštų (4', 4'', 4''', ..., $4^n$) porą, atitinkamai, kur kiekvienos poros pluoštai persikloja, o jų dažniai sumuojasi gaunant suminio dažnio pluoštus (5', 5'', 5''', ..., $5^n$), atitinkamai, kurie nuosekliai yra kombinuojami tokiu būdu, kad suminio dažnio pluoštas (5' arba 6'), gautas pirmoje kvadratinio jautrio medžiagoje (3'), yra sukombinuojamas su kitu suminio dažnio pluoštu (5''), gautu kitoje kvadratinio jautrio medžiagoje (3''), sumuojant kitos poros pradinius lazerinius pluoštus (4'') bei gaunant išėjime sukombinuotą pluoštą (6''), kuris toliau yra nuosekliai kombinuojamas su tolimesniu suminio dažnio pluoštu (5'''), gautu iš kitos pradinių lazerinių pluoštų (4''') poros, gaunant sukombinuotą pluoštą (6''') ir taip toliau iki tol, kol visi pradiniai lazeriniai pluoštai yra poromis susumuojami, o visi suminio dažnio pluoštai yra sukombinuojami į vieną norimų parametrų pluoštą.

6. Būdas pagal 4 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad į kiekvieną minėtą atskirą kvadratinio jautrio medžiagą (3', 3'', ..., $3^n$) nukreipia kelias pradinių lazerinių pluoštų (4', 4''), (4''', 4'''') poras, atitinkamai, kur kiekvienos poros pluoštai persikloja, o jų dažniai sumuojami gaunant atitinkamus suminio dažnio pluoštus (5', 5''), (5''', 5''''), ir tuo pačiu metu pirmoje kvadratinio jautrio medžiagoje (3') gauti suminio dažnio pluoštai (5', 5'') yra sukombinuojami vienas su kitu į vieną kombinuotą pluoštą (6'), kuris nuosekliai kitoje kvadratinio jautrio medžiagoje (3'') yra kombinuojamas su kitais suminio dažnio pluoštais (5''', 5''''), gaunant sukombinuotą pluoštą (6''), ir taip toliau iki tol, kol visi pradiniai lazeriniai pluoštai yra poromis susumuojami, o visi suminio dažnio pluoštai yra sukombinuojami į vieną norimų parametrų pluoštą ($6^n$).

7. Būdas pagal bet kurį iš 3-6 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėti pradiniai lazeriniai pluoštai (4 ... $4^n$), sumuojami poromis į suminio dažnio pluoštus (5 ... $5^n$), kuriuos tuo pačiu metu sukombinuoja į kombinuotus pluoštus (6 ... $6^n$), tarpusavyje yra nekolinearūs, tačiau gali būti kolinearūs su pluoštais (4' ... $4^{n+1}$), sumuojamais nuosekliai kituose etapuose.

8. Būdas pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad į netiesinę kvadratinio jautrio medžiagą (3 ... $3^n$) nukreipia vienodo bangos ilgio tarpusavyje nekoherentinius pradinius lazerinius pluoštus (4 ... $4^n$).

9. Būdas pagal 8 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kvadratinio jautrio medžiagoje (3 ... $3^n$) lazerinių pluoštų (4 ... $4^n$) porų generuojamas suminis dažnis yra antroji harmonika.

10. Būdas pagal bet kurį iš 1-7 punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad į netiesinę kvadratinio jautrio medžiagą (3 ... $3^n$) nukreipti tarpusavyje nekoherentiniai pradiniai lazeriniai pluoštai gali turėti skirtingus bangos ilgius.

11. Būdas pagal 10 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad poroje sumuojamų lazerinių pluoštų (4 ... $4^n$) bangos ilgiai yra vienodi, tačiau skiriasi nuo bangos ilgių lazerinių pluoštų (4' ... $4^{n+1}$), kurie yra nuosekliai sumuojami kitose porose, atitinkamai.

12. Būdas pagal 10 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad poroje sumuojamų lazerinių pluoštų (4 ... $4^n$) bangos

ilgiai yra skirtingi, bet nesiskiria nuo bangos ilgių lazerinių pluoštų (4’ ... $4^{n+1}$), kurie yra nuosekliai sumuojami kitose porose, atitinkamai.

13. Lazerinių pluoštų kombinavimo įrenginys, apimantis kelis lazerius, kurių pluoštai (4) yra nukreipti į optinę netiesinę terpę, skirtą pluoštų kombinavimui vykdyti, išėjime gaunant pakeisto bangos ilgio lazerinį pluoštą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad optinė netiesinė terpė yra kvadratinio jautrio medžiaga (3), kurioje lazeriniai pluoštai (4), panaudojant netiesinę sąveiką, yra sumuojami poromis, sudedant jų dažnius, o suminio dažnio pluoštai (5), mažiausiai du, tenkinant fazinio sinchronizmo sąlygas, yra sukombinuojami į vieną pluoštą (6) toje pačioje kvadratinio jautrio medžiagoje (3).

14. Lazerinių pluoštų kombinavimo įrenginys, apimantis kelis lazerius, kurių pluoštai (4) yra nukreipti į optinę netiesinę terpę, skirtą pluoštų kombinavimui vykdyti, išėjime gaunant pakeisto bangos ilgio lazerinį pluoštą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad optinę netiesinę terpę sudaro atskirų kvadratinio jautrio medžiagų (3’, 3’’, ..., $3^n$), išdėstytų ant vienos optinės ašies, seka, kuriose, lazeriniai pluoštai (4’, 4’’, ..., $4^n$), panaudojant netiesinę sąveiką, poromis sumuojami sudedant jų dažnius, bent po vieną porą kiekvienoje atskiroje kvadratinio jautrio medžiagoje (3’, 3’’, ..., $3^n$), gaunant suminio dažnio pluoštus (5’, 5’’, ..., $5^n$), atitinkamai, o gauti suminio dažnio pluoštai (5’, 5’’, ..., $5^n$), tenkinant fazinio sinchronizmo sąlygą, yra sukombinuojami į vieną pluoštą ($6^n$) minėtoje kvadratinio jautrio medžiagų (3’, 3’’, ..., $3^n$) sekoje.

15. Įrenginys pagal 14 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad optinė netiesinė terpė apima

dvi atskiras kvadratinio jautrio medžiagas (3’, 3’’), kur kiekvienoje iš jų, panaudojant netiesinę sąveiką, yra vykdomas dviejų porų lazerinių pluoštų (4’, 4’’), (4’’’, 4’’’’) sumavimas gaunant atitinkamus suminio dažnio pluoštus (5’, 5’’) ir (5’’’, 5’’’’), kurie minėtose kvadratinio jautrio medžiagose (3’, 3’’) yra sukombinuojami į vieną pluoštą (6’, 6’’), atitinkamai; ir

du pluoštų fazės valdiklius (9, 10), skirtus bent vieno iš lazerinių pluoštų, krentančių į kvadratinio jautrio medžiagas (3’, 3’’), fazei valdyti, kad būtų tenkinama fazinio sinchronizmo sąlyga, reikalinga suminio dažnio pluoštų sukombinavimui į kombinuotus pluoštus (6’, 6’’).

---

*(51)* Int.Cl. ***G03G 15/08*** (2006.01)
*(11)* **2796936**
*(96)* 14168782.2
*(96)* 2006-03-06
*(97)* 2014-10-29
*(97)* 2016-05-18
*(30)* 2005060317, 2005-03-04, JP
2005345485, 2005-11-30, JP
*(72)* Nagashima, Toshiaki, JP
Murakami, Katsuya, JP
Okino, Ayatomo, JP
*(73)* Canon Kabushiki Kaisha, Tokyo 146-8501, JP
*(74)* Otilija KLIMAITIENĖ, 35, AAA Law, J.Jasinskio g. 16A, LT-03163 Vilnius, LT
*(54)* Ryškalo tiekimo konteineris ir ryškalo tiekimo sistema
Apibrėžties punktai: 18, brėžiniai: 34.

*(57)* 1. Ryškalo tiekimo konteineris (1), atjungiamai tvirtinamas prie ryškalo priėmimo įtaiso (10), apimantis varomąjį krumpliaratį (12) ir įstatomas į ryškalo priėmimo įtaisą (10) atliekant įstatymo operaciją, apimančią bent pasukimą įstatymo kryptimi link ryškalo tiekimo padėties, kur ryškalas tiekiamas iš minėto ryškalo tiekimo konteinerio (1) į minėtą ryškalo priėmimo įtaisą (10) ir minėtas ryškalo tiekimo konteineris (1) apima:

konteinerio korpusą (1a) su vidine ertme, pritaikyta ryškalui laikyti;

angą (1b) minėto ryškalo tiekimo konteinerio (1) kraštinėje srityje, kur minėta anga (1b) yra pritaikyta ryškalui, esančiam minėtame konteinerio korpuse (1a), išleisti į ryškalo priėmimo įtaisą (10);

ryškalo padavimo elementą (4), pritaikytą ir įstatytą minėtame konteinerio korpuse (1a) esančiam ryškalui stumti link minėtos angos (1b), elementui sukantis minėto konteinerio korpuso (1a) atžvilgiu, kai minėtas ryškalo konteineris (1) yra nustatytas į ryškalo tiekimo padėtį ir

b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis papildomai apima:

pavaros sistemą (5, 6; 1000), pritaikytą ir įrengtą sukamajai jėgai priimti varomojo krumpliaračio (12), kuris sukasi kryptimi (C), priešinga įstatymo krypčiai (B), sukamajai jėgai perduoti minėtam ryškalo padavimo elementui (4) taip,

kad minėtas ryškalo padavimo elementas (4) būtų sukamas kryptimi (A), priešinga įstatymo krypčiai (B), ir minėto ryškalo padavimo elemento (4) kraštas suktųsi aukštyn šalia minėtos angos (1b), kuri yra nukreipta šonine kryptimi.

2. Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal 1 punktą, kur anga (1b) yra įrengta minėto ryškalo tiekimo konteinerio (1) kraštinėje srityje taip, kad pasukant minėtą ryškalo tiekimo konteinerį (1) įstatymo kryptimi (B), anga (1b) nukreipiama iš viršaus į šoną, ir pavaros sistema (5, 6; 1000) yra pritaikyta bei įrengta sukamajai jėgai priimti nuo varomojo krumpliaračio (12), besisukančio kryptimi (C), priešinga įstatymo krypčiai (B), taip, kad ryškalo tiekimo konteineris (1) išliktų ryškalo tiekimo padėtyje dėl to, kad minėtas ryškalo tiekimo konteineris (1) yra stumiamas įstatymo kryptimi (B).

3. Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal 1 arba 2 punktą, papildomai apimantis

reguliuojamąją sritį (10, 100), pritaikytą bei įrengtą minėto ryškalo tiekimo konteinerio (1) įstatymo į ryškalo priėmimo įtaisą (10) padėčiai reguliuoti taip, kad minėta anga (1b) būtų nukreipta aukštyn, ir

stabdomąją dalį (1e), pritaikytą bei įrengtą minėto konteinerio korpuso (1a) sukimuisi įstatymo kryptimi (B) stabdyti, kai minėtas konteinerio korpusas (1a) yra pasukamas į ryškalo tiekimo padėtį bei minėta anga (1b) nukreipiama į šoną, kur

pavaros sistema (5, 6; 1000) yra pritaikyta bei įrengta sukamajai jėgai priimti nuo varomojo krumpliaračio (12), besisukančio kryptimi (C), priešinga įstatymo krypčiai (B) taip, kad konteinerio korpusas (1a), įstatytas į ryškalo tiekimo padėtį, būtų stumiamas įstatymo kryptimi (B).

4. Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 3, kur minėta pavaros sistema (5, 6; 1000) apima varomosios jėgos priėmimo įtaisą (6), sukimbantį su varomuoju krumpliaračiu (12) sukamajai jėgai priimti, besisukantį aplink ašį, nutolusią nuo minėto ryškalo konteinerio (1) sukimosi atliekant įstatymo operaciją ašies, ir varomosios jėgos perdavimo įtaisą (5), kuris perduoda sukamąją jėgą tarp minėto varomosios jėgos priėmimo įtaiso (6) ir minėto ryškalo padavimo elemento (4), kuris sukasi aplink bendrą ašį su minėtu ryškalo padavimo elementu (4).

5. Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal 4 punktą, kur minėto varomosios jėgos perdavimo įtaiso (5) sukimosi centras yra iš esmės sulygiuotas su minėto ryškalo tiekimo konteinerio (1) sukimosi centru.

6. Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal 4 arba 5 punktą, kur minėtas varomosios jėgos priėmimo įtaisas (6) apima krumpliaratį (6), sukimbantį su varomuoju krumpliaračiu (12) sukamajai jėgai priimti, o minėtas varomosios jėgos perdavimo įtaisas (5) apima krumpliaratį (5) sukamajai jėgai perduoti.

7. Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal bet kurį iš punktų nuo 4 iki 6, kur minėtas varomosios jėgos priėmimo įtaisas (6) apima laiptuotąjį krumpliaratį (6, 6'), sukimbantį su varomuoju krumpliaračiu (12) sukamajai jėgai priimti, o minėtas varomosios jėgos perdavimo įtaisas (5) apima krumpliaratį (5), sukimbantį su minėtu laiptuotuoju krumpliaračiu (6, 6') sukamajai jėgai perduoti.

8. Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal 4 punktą, kur minėtas varomosios jėgos priėmimo įtaisas (6) apima frikcinį krumpliaratį (6), sukimbantį su varomuoju krumpliaračiu (12) sukamajai jėgai priimti, o minėtas varomosios jėgos perdavimo įtaisas (5) apima frikcinį krumpliaratį (5) sukamajai jėgai perduoti.

9. Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal bet kurį iš punktų nuo 4 iki 8, papildomai apimantis apkraunamąją sritį (61, 62, 73, 74), pritaikytą bei įrengtą minėtam varomosios jėgos priėmimo įtaisui (6) apkrauti taip, kad minėtas ryškalo tiekimo konteineris (1) pasisuktų į ryškalo tiekimo padėtį įstatymo kryptimi (B), veikiamas sukamosios jėgos, kurią perduoda minėtas varomosios jėgos perdavimo įtaisas (6).

10. Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal 9 punktą, kur minėta apkraunamoji sritis (61, 62, 73, 74) apkrauna minėtą varomosios jėgos priėmimo įtaisą (4) per minėtą varomosios jėgos perdavimo įtaisą (5).

11. Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 3, kur minėta pavaros sistema apima perdavimo juostą (1000), sukimbančią su varomuoju krumpliaračiu (12) sukamajai jėgai priimti ir daugybę atraminių elementų (1100, 1200), ant kurių yra užkabinta minėta juosta (1000).

12. Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal 3 punktą, kur minėta reguliuojamoji sritis (1g, 100) reguliuoja minėto ryškalo tiekimo konteinerio (1) įstatymo padėtį taip, kad minėta anga (1b) būtų nukreipta +/- 30 laipsnių kampu vertikaliosios krypties atžvilgiu.

13. Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal 3 punktą, kur minėta reguliuojamoji sritis (1g, 100) reguliuoja minėto ryškalo tiekimo konteinerio (1) įstatymo padėtį taip, kad minėta pavaros sistema (5, 6; 1000) nesukibtų su varomuoju krumpliaračiu (12).

14. Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal 3 punktą, kur minėta reguliuojamoji sritis (1g, 100) atlieka įstatymo kreipiamosios, pritaikytos minėtam ryškalo tiekimo konteineriui (1) nukreipti į ryškalo priėmimo įtaisą (10) taip, kad minėtas ryškalo tiekimo konteineris (1) būtų įstatomas iš esmės minėto ryškalo tiekimo konteinerio (1) ašine kryptimi, funkciją.

15. Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal 1 arba 2 punktą, kur ryškalo priėmimo įtaisas (10) papildomai apima ryškalo priėmimo angą ir sklendę (11), pritaikytą ir įrengtą ryškalo priėmimo angai atidaryti bei uždaryti, ir

kur minėtas ryškalo tiekimo konteineris (1) papildomai apima susiejamąją sritį (1e), sukimbančią su sklende (11) ir pritaikytą bei įrengtą minėto ryškalo tiekimo konteinerio (1) sukamajam judesiui link ryškalo tiekimo padėties, atliekant įstatymo operaciją, susieti su sklendės (11) atidaromuoju judesiu.

16. Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal 15 punktą, kur minėta susiejamoji sritis (1e) atlieka stabdomosios srities, pritaikytos minėto ryškalo tiekimo konteinerio (1) sukimuisi įstatymo kryptimi (B) sustabdyti, kai minėtas ryškalo tiekimo konteineris (1) yra pasukamas į ryškalo tiekimo padėtį, funkciją.

17.Ryškalo tiekimo konteineris (1) pagal 1 punktą, kur minėtas ryškalo tiekimo konteineris (1) papildomai apima:

iškyšą ant minėto konteinerio korpuso (1a), pritaikytą bei įrengtą minėto ryškalo tiekimo konteinerio (1) įstatymo į ryškalo priėmimo įtaisą (10) padėčiai reguliuoti taip, kad minėta anga (1b) būtų nukreipta aukštyn;

stabdiklį (1e), pritaikytą bei įrengtą minėto konteinerio korpuso (1a) sukimuisi įstatymo kryptimi (B) stabdyti, kai minėtas konteinerio korpusas (1a) yra pasukamas į ryškalo tiekimo padėtį ir minėta anga (1b) nukreipiama į šoną; kur

ryškalo padavimo elementas (4) yra ryškalo padavimo mentė (4), pritaikyta bei įrengta ryškalui paduoti minėtame konteinerio korpuse (1a) link minėtos angos (1b), mentei sukantis konteinerio korpuso atžvilgiu (1a), kai minėtas konteinerio korpusas (1a) yra įstatytas į ryškalo tiekimo padėtį; ir

pavaros sistema (5, 6; 1000) apima varomosios jėgos priėmimo krumpliaratį (6), sukimbantį su varomuoju krumpliaračiu (12) bei pritaikytą ir įrengtą sukamajai jėgai priimti nuo varomojo skriemulio (12), kuris sukasi kryptimi (C), priešinga minėto konteinerio korpuso (1a) įstatymo krypčiai (B) taip, kad minėtas konteinerio korpusas (1a), įstatytas ryškalo tiekimo padėtyje, būtų spaudžiamas įstatymo kryptimi (C), ir varomosios jėgos perdavimo krumpliaratį (5), pritaikytą bei įrengtą sukamajai jėgai perduoti minėtai ryškalo padavimo mentei (4) taip, kad minėta ryškalo padavimo mentė (4) suktųsi kryptimi (A), priešinga įstatymo krypčiai (B) ir minėtos ryškalo padavimo mentės (4) kraštas judėtų aukštyn šalia minėtos angos (1b), kuri yra nukreipta į šoną.

18. Ryškalo tiekimo sistema ryškalui tiekti iš ryškalo tiekimo konteinerio (1) į ryškalo priėmimo įtaisą (10), kur minėtas ryškalo tiekimo konteineris (1) yra įstatomas į minėtą ryškalo priėmimo įtaisą (10), atliekant įstatymo operaciją, apimančią bent pasukimą link ryškalo tiekimo padėties, ir kur ryškalas yra tiekiamas iš minėto ryškalo tiekimo konteinerio (1) į minėtą ryškalo priėmimo įtaisą (10) įstatymo padėtyje (B), sudaryta iš:

minėto ryškalo priėmimo įtaiso (10), apimančio:

įstatymo sritį, pritaikytą bei įrengtą minėtam ryškalo tiekimo konteineriui (1) atjungiamai įstatyti, kur minėta įstatymo sritis teikia galimybę pasukti minėtą ryškalo tiekimo konteinerį (1) įstatymo kryptimi (B), ir

varomojo krumpliaračio (12), kuris sukasi kryptimi (C), priešinga įstatymo krypčiai (B), sukamajai jėgai perduoti bei minėto ryškalo tiekimo konteinerio (1) pagal bet kurį iš punktų nuo 1 iki 17.

---

*(51)* Int.Cl. ***H01C 7/12*** (2006.01)
***H01T 1/14*** (2006.01)
***H01H 83/10*** (2006.01)

*(11)* **2725588**

*(96)* 12468006.7

*(96)* 2012-12-30

*(97)* 2014-04-30

*(97)* 2016-03-02

*(30)* 201200318, 2012-10-24, SI

*(72)* Boskovic Nejc, SI

*(73)* Razvojni Center eNem Novi Materiali d.o.o., 1410 Zagorje ob Savi, SI

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

*(54)* Apsaugantis nuo viršįtampio modulis

Apibrėžties punktai: 3, brėžiniai: 2.

*(57)* 1. Apsaugantis nuo viršįtampio modulis, turintis korpusą (1) su srieginiu maitinimo kontaktu (1a), b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad varistorius (2) įkaista viršįtampio atveju ir sukelia besilydančios medžiagos įšilimą stūmoklyje (3), kuris atpalaiduoja prieš tai suspaustą spyruoklę (5), kuri stumia plokštelę (4) prieš korpuso (1) sienelę, taip sudarant trumpą sujungimą tarp maitinimo kontaktų (1a ir 8a); kad korpuso (1) apačia yra padaryta su varistoriumi (2), virš kurio yra stūmoklis (3) su išgręžtomis skylėmis (3a ir 3b) ant dviejų lygiagrečių šonų, tarp kurių yra įtaisyta perstumiama šoninė sienelė, turinti plokštelės (4) formą; kad perstumiama šoninė sienelė (4) yra padaryta su išgręžtomis skylėmis (4a ir 4b) jos viršutinėje briaunoje ir su dviem angomis (4c) jos šoninėse briaunose; kad plokštelės (4) vidinė pusė yra padaryta su laikikliu spyruoklės (5), suspaudžiamos tokiu būdu, kad išorės dalis plokštelės (4) yra viename lygyje su išorinėmis stūmoklio (3) briaunomis; kad besilydanti medžiaga yra įpilta arba įterpta į minėtas išgręžtas skyles (3a ir 3b) ir lygiagrečias išgręžtas skyles (4a ir 4b); kad plokštė, ant kurios yra pritvirtinta lanksti viela (6), yra pritvirtinta įveržiant varžtus (7a ir 7b) į išgręžtas skyles (4a ir 4b); kad stūmoklis (3) yra uždengtas stūmokliu (8), turinčiu cilindrinį pirštą (8a), kuris tuo pačiu metu veikia kaip antrasis kontakto pirštas; kad stūmoklio (8) cilindrinis pirštas (8a) yra numatytas su stačiakampiu izoliaciniu kūnu (9) su viena išpjauta sienele, kas leidžia plokštelei (4) kontaktuoti su korpuso (1) sienele viršįtampio varistoriuje (2) atveju; kad kūnas (9) kartu su varistoriumi (2), stūmokliu (3) su plokštele (4), viela (6) ant plokštės (7) ir stūmokliu (8) yra stumiami link korpuso (1) apačios spyruokle (10), kuri yra suspausta dangteliu (11) su apvalia skyle (11 a) pirštui (8a).

2. Apsaugantis nuo viršįtampio modulis pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad stūmoklis (3) yra padarytas su keliomis išgręžtomis skylėmis ant dviejų lygiagrečių šoninių sienelių ir su viena ar keliomis išgręžtomis skylėmis stūmoklio (3) apatinėje sekcijoje; kad perstumiama šoninė sienelė (4) ant viršutinės briaunos yra padaryta su dviem ar keliomis išgręžtomis skylėmis ir su dviem ar keliomis skylėmis ant šoninių briaunų ir / arba su skyle apatinėje pusėje.

3. Apsaugantis nuo viršįtampio modulis pagal 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis yra numatytas korpuso (1) viduje su varistoriumi (2), virš kurio yra įtaisytas stūmoklis (31) su perstumiama plokštele (41); kad cilindrinis pirštas (41a), padarytas su spyruokle (51), yra įtaisytas statmenai plokštelei (41); kad plokštelė (41) su spyruokle (51) yra įtaisyta stūmoklio (31) sienelėje (31a) ir užfiksuota su lydžia medžiaga (12).

---

*(51)* Int.Cl. ***H02G 15/18*** (2006.01)
***H01R 13/518*** (2006.01)
***H01R 13/52*** (2006.01)
***H01R 43/00*** (2006.01)
***H01R 4/70*** (2006.01)

*(11)* **2759032**

*(96)* 12832957.0

*(96)* 2012-09-21

*(97)* 2014-07-30

*(97)* 2016-04-06

*(86)* PCT/FI2012/050914

*(86)* 2012-09-21

*(87)* WO 2013/041776

*(87)* 2013-03-28

*(30)* 20115933, 2011-09-22, FI

*(72)* AARNIO, Anssi, FI
BÄRLUND, Stefan, FI
EKHOLM, Patrick, FI
SALONEN, Mikko, FI
VANHALAKKA, Juha, FI
LEHTIKANGAS, Perttu, FI
PULKKINEN, Petteri, FI
VILENIUS, Veijo, FI
ALKILA, Kauko, FI

*(73)* Ensto Oy, 06150 Porvoo, FI

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

*(54)* Elementas vidutinės įtampos elektros oro linijos laidams sudurti

Apibrėžties punktai: 14, brėžiniai: 3.

*(57)* 1. Konstrukcinis elementas vidutinės įtampos dengtiesiems kabeliams (100) su izoliatoriais (104) sudurti, sudarytas iš metalinės suduriamosios dalies (114), kurios viduje suduriami kabeliai (100) gali būti užfiksuojami ties galais (122, 124), ir formuojamųjų įdėklų (118), einančių nuo suduriamosios dalies galų kabelių galams (100) uždengti, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad konstrukcinis elementas apima kaitinant susitraukiančius vamzdelius (116), kurie susitraukę uždengia gana didelį suduriamosios dalies (114) plotą, ir šaldant susitraukiančius vamzdelius (120) suduriamosios dalies (114) galams uždengti bei įdėklus (118), kur šaldant susitraukiantys vamzdeliai yra sutraukiami ant dalies kaitinant sutraukiamų vamzdelių ir visiškai uždengia įdėklus (118) bei iš dalies uždengia kabelio izoliatorių (104).

2. Konstrukcinis elementas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad konstrukcinis elementas apima kaitinant susitraukiančius vamzdelius (116), kurie susitraukę uždengia gana didelį suduriamosios dalies (114) plotą, uždėtus, t. y. sutrauktus, ant suduriamosios dalies prieš atliekant pačius vidutinės įtampos linijos laidų sudūrimo darbus.

3. Konstrukcinis elementas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad konstrukcinis elementas apima juostą (126) tarp įdėklo (118) ir šaldant susitraukiančių vamzdelių (120).

4. Konstrukcinis elementas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad konstrukcinis elementas apima atraminę konstrukciją (132) tarp šaldant susitraukiančių vamzdelių (120) ir įdėklo (118) šaldant susitraukiantiems vamzdeliams sudėti į vietą.

5. Konstrukcinis elementas pagal 4 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad atraminė konstrukcija (132) yra išsivyniojanti atraminė spiralė (132), sudaryta iš juostelės (134) atraminei spiralei išvynioti, ištraukiant juostelę iš atraminės spiralės po to, kai šaldant susitraukiantys vamzdeliai (120) uždedami į vietą juos sutraukiant.

6. Konstrukcinis elementas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad susitraukiančių vamzdelių (116, 120) sienelių storis yra nuo 2 mm iki 5 mm.

7. Konstrukcinis elementas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kabeliai (100) yra oro linijos kabeliai.

8. Būdas vidutinės įtampos linijos kabeliams (100), sudurti, pagal kurį suduriami vidutinės įtampos linijos kabeliai yra izoliuoti kabelių izoliatoriais (104), ir suduriami kabeliai yra užfiksuojami galais metalinės suduriamosios dalies (114) viduje ir kabelių (100) yra uždengiami formuojamaisiais įdėklais (118), einančiais nuo suduriamosios dalies (114) galų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad suduriamoji dalis (114) yra uždengta sutraukiant kaitinant susitraukiančius vamzdelius (116) ir suduriamosios dalies (114) bei įdėklų (118) galai yra uždengiami šaldant susitraukiančiais vamzdeliais taip, kad šaldant susitraukiantys vamzdeliai sutraukiant yra iš dalies uždedami ant kaitinant susitraukiančių vamzdelių (116), visiškai – ant įdėklų (118) ir iš dalies – ant kabelio izoliatoriaus (104).

9. Būdas pagal 8 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad suduriamoji dalis (114) yra uždengta kaitinant susitraukiančiais vamzdeliais (116), kurie uždedami, t. y. sutraukiami, ant suduriamosios dalies, prieš atliekant pačius vidutinės įtampos linijos laidų sudūrimo darbus.

10. Būdas pagal 8 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad tarp įdėklo (118) ir šaldant susitraukiančių vamzdelių (120) yra juosta.

11. Būdas pagal 8 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad šaldant susitraukiantys vamzdeliai (120) yra uždedami į vietą, naudojant atraminę konstrukciją (132) tarp šaldant susitraukiančių vamzdelių (120) ir įdėklo (118).

12. Būdas pagal 11 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad šaldant susitraukiantys vamzdeliai (120) yra uždedami į vietą, naudojant atramos funkciją atliekančią išsivyniojančią atraminę spiralę (132), kuri išvyniojama, ištraukiant juostelę (134) iš atraminės spiralės po to, kai šaldant susitraukiantys vamzdeliai (120) uždedami į vietą juos sutraukiant.

13. Būdas pagal 8 punktą, b e s i s k i r i a n t i s t uo, kad susitraukiančių vamzdelių (116, 120) sienelių storis yra nuo 2 mm iki 5 mm.

14. Būdas pagal 8 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kabeliai (100) yra oro linijos kabeliai.

*(51)* Int.Cl. ***H04L 27/26*** (2006.01)
*(11)* **2132912**
*(96)* 08709883.6
*(96)* 2008-02-21
*(97)* 2009-12-16
*(97)* 2016-04-06
*(86)* PCT/IB2008/000514
*(86)* 2008-02-21
*(87)* WO 2008/110886
*(87)* 2008-09-18
*(30)* 686636, 2007-03-15, US
840628, 2007-08-17, US
*(72)* AURANEN, Tommi, FI
PEKONEN, Harri, J., FI
VESMA, Jussi, FI
TALMOLA, Pekka, FI
HENRIKSSON, Jukka, FI
KOIVUNEN, Visa, FI
VARE, Jani, FI
*(73)* Nokia Technologies Oy, 02610 Espoo, FI
*(74)* Liudmila GERASIMOVIČ, 9, Ių „Liudmila Gerasimovič, Patentinis patikėtinis“, Vingrių g. 13-42, LT-01141 Vilnius, LT
*(54)* Skaitmeninės transliacijos paslaugų aptikimo koreliacija
Apibrėžties punktai: 12, brėžiniai: 1.
*(57)* 1. Būdas, apimantis:
skaitmeninės transliacijos imtuvo (112) dažnių sintezatoriaus programavimą pagal transliacijos kanalo nominalų centrinį dažnį;
pirmojo bandomojo simbolio priėmimą užprogramuotu dažniu, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad būde papildomai:
nustato pirmojo bandomojo simbolio dažnių domene koreliaciją su vienu arba keliais bandomaisiais simboliais, saugomais imtuve (112), siekiant nustatyti dažnių poslinkį, kur pirmojo bandomojo simbolio dažnių juostos plotis yra siauresnis, nei transliacijos kanalo duomenų simbolių juostos plotis;
jei dažnių domene koreliaciją nustato, tai
naudojant dažnio poslinkį perprogramuoja imtuvo (112) dažnių sintezatorių; ir
bent antrąjį bandomąjį simbolį demoduliuoja, siekiant nustatyti transliacijos kanalo duomenų simbolių moduliavimo parametrus; ir
jei dažnių domene koreliacijos nėra, tai
nustato, kad šis transliacijos kanalas nėra norimo tipo kanalas, ir tęsia paslaugų/kanalo aptikimo procedūrą su sekančiu transliacijos kanalu.

2. Būdas pagal 1 punktą, kur pirmas ir antras bandomieji simboliai yra kadro pirmasis ir antrasis simboliai.

3. Būdas pagal 1 punktą, kur bent gauto pirmojo bandomojo simbolio centrinis dažnis yra iš esmės toks pat, kaip ir transliacijos kanalo duomenų simbolių dažnis.

4. Kompiuterinė programa, apimanti:
kodą, skirtą skaitmeninės transliacijos imtuvo (112) dažnių sintezatoriaus programavimui pagal transliacijos kanalo nominalų centrinį dažnį;
kodą, skirtą pirmojo bandomojo simbolio priėmimui užprogramuotu dažniu, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kompiuterinė programa papildomai apima:
kodą, skirtą pirmojo bandomojo simbolio dažnių domene koreliacijai su vienu arba keliais bandomaisiais simboliais, saugomais imtuve (112), siekiant nustatyti dažnių poslinkį, kur pirmo bandomojo simbolio dažnių juostos plotis yra siauresnis, nei transliacijos kanalo duomenų simbolių juostos plotis;
jei dažnių domene koreliaciją nustato, tai
naudojant dažnio poslinkį perprogramuoja imtuvo (112) dažnių sintezatorių; ir
bent antrąjį bandomąjį simbolį demoduliuoja, siekiant nustatyti transliacijos kanalo duomenų simbolių moduliavimo parametrus; ir

jei dažnių domene koreliacijos nėra, tai

nustato, kad šis transliacijos kanalas nėra norimo tipo kanalas, ir tęsia paslaugų/kanalo aptikimo procedūrą su sekančiu transliacijos kanalu;

kai kompiuterinė programa yra paleista procesoriuje.

5. Kompiuterinė programa pagal 4 punktą, kur bent antrasis bandomasis simbolis neša signalinę informaciją.

6. Kompiuterinė programa pagal 5 punktą, papildomai apimanti kompiuteriu skaitomas instrukcijas signalinės informacijos atvaizdavimui su tinklo informacija, siekiant nustatyti paslaugas, susijusias su transliacijos kanalu.

7. Būdas, kuriame:

sudaro simbolių seką, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad

simbolių seka apima bent du bandomuosius simbolius, kur pirmasis bandomasis simbolis iš bent dviejų bandomųjų simbolių yra konfigūruotas, kad perteiktų apytikrį dažnį ir sinchronizuotų informaciją pagal laiką, ir antrasis bandomasis simbolis iš bent dviejų bandomųjų simbolių yra konfigūruotas, kad neštų daugybės duomenų simbolių moduliacijos parametrus; ir

simbolių sekos pirmąjį bandomąjį simbolį perduoda transliacijos kanalu su bandomojo signalo dažnių juostos pločiu, kuris yra siauresnis, nei duomenų simbolių juostos plotis, kuris yra siauresnis, nei transliacijos kanalo dažnio tinklelio juostos plotis.

8. Būdas pagal 7 punktą, kur centrinis dažnis, naudojamas bandomųjų simbolių perdavimui, yra iš esmės toks pat, kaip ir dažnis, naudojamas duomenų simbolių perdavimui.

9. Būdas pagal 8 punktą, kur bent vienas iš dviejų bandomųjų simbolių yra papildomai konfigūruotas, kad perteiktų signalinę informaciją.

10. Būdas pagal 9 punktą, kur signalinė informacija atitinka tinklo informaciją, kur paslaugos, susijusios su transliacijos kanalu, gali būti nustatytos atvaizduojant signalinę informaciją su tinklo informacija.

11. Įrenginys, apimantis:

imtuvą (112), turintį kompiuterinės programos kodą, įgalinantį imtuvą vykdyti operacijas, apimančias:

skaitmeninio transliacijos imtuvo (112) dažnio sintezatoriaus programavimą pagal transliacijos kanalo nominalų centrinį dažnį;

b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad kompiuterinė programa įgalina imtuvą (112) atlikti:

pirmojo bandomojo simbolio priėmimą užprogramuotu dažniu;

pirmojo bandomojo simbolio dažnių domene koreliaciją su vienu arba keliais bandomaisiais simboliais, saugomais imtuve (112), siekiant nustatyti dažnių poslinkį, kur pirmojo bandomojo simbolio dažnių juostos plotis yra mažesnis, nei transliacijos kanalo duomenų simbolių juostos plotis;

jei dažnių domene nustato koreliaciją, tai

naudojant dažnio poslinkį perprogramuoja imtuvo (112) dažnių sintezatorių; ir

bent antrąjį bandomąjį simbolį demoduliuoja, siekiant nustatyti transliacijos kanalo duomenų simbolių moduliavimo parametrus; ir

jei dažnių domene koreliacijos nėra, tai

nustato, kad šis transliacijos kanalas nėra norimo tipo kanalas, ir tęsia paslaugų/kanalo aptikimo procedūrą su sekančiu transliacijos kanalu.

12. Įrenginys, apimantis:

siųstuvą (103), konfigūruotą, kad sudarytų simbolių seką, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad:

simbolių seka apima bent du bandomuosius simbolius, kur pirmasis bandomasis simbolis iš bent dviejų bandomųjų simbolių yra konfigūruotas, kad perteiktų apytikrį dažnį ir sinchronizuotų informaciją pagal laiką, ir antrasis bandomasis simbolis iš bent dviejų bandomųjų simbolių yra konfigūruotas, kad neštų daugybės duomenų simbolių moduliacijos parametrus; ir

simbolių sekos pirmąjį bandomąjį simbolį perduoda transliacijos kanalu su bandomojo signalo dažnių juostos pločiu, kuris yra siauresnis, nei duomenų simbolių juostos plotis, kuris yra siauresnis, nei transliacijos kanalo dažnių tinklelio juostos plotis.

*(51)* Int.Cl. ***H04N 19/176*** (2014.01)
***H04N 19/593*** (2014.01)
***H04N 19/105*** (2014.01)
***H04N 19/11*** (2014.01)
***H04N 19/186*** (2014.01)
***H04N 19/96*** (2014.01)
***H04N 19/122*** (2014.01)

*(11)* **2545713**

*(96)* 11766126.4

*(96)* 2011-04-05

*(97)* 2013-01-16

*(97)* 2016-05-18

*(86)* PCT/KR2011/002375

*(86)* 2011-04-05

*(87)* WO 2011/126275

*(87)* 2011-10-13

*(30)* 20100031145, 2010-04-05, KR

*(72)* MIN, Jung-Hye, KR
ALSHINA, Elena, KR
HAN, Woo-Jin, KR

*(73)* Samsung Electronics Co., Ltd, Gyeonggi-do 443-742, KR

*(74)* Marija LENKUTIENĖ, 6, Patentinių paslaugų centras, UAB, J. Basanavičiaus g. 11/1, LT-03108 Vilnius, LT

*(54)* Vaizdo kodavimo vieneto ir vaizdo dekodavimo vieneto vidinės prognozavimo būsenos nustatymas

Apibrėžties punktai: 2, brėžiniai: 28.

*(57)* 1. Vaizdo dekodavimo būdas, apimantis:

duoto vaizdo padalijimą į daugybę maksimalių kodavimo vienetų, kur kiekvienas kodavimo vienetas turi maksimalų dydį pagal kodavimo vieneto maksimalaus dydžio informaciją, kur maksimalus kodavimo vienetas padalijamas į daugybę kodavimo vienetų, naudojant ryškumo informaciją, kuri žymi kiek kartų maksimalus kodavimo vienetas yra padalijamas į kodavimo vienetą erdviškai;

esamo pavyzdžio maksimalaus kodavimo vieneto skaisčio komponento ir spalvinio komponento maksimalaus kodavimo vieneto padalijimą į vieną arba daugiau skaisčio komponento kodavimo vienetų ir į vieną arba daugiau spalvinio komponento kodavimo vienetų, atitinkamai pagal padalijimo informaciją;

atrenka pirmą vidinės prognozavimo būsenos informaciją, kuri rodo vidinę prognozavimo būseną, pritaikytą skaisčio komponento prognozavimo vienetui, įskaitant skaisčio komponento kodavimo vienetą;

atrenka antrą vidinės prognozavimo būsenos informaciją, kuri rodo vidinę prognozavimo būseną, pritaikytą spalvinio komponento prognozavimo vienetui, atitinkantį skaisčio komponento prognozavimo vienetą; ir

atlieka skaisčio komponento prognozavimo vieneto vidinį prognozavimą, remiantis pirma vidinės prognozavimo būsenos informacija apie skaisčio komponento prognozavimo vienetą ir atlieka spalvinio komponento prognozavimo vieneto vidinį prognozavimą, remiantis antra vidinės prognozavimo būsenos informacija,

kur vidinė prognozavimo būsena nurodo konkrečią kryptį iš daugybės krypčių, ir ši konkreti kryptis nurodoma vienu iš dx skaitmeniu horizontalia kryptimi ir fiksuotu skaitmeniu vertikalia kryptimi, ir dy skaitmeniu vertikalia kryptimi ir fiksuotu skaitmeniu horizontalia kryptimi, kur dx skaitmuo ir dy skaitmuo yra viena iš reikšmių, pasirinkta tarp {32, 26, 21, 17, 13, 9, 5, 2,0, -2, -5, -9, -13, -17, -21, 26}, atsižvelgiant į konkrečią kryptį, ir

kur, kai antros vidinio prognozavimo būsenos informacija nurodo, kad spalvinio

komponento prognozavimo vieneto vidinio prognozavimo būsena yra lygi skaisčio komponento prognozavimo vieneto vidinio prognozavimo būsenai, tada spalvinio komponento prognozavimo vieneto vidinė prognozavimo būsena nustatoma lygi skaisčio komponento prognozavimo vieneto vidinio prognozavimo būsenai

2. Būdas pagal apibrėžties 1 punktą, kur esamo ryškumo kodavimo vienetas yra vienas iš stačiakampio duomenų vienetų padalintas iš kodavimo vieneto aukščiausio ryškumo, ir

esamo ryškumo kodavimo vienetas yra padalintas į žemiausio ryškumo kodavimo vienetus nepriklausomai nuo kaimyninių kodavimo vienetų.

*(51)* Int.Cl. ***H05B 41/30*** (2006.01)
*(11)* **2605623**
*(96)* 12197321.8
*(96)* 2012-12-14
*(97)* 2013-06-19
*(97)* 2016-03-23
*(30)* 2011103, 2011-12-16, LT
*(72)* Grigoraitis, Vytautas, LT
Michailovas, Andrejus, LT
Jakubauskas, Darius, LT
*(73)* UAB „Ekspla“, 02300 Vilnius, LT
Vytauto Grigoraicio imone „Minties Kvantas“, 10238 Vilnius, LT
*(74)* Virgina Adolfina DRAUGELIENĖ, 8, UAB TARPINĖ, A.P.Kavoliuko g. 24-152, LT-04328 Vilnius, LT
*(54)* Impulsinės lempos maitinimo srovės valdymo būdas

Apibrėžties punktai: 9, brėžiniai: 10.

*(57)* 1. Impulsinės lempos maitinimo srovės valdymo būdas, kai į impulsinę lempą (1) tiekia pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsus, minėtoje lempoje sukeliančius stiprų dujų išlydį, kur pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsai yra paleidžiami sinchroimpulsais; būdas, apima šiuos etapus:

- tarpuose tarp minėtų pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsų į impulsinę lempą (1) tiekia budinčiojo lanko srovę, kurios stiprio kitimas laike yra laiptelio pavidalo,
- kiekvieno laiko intervalo tarp gretimų pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsų pradžioje tiekia pirmojo srovės stiprio lygio ($I_0$) budinčiojo lanko srovę, kuri užtikrina nenutrūkstamą srovės tekėjimą tarp lempos (1) elektrodų,
- prieš paleidžiant pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsą, budinčiojo lanko srovę pirmuoju sinchroimpulsu (6) perjungia į antrąjį srovės stiprio lygį ($I_1$), kuris yra aukštesnis už pirmąjį srovės stiprio lygį ($I_0$),
- antruoju sinchroimpulsu (7), kuris yra suvėlintas per laiko intervalą ($t_1$) minėto pirmojo sinchroimpulso (6) atžvilgiu, paleidžia pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsą,

kur minėti pirmasis srovės stiprio lygis ($I_0$), antrasis srovės stiprio lygis ($I_1$) ir laiko intervalas ($t_1$) priklauso nuo impulsinės dujų išlydžio lempos parametrų,

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

pirmasis ir antrasis budinčiojo lanko srovės stiprio lygiai ($I_0$ ir $I_1$) ir minėtas laiko intervalas ($t_1$) yra iš anksto numatyti tenkinant šias sąlygas:

- pirmasis srovės stiprio lygis ($I_0$) yra kiek galima žemesnis, tačiau galintis užtikrinti, kad lempoje dujų išlydis neužgestų ir srovė, tekanti per lempos (1) elektrodus, palaikytų jonizacijos kanalą,
- antrasis srovės stiprio lygis ($I_1$) yra kiek galima žemesnis, tačiau pakankamas, kad užtikrintų tolygų visos minėtos impulsinės lempos (1) kolbos užpildymą plazma,
- laiko intervalas ($t_1$) yra galimai trumpiausias laiko intervalas, per kurį lempos (1) kolba visiškai ir tolygiai užsipildo plazma.

2. Impulsinės lempos maitinimo srovės valdymo būdas pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtas iš anksto numatytas laiko intervalas ($t_1$) ir pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsų trukmė ($t_2$) yra panašaus ilgio ir yra nuo 5 iki 500 kartų trumpesni, negu laiko tarpai (1/*f*) tarp pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsų.

3. Impulsinės lempos maitinimo srovės valdymo būdas pagal 1 arba 2 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtas iš anksto numatytas laiko intervalas ($t_1$) yra maždaug lygus pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsų trukmei ($t_2$).

4. Impulsinės lempos maitinimo srovės valdymo būdas, kai į impulsinę lempą (1) tiekia pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsus, minėtoje lempoje sukeliančius stiprų dujų išlydį, kur pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsai yra paleidžiami sinchroimpulsais; būdas apima šiuos etapus:

- tarpuose tarp minėtų pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsų į impulsinę lempą (1) tiekia budinčiojo lanko srovę, kurios stiprio kitimas laike yra laiptelio pavidalo,
- kiekvieno laiko intervalo tarp gretimų pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsų pradžioje tiekia pirmojo srovės stiprio lygio ($I_0$) budinčiojo lanko srovę, kuri užtikrina nenutrūkstamą srovės tekėjimą tarp lempos (1) elektrodų,
- prieš paleidžiant pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsą, pirmuoju sinchroimpulsu (6) inicijuoja budinčiojo lanko srovės didinimą iki antrojo srovės stiprio lygio ($I_1$),
- antruoju sinchroimpulsu (7), kuris yra suvėlintas per iš anksto numatytą laiko intervalą ($t_1$) minėto pirmojo sinchroimpulso (6) atžvilgiu, paleidžia pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsą,

kur pirmasis srovės stiprio lygis ($I_0$), antrasis srovės stiprio lygis ($I_1$) ir minėtas iš anksto numatytas laiko intervalas ($t_1$) priklauso nuo impulsinės dujų išlydžio lempos parametrų,

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

- minėtas pirmasis budinčiojo lanko srovės stiprio lygis ($I_0$) yra kiek galima žemesnis, tačiau galintis užtikrinti, kad lempoje dujų išlydis neužgestų ir srovė, tekanti per lempos (1) elektrodus, palaikytų jonizacijos kanalą, o
- minėtas antrasis budinčiojo lanko srovės stiprio lygis ($I_1$) yra lygus srovės stipriui, ties kuriuo impulsinės dujų išlydžio lempos (1) varža pasiekia iš anksto numatytąją varžos vertę ($R_{set}$), lygią varžos vertei, kuriai esant pagrindinio išlydžio etapas minėtoje impulsinėje lempoje (1) prasideda įtampos augimu,

kur budinčiojo lanko srovės didinimas iki antrojo srovės stiprio lygio ($I_1$) yra vykdomas per grįžtamojo ryšio grandinę, priklausomai nuo realiu laiku nustatytos impulsinės lempos (1) varžos, atliekant šiuos žingsnius:

- realiu laiku matuoja momentinę budinčiojo lanko srovę, tekančią per dujų išlydžio lempą (1),
- realiu laiku matuoja momentinę įtampos vertę tarp lempos (1) elektrodų,
- iš išmatuotų momentinių srovės ir įtampos verčių, suskaičiuoja momentinę lempos varžos vertę,
- suskaičiuotą momentinę lempos varžos vertę lygina su iš anksto numatytąja varžos verte ($R_{set}$),
- sustabdo budinčiojo lanko srovės didinimą, pasiekus iš anksto numatytąją impulsinės lempos (1) varžos vertę ($R_{set}$);

kur laiko intervalas ($t_1$) yra galimai trumpiausias laiko intervalas, reikalingas numatytajai impulsinės lempos (1) varžos vertei ($R_{set}$) pasiekti.

5. Impulsinės lempos maitinimo srovės valdymo būdas pagal 4 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtoji grįžtamojo ryšio grandinė apima mikrokontrolerį (21), kuris į maitinimo bloką (20) siunčia valdymo signalus, skirtus budinčiojo lanko srovės stiprio didinimui reguliuoti, o pasiekus iš anksto numatytąją impulsinės lempos (1) varžos vertę ($R_{set}$) sustabdyti srovės didinimą.

6. Impulsinės lempos maitinimo srovės valdymo būdas pagal 5 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad mikrokontroleris (21) yra sukonstruotas srovės, tekančios per dujų išlydžio lempą (1), momentinei vertei matuoti ir įtampos, esančios tarp lempos elektrodų, momentinei vertei matuoti, kad realiu laiku būtų suskaičiuota momentinė varžos vertė.

7. Impulsinės lempos srovės valdymo būdas pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad pirmasis budinčiojo lanko srovės stiprio lygis ($I_0$) yra intervale nuo maždaug 10mA iki maždaug 100mA.

8. Impulsinės lempos maitinimo srovės valdymo būdas pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad antrasis budinčiojo lanko srovės stiprio lygis ($I_1$) yra intervale nuo maždaug 1A iki maždaug 20A.

9. Impulsinės lempos maitinimo srovės valdymo būdas pagal bet kurį iš ankstesnių punktų, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad minėtas pirmasis sinchroimpulsas (6) ir minėtas antrasis sinchroimpulsas (7) yra generuojami tuo pačiu sinchroimpulsų šaltiniu, kur pirmasis sinchroimpulsas (6), inicijuojantis budinčiojo lanko srovės didinimą nuo pirmojo srovės stiprio lygio ($I_0$) iki antrojo srovės stiprio lygio ($I_1$), yra tiekiamas tiesiai iš minėto sinchroimpulsų šaltinio, o antrasis sinchroimpulsas (7), paleidžiantis pagrindinio išlydžio maitinimo srovės impulsą, yra tiekiamas iš minėto to paties sinchroimpulsų šaltinio išėjimo impulsą praleidžiant per vėlinimo liniją (8), užlaikančią impulsą numatytu laiko intervalu ($t_1$).

---

*(51)* Int.Cl. ***H05H 7/22*** (2006.01)
***H05H 9/04*** (2006.01)

*(11)* **2825000**

*(96)* 13175973.0

*(96)* 2013-07-10

*(97)* 2015-01-14

*(97)* 2016-03-09

*(72)* UNGARO, Donatella, FR
NARDULLI, Jacopo, FR

*(73)* ADAM S.A., 1209 Geneva, CH

*(74)* Marija LENKUTIENĖ, 6, Patentinių paslaugų centras, UAB, J. Basanavičiaus g. 11/1, LT-03108 Vilnius, LT

*(54)* Vertikalus protonų linijinis greitintuvas su ekranuojančia konstrukcija, skirtas protonų terapijai

Apibrėžties punktai: 6, brėžiniai: 2.

*(57)* 1. Linijinis protonų greitintuvas, apimantis daugybę vienas po kitu išdėstytų greitintuvo komponentų (10), kur minėti greitintuvo komponentai susideda iš protonų šaltinio (11) ir daugybės greitinimo blokų (15, 17), ir

apimantis tinklinę atraminę konstrukciją (20), skirtą palaikyti minėtus greitintuvo komponentus, kur minėta atraminė konstrukcija yra prizmės formos, kurios skerspjūvis yra daugiakampis ir turi daugybę šoninių paviršių (21), jungiančių priešingas prizmės puses, ir kur minėta atraminė konstrukcija yra išdėstyta koncentriškai minėtų greitintuvo komponentų atžvilgiu,

minėtas greitintuvas b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad daugybė ekranavimo plokščių (30), pagamintų iš medžiagos, apsaugančios nuo jonizuojančios spinduliuotės, montuojamos ant atitinkamų angų (23), esančių ant minėtos atraminės konstrukcijos šoninių paviršių.

2. Greitintuvas pagal apibrėžties 1 punktą, kur minėtas protonų šaltinis yra duoplazmotronas arba mikrobanginis protonų šaltinis.

3. Greitintuvas pagal bet kurį ankstesnį apibrėžties punktą, kur minėti greitintuvo komponentai papildomai apima inžektorių (13), geriau radijo dažnių kvadrupolinį inžektorių, sumontuotą po protonų šaltiniu.

4. Greitintuvas pagal bet kurį ankstesnį apibrėžties punktą, kur minėti greitinimo blokai apima daugybę šonuose sujungtų tampraus vamzdžio linijinio greitintuvo blokų (15) ir daugybės ertmėmis sujungtų linijinio greitintuvo blokų (17).

5. Greitintuvas pagal apibrėžties 1 punktą, kur minėto greitintuvo ir atraminės konstrukcijos padėtis yra vertikali.

6. Greitintuvas pagal apibrėžties 5 punktą, kur minėta atraminė konstrukcija montuojama daugiaaukščiame statinyje ir yra įrengta daugybė šoninių laikiklių (25), kurie išsikiša iš atraminės konstrukcijos šonų, ir kur minėti laikikliai skirti paremti atraminę konstrukciją (20) atitinkamuose daugiaaukščio statinio aukštuose.

## *Patento perleidimas pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 42 straipsnį*

*(11)* **0912518**

*(51)* Int.Cl.

| | |
|---|---|
| ***A61K 31/00*** | (2006.01) |
| ***A61K 31/44*** | (2006.01) |
| ***A61K 31/4418*** | (2006.01) |
| ***A61K 31/444*** | (2006.01) |
| ***A61P 1/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 1/04*** | (2006.01) |
| ***A61P 3/10*** | (2006.01) |
| ***A61P 7/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 11/06*** | (2006.01) |
| ***A61P 13/12*** | (2006.01) |
| ***A61P 15/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 15/06*** | (2006.01) |
| ***A61P 15/12*** | (2006.01) |
| ***A61P 17/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 17/02*** | (2006.01) |
| ***A61P 19/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 19/02*** | (2006.01) |
| ***A61P 19/06*** | (2006.01) |
| ***A61P 19/10*** | (2006.01) |
| ***A61P 21/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 25/04*** | (2006.01) |
| ***A61P 25/28*** | (2006.01) |
| ***A61P 27/02*** | (2006.01) |
| ***A61P 27/06*** | (2006.01) |
| ***A61P 29/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 31/12*** | (2006.01) |
| ***A61P 35/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 35/04*** | (2006.01) |
| ***A61P 43/00*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/34*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/61*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/64*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/65*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/75*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/80*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/82*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/85*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/89*** | (2006.01) |
| ***C07D 401/04*** | (2006.01) |

*(13)* T

*(54)* Pakeisti piridinai kaip selektyvūs ciklooksigenazės-2 inhibitoriai

*Perėmėjo pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, sutarties data*

*(73)* MERCK CANADA INC., Kirkland, Quebec, H9H 3L1, CA

2016-05-26

*(11)* **0929530**

*(51)* Int.Cl.

| | |
|---|---|
| ***A61F 13/00*** | (2006.01) |
| ***A61F 13/02*** | (2006.01) |
| ***A61F 13/15*** | (2006.01) |
| ***A61K 31/505*** | (2006.01) |
| ***A61K 31/517*** | (2006.01) |
| ***A61K 31/5377*** | (2006.01) |
| ***A61K 31/541*** | (2006.01) |
| ***A61P 3/10*** | (2006.01) |
| ***A61P 9/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 9/10*** | (2006.01) |
| ***A61P 13/12*** | (2006.01) |
| ***A61P 17/06*** | (2006.01) |
| ***A61P 19/02*** | (2006.01) |
| ***A61P 27/02*** | (2006.01) |
| ***A61P 29/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 35/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 37/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 37/02*** | (2006.01) |
| ***A61P 43/00*** | (2006.01) |
| ***C07D 207/00*** | (2006.01) |
| ***C07D 211/00*** | (2006.01) |
| ***C07D 239/72*** | (2006.01) |
| ***C07D 239/93*** | (2006.01) |
| ***C07D 239/94*** | (2006.01) |
| ***C07D 309/02*** | (2006.01) |
| ***C07D 317/08*** | (2006.01) |
| ***C07D 401/12*** | (2006.01) |
| ***C07D 403/12*** | (2006.01) |
| ***C07D 405/12*** | (2006.01) |
| ***C07D 413/12*** | (2006.01) |
| ***C07D 417/02*** | (2006.01) |
| ***C07D 417/12*** | (2006.01) |

*(13)* T

*(54)* Chinazolino dariniai ir juos turinčios farmacinės kompozicijos

*Perėmėjo pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, sutarties data*

*(73)* Genzyme Corporation, Cambridge, MA 02142, US

2016-05-20

---

*(11)* **1244647**

*(51)* Int.Cl.

| | |
|---|---|
| ***C07D 401/12*** | (2006.01) |
| ***A61P 9/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 35/00*** | (2006.01) |

*(13)* T

*(54)* Chinazolino dariniai - VEGF slopikliai

*Perėmėjo pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, sutarties data*

*(73)* Genzyme Corporation, Cambridge, MA 02142, US

2016-05-20

---

*(11)* **1676845**
*(51)* Int.Cl. ***C07D 401/12*** (2006.01)
***A61P 9/00*** (2006.01)
***A61P 35/00*** (2006.01)
*(13)* T
*(54)* Nauji chinazolino dariniai
*Perėmėjo pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, sutarties data*
*(73)* Genzyme Corporation, Cambridge, MA 02142, US
2016-05-20

---

*(11)* **1706424**
*(51)* Int.Cl. ***C07K 16/00*** (2006.01)
***A61K 39/395*** (2006.01)
*(13)* T
*(54)* FC srities variantai
*Perėmėjo pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, sutarties data*
*(73)* Mentrik Biotech, LLC, Dallas, Texas 75251, US
2016-05-27

---

*(11)* **1753431**
*(51)* Int.Cl. ***A61K 31/517*** (2006.01)
***A61K 47/38*** (2006.01)
***A61K 47/02*** (2006.01)
*(13)* T
*(54)* Farmacinės kompozicijos, apimančios ZD6474
*Perėmėjo pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, sutarties data*
*(73)* Genzyme Corporation, Cambridge, MA 02142, US
2016-05-20

---

*(11)* **1943240**
*(51)* Int.Cl. ***C07D 401/12*** (2006.01)
***C07D 239/94*** (2006.01)
***C07D 211/16*** (2006.01)
*(13)* T
*(54)* Cheminis būdas
*Perėmėjo pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, sutarties data*
*(73)* Genzyme Corporation, Cambridge, MA 02142, US
2016-05-20

---

*(11)* **1961761**
*(51)* Int.Cl. ***C07K 7/04*** (2006.01)
***A61K 39/00*** (2006.01)
***A61P 35/00*** (2006.01)
***C07K 16/44*** (2006.01)
***C12N 5/07*** (2006.01)
***C12P 21/08*** (2006.01)
*(13)* T
*(54)* Nauji peptidų junginiai iš Vilmso naviko
*Perėmėjo pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, sutarties data*

*(73)* International Institute of Cancer Immunology, Inc., Suita-shi, Osaka 564-0053, JP
Sumitomo Dainippon Pharma Co., Ltd., Osaka-shi Osaka 541-8524, JP
2016-05-13

---

*(11)* **2283154**
*(51)* Int.Cl. ***C12Q 1/68*** (2006.01)
*(13)* T
*(54)* MAL ir CADM1 promotoriaus metilinimo molekulinės diagnostikos žymuo, skirtas ŽPV indukuotam invaziniam gimdos kaklelio vėžiui ir jo labai piktybinių pirmtakų pažeidimams nustatyti
*Perėmėjo pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, sutarties data*
*(73)* Self-screen B.V., 1098 RX Amsterdam, NL
2016-05-23

---

## *Europos patento pakeitimai, paskelbti pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 71 ir 79 straipsnius*

*(11)* **0912518**

*(51)* Int.Cl.

| | |
|---|---|
| ***A61K 31/00*** | (2006.01) |
| ***A61K 31/44*** | (2006.01) |
| ***A61K 31/4418*** | (2006.01) |
| ***A61K 31/444*** | (2006.01) |
| ***A61P 1/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 1/04*** | (2006.01) |
| ***A61P 3/10*** | (2006.01) |
| ***A61P 7/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 11/06*** | (2006.01) |
| ***A61P 13/12*** | (2006.01) |
| ***A61P 15/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 15/06*** | (2006.01) |
| ***A61P 15/12*** | (2006.01) |
| ***A61P 17/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 17/02*** | (2006.01) |
| ***A61P 19/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 19/02*** | (2006.01) |
| ***A61P 19/06*** | (2006.01) |
| ***A61P 19/10*** | (2006.01) |
| ***A61P 21/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 25/04*** | (2006.01) |
| ***A61P 25/28*** | (2006.01) |
| ***A61P 27/02*** | (2006.01) |
| ***A61P 27/06*** | (2006.01) |
| ***A61P 29/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 31/12*** | (2006.01) |
| ***A61P 35/00*** | (2006.01) |
| ***A61P 35/04*** | (2006.01) |
| ***A61P 43/00*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/34*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/61*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/64*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/65*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/75*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/80*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/82*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/85*** | (2006.01) |
| ***C07D 213/89*** | (2006.01) |
| ***C07D 401/04*** | (2006.01) |

*(13)* T

*(54)* Pakeisti piridinai kaip selektyvūs ciklooksigenazės-2 inhibitoriai

*(73)* MERCK CANADA INC., 16711 Trans-Canada Highway, Kirkland, Quebec, H9H 3L1, CA

*(46)* 2003-12-29

*Ankstesnis savininko pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, pakeitimo data*

Merck Frosst Canada & Co., Purdy`s Wharf Tower One, 1959 upper Water Street, P.O. Box 997, Halifax, Nova Scotia B3J 2X2, CA

2016-05-26

*(11)* **1446119**

*(51)* Int.Cl. ***A61K 31/46*** (2006.01)
***A61P 11/00*** (2006.01)
***A61K 31/415*** (2006.01)

*(13)* T

*(54)* Ipratropiumo ir ksilometazolino turinti kompozicija, skirta peršalimo gydymui

*(73)* TAKEDA PHARMA A/S, Dybendal Alle 10, 2630 Taastrup, DK

*(46)* 2006-07-25
*Ankstesnis savininko pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, pakeitimo data*
TAKEDA PHARMA A/S, Langebjerg 1, 4000 Roskilde, DK
2016-05-19

---

*(11)* **1706424**

*(51)* Int.Cl. ***C07K 16/00*** (2006.01)
***A61K 39/395*** (2006.01)

*(13)* T

*(54)* FC srities variantai

*(73)* Applied Molecular Evoliution, Inc., 10300 Campus Point, Suite 200, San Diego, California 92121, US

*(46)* 2009-11-25
*Ankstesnis savininko pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, pakeitimo data*
Applied Molecular Evolution, Inc., 3520 Dunhill Street, San Diego, CA 92121, US
2016-05-27

---

*(11)* **1910270**

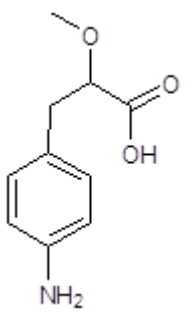
*(51)* Int.Cl. ***C07C 229/42*** (2006.01)
***A61K 31/136*** (2006.01)
***A61P 35/00*** (2006.01)

*(13)* T

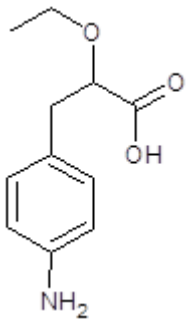
*(54)* Junginiai ir jų druskos, specifiniai PPAR receptorių ir EGF receptorių atžvilgiu, ir jų panaudojimas medicinos srityje

*(46)* 2013-08-26
*Pakeista išradimo apibrėžtis, pakeitimo data*

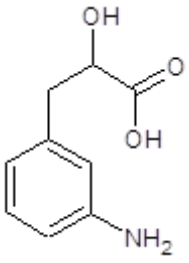
*(57)* 1. Junginys ir jo druskos, parinktos iš grupės, susidedančios iš:



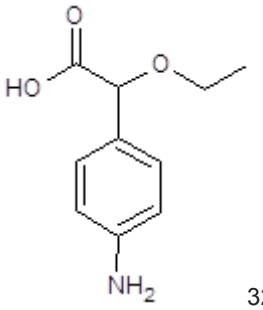

34



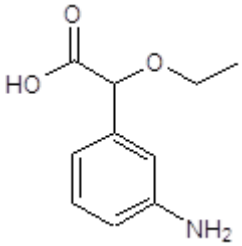

39



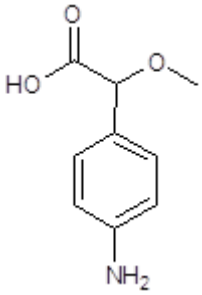

23




32




33




20

2. Junginys pagal 1 punktą enantiomeriškai grynoje R arba S formoje.

3. Junginys, parinktas iš grupės susidedančios iš:
(+-)-2-hidroksi-3-(3'-aminofenil) propiono rūgšties (junginys 20)
(+-)-2-metoksi-2-(4'-aminofenil) acto rūgšties (junginys 23)
25 (+-)-2-etoksi-2-(3'-aminofenil) acto rūgšties (junginys 32)
(+-)-2-etoksi-2-(4'-aminofenil) acto rūgšties (junginys 33)
(+-)-2-metoksi-3-(4'-aminofenil) propiono rūgšties (junginys 34)
(+-)-2-etoksi-3-(4'-aminofenil) propiono rūgšties (junginys 39) ir
(+-)-2-etoksi -3-(3'-aminofenil) propiono rūgšties (junginys 40), skirtas naudoti medicinos srityje.

4. Junginys 2-metoksi-3-(3'-aminofenil) propiono rūgštis arba (+-)-2-hidroksi-3-(4'aminofenil) propiono rūgštis (junginys 21), skirtas naudoti medicinos srityje.

5. Junginys, skirtas naudoti pagal 3 arba 4 punktą, kur medicinos sritis yra gydymas lėtinės uždegiminės ligos arba naviko, ekspresuojančio PPAR ir EGF.

6. Junginys, skirtas naudoti pagal 5 punktą, kur navikai yra parinkti iš grupės, susidedančios iš stemplės, skrandžio, kasos, gaubtinės žarnos, prostatos, krūties, gimdos ir gimdos kaklelio, inkstų ir plaučių navikų.

7. Junginys, skirtas naudoti pagal 6 punktą, kur junginys yra (+-)-2-metoksi-3-(4'aminofenil) propiono rūgštis (junginys 34) arba (+-)-2-etoksi-3-(4'-aminofenil) propiono rūgštis (junginys 39).

8. Junginys, skirtas naudoti pagal 5 punktą, kur lėtinė uždegiminė liga yra Krono liga arba opinis rektokolitas.

9. Junginys, skirtas naudoti pagal 8 punktą, kur junginys yra
(+-)-2-metoks-3-(4'-aminofenil) propiono rūgštis (junginys 34)
(+-)-2-etoksi -3-(4'-aminofenil) propiono rūgštis (junginys 39) arba
(+-)-2-etoksi -3-(3'-aminofenil) propiono rūgštis (junginys 40).

10. Junginys, skirtas naudoti pagal bet kurį vieną iš 3 – 9 punktų, kur junginys naudojamas mišinyje, kuriame yra vieno iš enantiomerų perteklius bet kokiu santykiu.

11. Farmacinė kompozicija, apimanti vieną ar daugiau junginių iš 1-3 punktų, naudojamų pagrindiniu komponentu derinyje su vienu ar daugiau farmaciškai priimtinų ekscipientų arba adjuvantų.
2016-05-20

---

*(11)* **1916994**

*(51)* Int.Cl. ***A61K 9/00*** (2006.01)
***A61K 9/20*** (2006.01)
***A61K 31/542*** (2006.01)

*(13)* T

*(54)* Greito atpalaidavimo farmacinės kompozicijos iš vandenyje netirpių vaistų gamyba, ir farmacinės kompozicijos, gautos išradimo būdu

*(73)* TAKEDA PHARMA A/S, Dybendal Alle 10, 2630 Taastrup, DK

*(46)* 2014-02-25
*Ankstesnis savininko pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, pakeitimo data*
Takeda Pharma A/S, Langebjerg 1, 4000 Roskilde, DK
2016-05-19

---

*(11)* **1934174**

*(51)* Int.Cl. ***C07D 205/04*** (2006.01)
***C07D 205/06*** (2006.01)
***C07D 401/06*** (2006.01)
***C07D 401/12*** (2006.01)
***C07D 401/14*** (2006.01)
***C07D 403/04*** (2006.01)
***C07D 403/06*** (2006.01)
***C07D 403/12*** (2006.01)
***C07D 405/12*** (2006.01)
***C07D 409/06*** (2006.01)
***C07D 409/12*** (2006.01)
***C07D 413/12*** (2006.01)
***C07D 413/14*** (2006.01)
***C07D 417/12*** (2006.01)
***C07D 471/04*** (2006.01)

*(13)* T

*(54)* Azetinidai kaip MEK inhibitoriai, skirti proliferacinių ligų gydymui

*(73)* Exelixis, Inc., 210 East Grand Avenue, South San Francisco, CA 94080, US

*(46)* 2011-08-25
*Ankstesnis savininko pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, pakeitimo data*
Exelixis, Inc., 210 East Grand Avenue P.O. Box 511, South San Francisco, CA 94083-0511, US
2016-05-17

---

*(11)* **2281555**

*(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)

*(13)* T

*(54)* Kartą per dieną vartojamos oksikodono formos

*(73)* EURO-CELTIQUE S.A., 1, rue Jean Piret, 2350 Luxembourg, LU

*(46)* 2016-05-10
*Ankstesnis savininko pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, pakeitimo data*
EURO-CELTIQUE S.A., 2, avenue Charles de Gaulle, 1653 Luxembourg, LU
2016-05-11

---

## *Europos patentų išplėtimo Lietuvos Respublikoje panaikinimas pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 75 straipsnį*

| (11) EPO paskelbimo numeris | Panaikinimo data |
|---|---|
| 1245232 | 2015-11-10 |
| 1335938 | 2015-11-09 |
| 1448566 | 2015-11-13 |
| 1562932 | 2015-11-17 |
| 1562954 | 2015-11-12 |
| 1685150 | 2015-11-11 |
| 1689404 | 2015-11-15 |
| 1690429 | 2015-11-17 |
| 1692105 | 2015-11-19 |
| 1803718 | 2015-11-17 |

***Europos patentai,***
***laikomi negaliojančiais***
***pagal Lietuvos Respublikos patentų***
***įstatymo 71 straipsnio 5 dalį***

| (11)<br>EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu<br>data |
|---|---|
| 1565402 | 2016-02-03 |
| 1609785 | 2016-02-03 |
| 1724890 | 2016-02-03 |

***Europos patentai,***
***pripažinti negaliojančiais***
***pagal Lietuvos Respublikos***
***patentų įstatymo 71 ir 79 straipsnius***

| (11)<br>EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu<br>data |
|---|---|
| 1715893 | 2015-10-22 |

***Europos patentai, kurių galiojimas pasibaigęs pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 36 straipsnį***

| Patento nr. | Galiojimo baigties data |
|---|---|
| 0742013 | 2016-05-09 |
| 0824517 | 2016-05-09 |
| 0825966 | 2016-05-14 |
| 0830338 | 2016-05-13 |
| 0833561 | 2016-05-20 |

## *Europos patentų galiojimo Lietuvos Respublikoje panaikinimas pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 81 straipsnį*

| (11) EPO paskelbimo numeris | Panaikinimo data |
|---|---|
| 1787651 | 2015-11-21 |
| 1787775 | 2015-11-14 |
| 1787776 | 2015-11-14 |
| 1812072 | 2015-11-16 |
| 1814595 | 2015-11-22 |
| 1814847 | 2015-11-17 |
| 1819729 | 2015-11-18 |
| 1824489 | 2015-11-15 |
| 1828222 | 2015-11-14 |
| 1945556 | 2015-11-11 |
| 1948692 | 2015-11-13 |
| 1948794 | 2015-11-17 |
| 1951658 | 2015-11-14 |
| 1951659 | 2015-11-10 |
| 1951718 | 2015-11-21 |
| 1954668 | 2015-11-16 |
| 1955055 | 2015-11-17 |
| 1957484 | 2015-11-21 |
| 1959911 | 2015-11-23 |
| 2091920 | 2015-11-09 |
| 2094614 | 2015-11-13 |
| 2222648 | 2015-11-21 |
| 2223684 | 2015-11-21 |
| 2225238 | 2015-11-20 |
| 2496084 | 2015-11-05 |
| 2649998 | 2015-11-05 |

***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 |
|---|---|---|---|
| 1586480 | 2016-02-10 | 1753908 | 2016-02-03 |
| 1600081 | 2016-02-03 | 1755744 | 2016-02-03 |
| 1600439 | 2016-02-03 | 1758967 | 2016-02-03 |
| 1600966 | 2016-02-03 | 1760696 | 2016-02-03 |
| 1655590 | 2016-02-03 | 1767700 | 2016-02-03 |
| 1691172 | 2016-02-03 | 1769313 | 2016-02-03 |
| 1707304 | 2016-02-03 | 1775910 | 2016-02-03 |
| 1710509 | 2016-02-03 | 1786491 | 2016-02-03 |
| 1720840 | 2016-02-03 | 1791655 | 2016-02-03 |
| 1724414 | 2016-02-03 | 1794109 | 2016-02-03 |
| 1728793 | 2016-02-03 | 1796674 | 2016-02-03 |
| 1736530 | 2016-02-03 | 1799081 | 2016-02-03 |
| 1740964 | 2016-02-03 | 1813122 | 2016-02-03 |
| 1742683 | 2016-02-03 | 1814622 | 2016-02-03 |
| 1743054 | 2016-02-03 | 1816158 | 2016-02-03 |
| 1745195 | 2016-02-03 | 1817975 | 2016-02-10 |
| 1747313 | 2016-02-03 | 1819892 | 2016-02-03 |
| 1750935 | 2016-02-03 | 1820573 | 2016-02-03 |
| 1752548 | 2016-02-03 | 1824794 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 1825232 | 2016-02-03 | 1901643 | 2016-02-03 |
| 1826533 | 2016-02-03 | 1901917 | 2016-02-03 |
| 1828062 | 2016-02-03 | 1902155 | 2016-02-03 |
| 1837415 | 2016-02-03 | 1907527 | 2016-02-03 |
| 1839224 | 2016-02-03 | 1908199 | 2016-02-03 |
| 1841050 | 2016-02-03 | 1908222 | 2016-02-03 |
| 1846625 | 2016-02-03 | 1908777 | 2016-02-03 |
| 1849264 | 2016-02-10 | 1919257 | 2016-02-03 |
| 1849591 | 2016-02-03 | 1922514 | 2016-02-03 |
| 1860569 | 2016-02-03 | 1922641 | 2016-02-03 |
| 1865908 | 2016-02-03 | 1929719 | 2016-02-03 |
| 1866637 | 2016-02-03 | 1934312 | 2016-02-03 |
| 1867421 | 2016-02-03 | 1937491 | 2016-02-03 |
| 1869401 | 2016-02-03 | 1940496 | 2016-02-03 |
| 1872405 | 2016-02-03 | 1944939 | 2016-02-03 |
| 1872570 | 2016-02-03 | 1945185 | 2016-02-03 |
| 1875792 | 2016-02-03 | 1948075 | 2016-02-03 |
| 1880480 | 2016-02-03 | 1954252 | 2016-02-03 |
| 1882016 | 2016-02-03 | 1954574 | 2016-02-03 |
| 1885240 | 2016-02-03 | 1954654 | 2016-02-03 |
| 1889598 | 2016-02-03 | 1954928 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 1957852 | 2016-02-03 | 2017407 | 2016-02-10 |
| 1958836 | 2016-02-03 | 2018111 | 2016-02-03 |
| 1959908 | 2016-02-03 | 2019337 | 2016-02-10 |
| 1968346 | 2016-02-10 | 2021433 | 2016-02-03 |
| 1973500 | 2016-02-03 | 2022180 | 2016-02-03 |
| 1983106 | 2016-02-10 | 2023093 | 2016-02-10 |
| 1984712 | 2016-02-03 | 2024449 | 2016-02-10 |
| 1984988 | 2016-02-10 | 2024486 | 2016-02-10 |
| 1985099 | 2016-02-03 | 2026368 | 2016-02-03 |
| 1991295 | 2016-02-10 | 2026689 | 2016-02-03 |
| 1996577 | 2016-02-10 | 2027208 | 2016-02-10 |
| 1999198 | 2016-02-03 | 2028901 | 2016-02-03 |
| 1999907 | 2016-02-03 | 2029927 | 2016-02-10 |
| 2001678 | 2016-02-10 | 2034567 | 2016-02-10 |
| 2006381 | 2016-02-03 | 2035431 | 2016-02-03 |
| 2007190 | 2016-02-03 | 2038998 | 2016-02-10 |
| 2010237 | 2016-02-10 | 2043714 | 2016-02-10 |
| 2010574 | 2016-02-03 | 2045675 | 2016-02-10 |
| 2012712 | 2016-02-10 | 2047175 | 2016-02-10 |
| 2012733 | 2016-02-10 | 2051638 | 2016-02-10 |
| 2014692 | 2016-02-10 | 2053332 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2054577 | 2016-02-10 | 2100865 | 2016-02-10 |
| 2058101 | 2016-02-10 | 2104274 | 2016-02-10 |
| 2062051 | 2016-02-10 | 2106738 | 2016-02-10 |
| 2062134 | 2016-02-10 | 2106950 | 2016-02-10 |
| 2063336 | 2016-02-10 | 2110697 | 2016-02-10 |
| 2066395 | 2016-02-10 | 2113410 | 2016-02-10 |
| 2066421 | 2016-02-10 | 2114745 | 2016-02-10 |
| 2068973 | 2016-02-10 | 2115506 | 2016-02-03 |
| 2069432 | 2016-02-10 | 2116497 | 2016-02-10 |
| 2076148 | 2016-02-10 | 2116958 | 2016-02-10 |
| 2079430 | 2016-02-10 | 2119179 | 2016-02-10 |
| 2079890 | 2016-02-10 | 2120392 | 2016-02-03 |
| 2082355 | 2016-02-10 | 2120558 | 2016-02-10 |
| 2082838 | 2016-02-10 | 2121402 | 2016-02-10 |
| 2090702 | 2016-02-10 | 2121905 | 2016-02-10 |
| 2093355 | 2016-02-10 | 2122460 | 2016-02-10 |
| 2093942 | 2016-02-03 | 2123499 | 2016-02-10 |
| 2096833 | 2016-02-03 | 2124788 | 2016-02-10 |
| 2097680 | 2016-02-10 | 2126471 | 2016-02-10 |
| 2099451 | 2016-02-10 | 2129478 | 2016-02-10 |
| 2099587 | 2016-02-10 | 2129496 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2129861 | 2016-02-03 | 2163068 | 2016-02-03 |
| 2130899 | 2016-02-10 | 2163370 | 2016-02-10 |
| 2131798 | 2016-02-10 | 2163777 | 2016-02-10 |
| 2134571 | 2016-02-10 | 2163851 | 2016-02-10 |
| 2137137 | 2016-02-10 | 2163852 | 2016-02-10 |
| 2137668 | 2016-02-10 | 2164538 | 2016-02-10 |
| 2140816 | 2016-02-10 | 2164701 | 2016-02-10 |
| 2144455 | 2016-02-10 | 2165637 | 2016-02-10 |
| 2144482 | 2016-02-10 | 2165660 | 2016-02-10 |
| 2147986 | 2016-02-10 | 2165847 | 2016-02-10 |
| 2148344 | 2016-02-10 | 2166226 | 2016-02-10 |
| 2150002 | 2016-02-10 | 2167406 | 2016-02-10 |
| 2150524 | 2016-02-10 | 2169051 | 2016-02-10 |
| 2150559 | 2016-02-10 | 2169211 | 2016-02-10 |
| 2150789 | 2016-02-10 | 2169835 | 2016-02-10 |
| 2152982 | 2016-02-10 | 2170782 | 2016-02-10 |
| 2155237 | 2016-02-10 | 2170994 | 2016-02-10 |
| 2157739 | 2016-02-10 | 2171574 | 2016-02-10 |
| 2158025 | 2016-02-10 | 2172598 | 2016-02-10 |
| 2162038 | 2016-02-10 | 2172700 | 2016-02-10 |
| 2162309 | 2016-02-03 | 2179092 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2180757 | 2016-02-10 | 2209335 | 2016-02-10 |
| 2183185 | 2016-02-10 | 2210572 | 2016-02-10 |
| 2183540 | 2016-02-10 | 2212152 | 2016-02-10 |
| 2186083 | 2016-02-10 | 2212955 | 2016-02-10 |
| 2186680 | 2016-02-10 | 2213123 | 2016-02-10 |
| 2186981 | 2016-02-10 | 2214277 | 2016-02-10 |
| 2189673 | 2016-02-10 | 2214536 | 2016-02-10 |
| 2190904 | 2016-02-10 | 2215921 | 2016-02-03 |
| 2191120 | 2016-02-10 | 2216118 | 2016-02-03 |
| 2193601 | 2016-02-10 | 2216433 | 2016-02-03 |
| 2193870 | 2016-02-10 | 2217405 | 2016-02-10 |
| 2194691 | 2016-02-10 | 2218102 | 2016-02-10 |
| 2195963 | 2016-02-10 | 2218916 | 2016-02-10 |
| 2197545 | 2016-02-10 | 2219351 | 2016-02-10 |
| 2199778 | 2016-02-10 | 2219562 | 2016-02-10 |
| 2200057 | 2016-02-10 | 2219595 | 2016-02-10 |
| 2200310 | 2016-02-10 | 2219705 | 2016-02-10 |
| 2200675 | 2016-02-10 | 2220064 | 2016-02-10 |
| 2200949 | 2016-02-10 | 2220845 | 2016-02-10 |
| 2205340 | 2016-02-10 | 2221109 | 2016-02-10 |
| 2207860 | 2016-02-10 | 2222720 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2223261 | 2016-02-10 | 2243785 | 2016-02-03 |
| 2223432 | 2016-02-10 | 2243818 | 2016-02-03 |
| 2224088 | 2016-02-10 | 2244525 | 2016-02-10 |
| 2224546 | 2016-02-10 | 2244526 | 2016-02-10 |
| 2224964 | 2016-02-10 | 2245118 | 2016-02-10 |
| 2226274 | 2016-02-10 | 2246080 | 2016-02-10 |
| 2226681 | 2016-02-10 | 2247229 | 2016-02-03 |
| 2227106 | 2016-02-10 | 2247667 | 2016-02-10 |
| 2227603 | 2016-02-10 | 2250008 | 2016-02-10 |
| 2227667 | 2016-02-10 | 2253103 | 2016-02-03 |
| 2228408 | 2016-02-10 | 2253243 | 2016-02-10 |
| 2228596 | 2016-02-10 | 2253816 | 2016-02-10 |
| 2233063 | 2016-02-10 | 2254483 | 2016-02-10 |
| 2233149 | 2016-02-10 | 2254959 | 2016-02-10 |
| 2234776 | 2016-02-10 | 2255470 | 2016-02-03 |
| 2236749 | 2016-02-10 | 2255496 | 2016-02-10 |
| 2239846 | 2016-02-10 | 2257171 | 2016-02-10 |
| 2240324 | 2016-02-03 | 2258244 | 2016-02-10 |
| 2242831 | 2016-02-10 | 2258926 | 2016-02-10 |
| 2243139 | 2016-02-10 | 2260620 | 2016-02-03 |
| 2243750 | 2016-02-10 | 2264137 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2264271 | 2016-02-10 | 2280630 | 2016-02-10 |
| 2264473 | 2016-02-10 | 2280946 | 2016-02-10 |
| 2265412 | 2016-02-03 | 2280989 | 2016-02-10 |
| 2265482 | 2016-02-10 | 2282228 | 2016-02-10 |
| 2265514 | 2016-02-10 | 2282292 | 2016-02-10 |
| 2266377 | 2016-02-10 | 2285611 | 2016-02-10 |
| 2268218 | 2016-02-10 | 2286523 | 2016-02-10 |
| 2268544 | 2016-02-10 | 2287477 | 2016-02-10 |
| 2268734 | 2016-02-10 | 2288430 | 2016-02-10 |
| 2269375 | 2016-02-10 | 2288468 | 2016-02-10 |
| 2269965 | 2016-02-10 | 2289311 | 2016-02-10 |
| 2270182 | 2016-02-10 | 2289677 | 2016-02-10 |
| 2270418 | 2016-02-10 | 2292034 | 2016-02-10 |
| 2270832 | 2016-02-10 | 2292910 | 2016-02-10 |
| 2271033 | 2016-02-10 | 2294804 | 2016-02-10 |
| 2273474 | 2016-02-10 | 2294849 | 2016-02-10 |
| 2274791 | 2016-02-10 | 2295096 | 2016-02-10 |
| 2275054 | 2016-02-10 | 2296546 | 2016-02-10 |
| 2276365 | 2016-02-10 | 2296588 | 2016-02-10 |
| 2276375 | 2016-02-10 | 2297736 | 2016-02-10 |
| 2279497 | 2016-02-10 | 2298399 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2298477 | 2016-02-10 | 2310846 | 2016-02-10 |
| 2298970 | 2016-02-10 | 2312618 | 2016-02-10 |
| 2299261 | 2016-02-10 | 2312695 | 2016-02-10 |
| 2299641 | 2016-02-10 | 2317268 | 2016-02-10 |
| 2300544 | 2016-02-10 | 2318842 | 2016-02-10 |
| 2300707 | 2016-02-10 | 2320715 | 2016-02-10 |
| 2300864 | 2016-02-10 | 2320872 | 2016-02-10 |
| 2302148 | 2016-02-10 | 2321975 | 2016-02-10 |
| 2302197 | 2016-02-10 | 2326401 | 2016-02-10 |
| 2303428 | 2016-02-10 | 2327275 | 2016-02-10 |
| 2304243 | 2016-02-10 | 2329481 | 2016-02-10 |
| 2305306 | 2016-02-10 | 2330858 | 2016-02-10 |
| 2306277 | 2016-02-10 | 2330958 | 2016-02-10 |
| 2306486 | 2016-02-10 | 2330980 | 2016-02-10 |
| 2307186 | 2016-02-10 | 2331297 | 2016-02-10 |
| 2308614 | 2016-02-10 | 2332748 | 2016-02-10 |
| 2309639 | 2016-02-10 | 2334318 | 2016-02-10 |
| 2309669 | 2016-02-10 | 2334320 | 2016-02-10 |
| 2310180 | 2016-02-10 | 2334358 | 2016-02-10 |
| 2310502 | 2016-02-10 | 2335194 | 2016-02-10 |
| 2310575 | 2016-02-10 | 2335452 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2337037 | 2016-02-10 | 2352420 | 2016-02-10 |
| 2337734 | 2016-02-10 | 2352818 | 2016-02-10 |
| 2338454 | 2016-02-10 | 2353428 | 2016-02-03 |
| 2339300 | 2016-02-10 | 2355181 | 2016-02-10 |
| 2340628 | 2016-02-10 | 2356814 | 2016-02-10 |
| 2340823 | 2016-02-10 | 2358316 | 2016-02-10 |
| 2341736 | 2016-02-10 | 2359052 | 2016-02-10 |
| 2341797 | 2016-02-10 | 2359601 | 2016-02-10 |
| 2342142 | 2016-02-10 | 2359606 | 2016-02-10 |
| 2343911 | 2016-02-10 | 2360193 | 2016-02-10 |
| 2344506 | 2016-02-10 | 2360322 | 2016-02-03 |
| 2344728 | 2016-02-10 | 2360438 | 2016-02-10 |
| 2345234 | 2016-02-10 | 2360879 | 2016-02-10 |
| 2345617 | 2016-02-10 | 2360999 | 2016-02-10 |
| 2346061 | 2016-02-10 | 2361131 | 2016-02-10 |
| 2346529 | 2016-02-10 | 2361317 | 2016-02-10 |
| 2348248 | 2016-02-10 | 2361348 | 2016-02-10 |
| 2348824 | 2016-02-10 | 2362201 | 2016-02-10 |
| 2350527 | 2016-02-10 | 2362508 | 2016-02-03 |
| 2351731 | 2016-02-10 | 2362509 | 2016-02-10 |
| 2352077 | 2016-02-10 | 2362749 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2363635 | 2016-02-10 | 2390651 | 2016-02-10 |
| 2364876 | 2016-02-10 | 2390722 | 2016-02-10 |
| 2365711 | 2016-02-10 | 2393638 | 2016-02-03 |
| 2366041 | 2016-02-10 | 2393896 | 2016-02-03 |
| 2367477 | 2016-02-10 | 2393920 | 2016-02-03 |
| 2370007 | 2016-02-10 | 2394175 | 2016-02-03 |
| 2371067 | 2016-02-10 | 2395187 | 2016-02-10 |
| 2372344 | 2016-02-10 | 2395680 | 2016-02-10 |
| 2373388 | 2016-02-10 | 2395997 | 2016-02-10 |
| 2373550 | 2016-02-10 | 2396067 | 2016-02-10 |
| 2374215 | 2016-02-10 | 2396322 | 2016-02-03 |
| 2375224 | 2016-02-10 | 2396540 | 2016-02-10 |
| 2375846 | 2016-02-03 | 2396646 | 2016-02-10 |
| 2377630 | 2016-02-10 | 2396654 | 2016-02-10 |
| 2378721 | 2016-02-10 | 2397508 | 2016-02-10 |
| 2379082 | 2016-02-10 | 2397660 | 2016-02-10 |
| 2380035 | 2016-02-10 | 2397867 | 2016-02-10 |
| 2381449 | 2016-02-10 | 2397925 | 2016-02-10 |
| 2385354 | 2016-02-10 | 2400828 | 2016-02-10 |
| 2386544 | 2016-02-10 | 2401293 | 2016-02-10 |
| 2388044 | 2016-02-10 | 2401883 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2402105 | 2016-02-10 | 2414070 | 2016-02-10 |
| 2402493 | 2016-02-10 | 2414155 | 2016-02-10 |
| 2403760 | 2016-02-10 | 2414266 | 2016-02-10 |
| 2403905 | 2016-02-03 | 2414495 | 2016-02-10 |
| 2406507 | 2016-02-03 | 2414833 | 2016-02-10 |
| 2406783 | 2016-02-10 | 2414850 | 2016-02-10 |
| 2407229 | 2016-02-10 | 2415692 | 2016-02-10 |
| 2407361 | 2016-02-10 | 2415887 | 2016-02-10 |
| 2407584 | 2016-02-10 | 2416785 | 2016-02-10 |
| 2408483 | 2016-02-10 | 2417388 | 2016-02-10 |
| 2409172 | 2016-02-10 | 2417807 | 2016-02-10 |
| 2410614 | 2016-02-10 | 2417838 | 2016-02-10 |
| 2410620 | 2016-02-10 | 2418057 | 2016-02-10 |
| 2410714 | 2016-02-10 | 2418184 | 2016-02-10 |
| 2411242 | 2016-02-10 | 2419025 | 2016-02-10 |
| 2411681 | 2016-02-10 | 2419333 | 2016-02-10 |
| 2411979 | 2016-02-10 | 2420172 | 2016-02-10 |
| 2412243 | 2016-02-10 | 2421495 | 2016-02-10 |
| 2412443 | 2016-02-10 | 2421762 | 2016-02-10 |
| 2412550 | 2016-02-10 | 2423096 | 2016-02-10 |
| 2413585 | 2016-02-10 | 2423923 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2424157 | 2016-02-10 | 2440836 | 2016-02-10 |
| 2424775 | 2016-02-10 | 2441076 | 2016-02-10 |
| 2425118 | 2016-02-10 | 2443296 | 2016-02-10 |
| 2425285 | 2016-02-10 | 2443420 | 2016-02-10 |
| 2426510 | 2016-02-10 | 2443979 | 2016-02-10 |
| 2426878 | 2016-02-10 | 2445131 | 2016-02-10 |
| 2427513 | 2016-02-10 | 2446147 | 2016-02-10 |
| 2429216 | 2016-02-10 | 2446584 | 2016-02-10 |
| 2429325 | 2016-02-10 | 2447209 | 2016-02-10 |
| 2429351 | 2016-02-10 | 2448195 | 2016-02-10 |
| 2430027 | 2016-02-10 | 2449435 | 2016-02-10 |
| 2433545 | 2016-02-10 | 2449452 | 2016-02-10 |
| 2434261 | 2016-02-10 | 2450149 | 2016-02-10 |
| 2434290 | 2016-02-10 | 2450729 | 2016-02-10 |
| 2434956 | 2016-02-10 | 2454374 | 2016-02-10 |
| 2436119 | 2016-02-10 | 2455404 | 2016-02-10 |
| 2437036 | 2016-02-10 | 2455496 | 2016-02-10 |
| 2437255 | 2016-02-03 | 2455963 | 2016-02-03 |
| 2437927 | 2016-02-10 | 2456230 | 2016-02-03 |
| 2439232 | 2016-02-10 | 2456474 | 2016-02-10 |
| 2439367 | 2016-02-10 | 2456709 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2458023 | 2016-02-10 | 2479370 | 2016-02-10 |
| 2458122 | 2016-02-10 | 2480031 | 2016-02-03 |
| 2459091 | 2016-02-10 | 2480339 | 2016-02-10 |
| 2459263 | 2016-02-10 | 2480550 | 2016-02-10 |
| 2461680 | 2016-02-10 | 2481302 | 2016-02-10 |
| 2461998 | 2016-02-10 | 2482078 | 2016-02-03 |
| 2463178 | 2016-02-10 | 2482663 | 2016-02-10 |
| 2463473 | 2016-02-10 | 2482889 | 2016-02-10 |
| 2464711 | 2016-02-10 | 2484344 | 2016-02-10 |
| 2465820 | 2016-02-10 | 2485610 | 2016-02-10 |
| 2466163 | 2016-02-10 | 2486332 | 2016-02-10 |
| 2467342 | 2016-02-10 | 2486407 | 2016-02-10 |
| 2469794 | 2016-02-03 | 2487054 | 2016-02-03 |
| 2470952 | 2016-02-10 | 2487115 | 2016-02-03 |
| 2471147 | 2016-02-10 | 2487160 | 2016-02-03 |
| 2471148 | 2016-02-10 | 2487594 | 2016-02-10 |
| 2471797 | 2016-02-03 | 2488430 | 2016-02-10 |
| 2472507 | 2016-02-10 | 2489514 | 2016-02-03 |
| 2473051 | 2016-02-10 | 2489555 | 2016-02-10 |
| 2475679 | 2016-02-10 | 2489746 | 2016-02-03 |
| 2478226 | 2016-02-10 | 2489766 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2489803 | 2016-02-10 | 2502068 | 2016-02-10 |
| 2490056 | 2016-02-10 | 2504548 | 2016-02-10 |
| 2492049 | 2016-02-03 | 2504930 | 2016-02-10 |
| 2492411 | 2016-02-03 | 2505902 | 2016-02-10 |
| 2492435 | 2016-02-10 | 2506216 | 2016-02-10 |
| 2492740 | 2016-02-10 | 2506660 | 2016-02-10 |
| 2493187 | 2016-02-10 | 2506673 | 2016-02-03 |
| 2495402 | 2016-02-03 | 2506755 | 2016-02-10 |
| 2496164 | 2016-02-10 | 2508264 | 2016-02-03 |
| 2496367 | 2016-02-10 | 2508428 | 2016-02-10 |
| 2496743 | 2016-02-10 | 2509262 | 2016-02-03 |
| 2496850 | 2016-02-10 | 2509626 | 2016-02-10 |
| 2497660 | 2016-02-03 | 2510475 | 2016-02-10 |
| 2498066 | 2016-02-03 | 2510583 | 2016-02-10 |
| 2499968 | 2016-02-03 | 2511173 | 2016-02-03 |
| 2500296 | 2016-02-03 | 2511610 | 2016-02-10 |
| 2500596 | 2016-02-03 | 2512304 | 2016-02-10 |
| 2501068 | 2016-02-10 | 2512866 | 2016-02-10 |
| 2501680 | 2016-02-10 | 2514383 | 2016-02-03 |
| 2501765 | 2016-02-10 | 2514837 | 2016-02-10 |
| 2501876 | 2016-02-10 | 2514853 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2515222 | 2016-02-03 | 2524869 | 2016-02-10 |
| 2515467 | 2016-02-10 | 2527779 | 2016-02-03 |
| 2515613 | 2016-02-10 | 2528472 | 2016-02-10 |
| 2515990 | 2016-02-10 | 2530253 | 2016-02-10 |
| 2517673 | 2016-02-10 | 2531136 | 2016-02-03 |
| 2519190 | 2016-02-10 | 2531204 | 2016-02-03 |
| 2519402 | 2016-02-10 | 2531653 | 2016-02-03 |
| 2520112 | 2016-02-10 | 2532054 | 2016-02-03 |
| 2520117 | 2016-02-10 | 2532141 | 2016-02-03 |
| 2520377 | 2016-02-03 | 2532291 | 2016-02-03 |
| 2520507 | 2016-02-03 | 2532791 | 2016-02-03 |
| 2520561 | 2016-02-10 | 2532857 | 2016-02-10 |
| 2520989 | 2016-02-03 | 2533383 | 2016-02-03 |
| 2521277 | 2016-02-10 | 2534120 | 2016-02-03 |
| 2521395 | 2016-02-03 | 2534350 | 2016-02-03 |
| 2522535 | 2016-02-10 | 2534529 | 2016-02-03 |
| 2523016 | 2016-02-03 | 2534851 | 2016-02-03 |
| 2523044 | 2016-02-10 | 2535238 | 2016-02-10 |
| 2523468 | 2016-02-03 | 2535308 | 2016-02-03 |
| 2524426 | 2016-02-10 | 2535915 | 2016-02-10 |
| 2524862 | 2016-02-10 | 2536020 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2536210 | 2016-02-03 | 2547188 | 2016-02-10 |
| 2536772 | 2016-02-10 | 2547246 | 2016-02-03 |
| 2537120 | 2016-02-10 | 2548429 | 2016-02-03 |
| 2537319 | 2016-02-10 | 2548624 | 2016-02-03 |
| 2537376 | 2016-02-10 | 2550145 | 2016-02-03 |
| 2537548 | 2016-02-03 | 2550463 | 2016-02-03 |
| 2538001 | 2016-02-10 | 2551099 | 2016-02-03 |
| 2538604 | 2016-02-10 | 2551212 | 2016-02-10 |
| 2539496 | 2016-02-10 | 2551215 | 2016-02-03 |
| 2539849 | 2016-02-03 | 2551575 | 2016-02-03 |
| 2540760 | 2016-02-03 | 2552092 | 2016-02-10 |
| 2540785 | 2016-02-10 | 2552336 | 2016-02-10 |
| 2540886 | 2016-02-03 | 2553428 | 2016-02-10 |
| 2540904 | 2016-02-03 | 2554072 | 2016-02-10 |
| 2540972 | 2016-02-10 | 2554249 | 2016-02-10 |
| 2542119 | 2016-02-10 | 2555058 | 2016-02-03 |
| 2543352 | 2016-02-03 | 2555459 | 2016-02-10 |
| 2543526 | 2016-02-03 | 2556009 | 2016-02-10 |
| 2544218 | 2016-02-10 | 2556932 | 2016-02-10 |
| 2545220 | 2016-02-10 | 2556936 | 2016-02-03 |
| 2546577 | 2016-02-10 | 2557221 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2557745 | 2016-02-10 | 2566004 | 2016-02-03 |
| 2558628 | 2016-02-10 | 2566161 | 2016-02-10 |
| 2558734 | 2016-02-10 | 2566698 | 2016-02-03 |
| 2559290 | 2016-02-10 | 2567456 | 2016-02-10 |
| 2559574 | 2016-02-03 | 2567925 | 2016-02-10 |
| 2560333 | 2016-02-10 | 2568337 | 2016-02-03 |
| 2560839 | 2016-02-10 | 2568946 | 2016-02-10 |
| 2561283 | 2016-02-10 | 2569519 | 2016-02-10 |
| 2561904 | 2016-02-10 | 2569590 | 2016-02-03 |
| 2562017 | 2016-02-10 | 2569633 | 2016-02-10 |
| 2562173 | 2016-02-10 | 2570343 | 2016-02-03 |
| 2562247 | 2016-02-10 | 2570884 | 2016-02-03 |
| 2562495 | 2016-02-03 | 2571301 | 2016-02-10 |
| 2562781 | 2016-02-03 | 2572239 | 2016-02-10 |
| 2562985 | 2016-02-10 | 2572364 | 2016-02-10 |
| 2564684 | 2016-02-10 | 2572625 | 2016-02-03 |
| 2564752 | 2016-02-03 | 2573433 | 2016-02-10 |
| 2564867 | 2016-02-10 | 2573622 | 2016-02-03 |
| 2564967 | 2016-02-10 | 2574244 | 2016-02-03 |
| 2565707 | 2016-02-03 | 2574335 | 2016-02-03 |
| 2565811 | 2016-02-03 | 2574367 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2574644 | 2016-02-10 | 2584490 | 2016-02-10 |
| 2574671 | 2016-02-03 | 2584567 | 2016-02-10 |
| 2574776 | 2016-02-03 | 2584742 | 2016-02-03 |
| 2574966 | 2016-02-10 | 2585340 | 2016-02-10 |
| 2577028 | 2016-02-10 | 2585600 | 2016-02-03 |
| 2577158 | 2016-02-10 | 2585983 | 2016-02-10 |
| 2577177 | 2016-02-10 | 2586482 | 2016-02-10 |
| 2577573 | 2016-02-10 | 2586597 | 2016-02-10 |
| 2579691 | 2016-02-10 | 2587493 | 2016-02-03 |
| 2579910 | 2016-02-10 | 2587951 | 2016-02-10 |
| 2580836 | 2016-02-10 | 2589403 | 2016-02-03 |
| 2580989 | 2016-02-03 | 2589697 | 2016-02-10 |
| 2581860 | 2016-02-10 | 2589743 | 2016-02-03 |
| 2581982 | 2016-02-03 | 2591490 | 2016-02-03 |
| 2582321 | 2016-02-10 | 2591680 | 2016-02-03 |
| 2582513 | 2016-02-10 | 2591855 | 2016-02-10 |
| 2582643 | 2016-02-10 | 2591926 | 2016-02-03 |
| 2583035 | 2016-02-10 | 2592161 | 2016-02-03 |
| 2583795 | 2016-02-03 | 2592304 | 2016-02-10 |
| 2584039 | 2016-02-10 | 2592309 | 2016-02-03 |
| 2584488 | 2016-02-10 | 2592311 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2593951 | 2016-02-10 | 2599978 | 2016-02-03 |
| 2594358 | 2016-02-10 | 2600130 | 2016-02-03 |
| 2594896 | 2016-02-10 | 2600457 | 2016-02-10 |
| 2595069 | 2016-02-03 | 2600527 | 2016-02-03 |
| 2595144 | 2016-02-03 | 2600570 | 2016-02-10 |
| 2595229 | 2016-02-10 | 2600983 | 2016-02-10 |
| 2595279 | 2016-02-03 | 2601446 | 2016-02-10 |
| 2595667 | 2016-02-10 | 2602224 | 2016-02-03 |
| 2596552 | 2016-02-10 | 2602436 | 2016-02-03 |
| 2596928 | 2016-02-03 | 2602606 | 2016-02-03 |
| 2596966 | 2016-02-03 | 2602827 | 2016-02-03 |
| 2596967 | 2016-02-03 | 2603018 | 2016-02-03 |
| 2597687 | 2016-02-03 | 2603320 | 2016-02-10 |
| 2597804 | 2016-02-10 | 2603435 | 2016-02-10 |
| 2598788 | 2016-02-03 | 2604267 | 2016-02-03 |
| 2599523 | 2016-02-10 | 2604498 | 2016-02-03 |
| 2599613 | 2016-02-10 | 2605328 | 2016-02-03 |
| 2599697 | 2016-02-03 | 2605671 | 2016-02-10 |
| 2599698 | 2016-02-03 | 2605679 | 2016-02-03 |
| 2599817 | 2016-02-03 | 2605967 | 2016-02-10 |
| 2599930 | 2016-02-10 | 2606448 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2608708 | 2016-02-10 | 2617442 | 2016-02-10 |
| 2609428 | 2016-02-10 | 2618939 | 2016-02-10 |
| 2609848 | 2016-02-03 | 2619149 | 2016-02-10 |
| 2610037 | 2016-02-03 | 2619392 | 2016-02-10 |
| 2610377 | 2016-02-10 | 2620222 | 2016-02-10 |
| 2610412 | 2016-02-03 | 2620383 | 2016-02-10 |
| 2611472 | 2016-02-10 | 2620483 | 2016-02-10 |
| 2611504 | 2016-02-10 | 2621593 | 2016-02-10 |
| 2612927 | 2016-02-03 | 2621814 | 2016-02-10 |
| 2613042 | 2016-02-10 | 2623248 | 2016-02-10 |
| 2613922 | 2016-02-10 | 2623256 | 2016-02-03 |
| 2614213 | 2016-02-10 | 2623426 | 2016-02-10 |
| 2614369 | 2016-02-03 | 2623975 | 2016-02-03 |
| 2614384 | 2016-02-10 | 2624261 | 2016-02-10 |
| 2614595 | 2016-02-10 | 2625245 | 2016-02-10 |
| 2615051 | 2016-02-03 | 2625701 | 2016-02-10 |
| 2616375 | 2016-02-10 | 2626086 | 2016-02-03 |
| 2616412 | 2016-02-10 | 2626208 | 2016-02-10 |
| 2616425 | 2016-02-10 | 2626355 | 2016-02-03 |
| 2616550 | 2016-02-10 | 2626731 | 2016-02-03 |
| 2616714 | 2016-02-10 | 2626862 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2627349 | 2016-02-03 | 2634794 | 2016-02-10 |
| 2627657 | 2016-02-03 | 2635690 | 2016-02-03 |
| 2628020 | 2016-02-10 | 2635702 | 2016-02-03 |
| 2628401 | 2016-02-10 | 2636018 | 2016-02-10 |
| 2628568 | 2016-02-10 | 2636529 | 2016-02-03 |
| 2628971 | 2016-02-03 | 2636591 | 2016-02-10 |
| 2629440 | 2016-02-10 | 2637046 | 2016-02-10 |
| 2629635 | 2016-02-03 | 2637184 | 2016-02-03 |
| 2629871 | 2016-02-10 | 2637258 | 2016-02-03 |
| 2630317 | 2016-02-10 | 2637364 | 2016-02-10 |
| 2630339 | 2016-02-10 | 2637741 | 2016-02-03 |
| 2630414 | 2016-02-10 | 2637747 | 2016-02-10 |
| 2631134 | 2016-02-10 | 2637760 | 2016-02-03 |
| 2631138 | 2016-02-10 | 2637951 | 2016-02-10 |
| 2631235 | 2016-02-10 | 2638292 | 2016-02-03 |
| 2631739 | 2016-02-03 | 2639162 | 2016-02-10 |
| 2631949 | 2016-02-10 | 2639201 | 2016-02-10 |
| 2632099 | 2016-02-03 | 2639210 | 2016-02-03 |
| 2632704 | 2016-02-10 | 2639232 | 2016-02-03 |
| 2634043 | 2016-02-10 | 2639296 | 2016-02-03 |
| 2634108 | 2016-02-03 | 2639702 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2640268 | 2016-02-03 | 2644524 | 2016-02-10 |
| 2640306 | 2016-02-10 | 2644544 | 2016-02-03 |
| 2640346 | 2016-02-10 | 2644766 | 2016-02-03 |
| 2640426 | 2016-02-03 | 2644767 | 2016-02-03 |
| 2640565 | 2016-02-10 | 2644785 | 2016-02-10 |
| 2640923 | 2016-02-10 | 2644927 | 2016-02-03 |
| 2641096 | 2016-02-10 | 2645189 | 2016-02-03 |
| 2642126 | 2016-02-03 | 2645394 | 2016-02-03 |
| 2642181 | 2016-02-03 | 2646160 | 2016-02-03 |
| 2642833 | 2016-02-03 | 2646188 | 2016-02-10 |
| 2642911 | 2016-02-03 | 2646243 | 2016-02-03 |
| 2643069 | 2016-02-03 | 2646427 | 2016-02-03 |
| 2643133 | 2016-02-03 | 2646665 | 2016-02-03 |
| 2643148 | 2016-02-03 | 2646816 | 2016-02-03 |
| 2643205 | 2016-02-03 | 2647048 | 2016-02-03 |
| 2643217 | 2016-02-03 | 2647380 | 2016-02-03 |
| 2643364 | 2016-02-10 | 2647418 | 2016-02-10 |
| 2643389 | 2016-02-03 | 2647494 | 2016-02-03 |
| 2643470 | 2016-02-03 | 2647621 | 2016-02-03 |
| 2644073 | 2016-02-10 | 2647637 | 2016-02-03 |
| 2644176 | 2016-02-03 | 2648342 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2648577 | 2016-02-10 | 2657958 | 2016-02-10 |
| 2649338 | 2016-02-03 | 2658049 | 2016-02-10 |
| 2649483 | 2016-02-10 | 2658417 | 2016-02-03 |
| 2649884 | 2016-02-03 | 2659055 | 2016-02-10 |
| 2650188 | 2016-02-03 | 2659056 | 2016-02-10 |
| 2650876 | 2016-02-10 | 2659157 | 2016-02-03 |
| 2651595 | 2016-02-03 | 2659688 | 2016-02-10 |
| 2651679 | 2016-02-10 | 2660244 | 2016-02-10 |
| 2651751 | 2016-02-03 | 2660384 | 2016-02-10 |
| 2652971 | 2016-02-10 | 2660623 | 2016-02-03 |
| 2653073 | 2016-02-03 | 2660814 | 2016-02-03 |
| 2653640 | 2016-02-10 | 2662064 | 2016-02-10 |
| 2653653 | 2016-02-03 | 2662313 | 2016-02-10 |
| 2654193 | 2016-02-10 | 2662317 | 2016-02-03 |
| 2654474 | 2016-02-03 | 2662866 | 2016-02-03 |
| 2654660 | 2016-02-03 | 2663730 | 2016-02-03 |
| 2655330 | 2016-02-10 | 2664254 | 2016-02-03 |
| 2656466 | 2016-02-03 | 2664349 | 2016-02-03 |
| 2656933 | 2016-02-10 | 2664477 | 2016-02-10 |
| 2657403 | 2016-02-03 | 2664528 | 2016-02-03 |
| 2657753 | 2016-02-03 | 2665058 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2665059 | 2016-02-10 | 2673644 | 2016-02-10 |
| 2665287 | 2016-02-10 | 2674270 | 2016-02-03 |
| 2666577 | 2016-02-03 | 2674337 | 2016-02-10 |
| 2667214 | 2016-02-10 | 2674341 | 2016-02-10 |
| 2667638 | 2016-02-03 | 2674762 | 2016-02-10 |
| 2667977 | 2016-02-10 | 2674771 | 2016-02-10 |
| 2668958 | 2016-02-10 | 2675109 | 2016-02-03 |
| 2669027 | 2016-02-10 | 2675328 | 2016-02-10 |
| 2670373 | 2016-02-03 | 2675399 | 2016-02-03 |
| 2670540 | 2016-02-10 | 2675405 | 2016-02-10 |
| 2670699 | 2016-02-03 | 2675450 | 2016-02-10 |
| 2670848 | 2016-02-03 | 2675592 | 2016-02-10 |
| 2671709 | 2016-02-03 | 2675638 | 2016-02-10 |
| 2671917 | 2016-02-03 | 2675688 | 2016-02-10 |
| 2672268 | 2016-02-10 | 2676057 | 2016-02-03 |
| 2672945 | 2016-02-03 | 2676098 | 2016-02-03 |
| 2673007 | 2016-02-10 | 2676111 | 2016-02-03 |
| 2673016 | 2016-02-03 | 2676980 | 2016-02-03 |
| 2673097 | 2016-02-03 | 2677010 | 2016-02-10 |
| 2673304 | 2016-02-03 | 2677576 | 2016-02-10 |
| 2673594 | 2016-02-03 | 2677577 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2678213 | 2016-02-03 | 2684834 | 2016-02-10 |
| 2678466 | 2016-02-03 | 2684891 | 2016-02-03 |
| 2679358 | 2016-02-03 | 2684915 | 2016-02-10 |
| 2679586 | 2016-02-10 | 2684963 | 2016-02-03 |
| 2679877 | 2016-02-10 | 2685048 | 2016-02-10 |
| 2680498 | 2016-02-10 | 2685205 | 2016-02-03 |
| 2680585 | 2016-02-10 | 2685437 | 2016-02-03 |
| 2680608 | 2016-02-03 | 2685441 | 2016-02-03 |
| 2680635 | 2016-02-03 | 2685538 | 2016-02-03 |
| 2680683 | 2016-02-03 | 2685826 | 2016-02-03 |
| 2680995 | 2016-02-10 | 2685827 | 2016-02-03 |
| 2681039 | 2016-02-03 | 2685956 | 2016-02-03 |
| 2681790 | 2016-02-03 | 2686028 | 2016-02-10 |
| 2682080 | 2016-02-03 | 2686313 | 2016-02-03 |
| 2682233 | 2016-02-03 | 2686493 | 2016-02-03 |
| 2682710 | 2016-02-03 | 2686618 | 2016-02-03 |
| 2682711 | 2016-02-03 | 2686898 | 2016-02-10 |
| 2683001 | 2016-02-03 | 2687244 | 2016-02-03 |
| 2683289 | 2016-02-03 | 2687245 | 2016-02-10 |
| 2683605 | 2016-02-10 | 2687283 | 2016-02-10 |
| 2683987 | 2016-02-03 | 2687625 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2688806 | 2016-02-10 | 2693458 | 2016-02-03 |
| 2688881 | 2016-02-10 | 2693473 | 2016-02-03 |
| 2689320 | 2016-02-03 | 2693771 | 2016-02-03 |
| 2689754 | 2016-02-03 | 2693969 | 2016-02-03 |
| 2689908 | 2016-02-10 | 2694331 | 2016-02-03 |
| 2690047 | 2016-02-10 | 2694353 | 2016-02-03 |
| 2690051 | 2016-02-03 | 2694401 | 2016-02-03 |
| 2690216 | 2016-02-10 | 2694407 | 2016-02-10 |
| 2690266 | 2016-02-10 | 2694421 | 2016-02-03 |
| 2690808 | 2016-02-10 | 2694973 | 2016-02-03 |
| 2691066 | 2016-02-10 | 2695659 | 2016-02-03 |
| 2691168 | 2016-02-03 | 2696688 | 2016-02-03 |
| 2691221 | 2016-02-03 | 2696881 | 2016-02-03 |
| 2691424 | 2016-02-03 | 2697046 | 2016-02-10 |
| 2691674 | 2016-02-10 | 2697617 | 2016-02-03 |
| 2692058 | 2016-02-10 | 2697646 | 2016-02-10 |
| 2692255 | 2016-02-03 | 2698204 | 2016-02-03 |
| 2692427 | 2016-02-03 | 2698330 | 2016-02-03 |
| 2692450 | 2016-02-03 | 2698372 | 2016-02-03 |
| 2692599 | 2016-02-03 | 2698722 | 2016-02-03 |
| 2692692 | 2016-02-10 | 2699214 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2699232 | 2016-02-10 | 2704980 | 2016-02-03 |
| 2699506 | 2016-02-10 | 2705362 | 2016-02-10 |
| 2700142 | 2016-02-03 | 2706015 | 2016-02-03 |
| 2701632 | 2016-02-03 | 2706094 | 2016-02-10 |
| 2702104 | 2016-02-10 | 2706128 | 2016-02-03 |
| 2702150 | 2016-02-10 | 2706385 | 2016-02-10 |
| 2702247 | 2016-02-03 | 2706486 | 2016-02-03 |
| 2702296 | 2016-02-10 | 2706961 | 2016-02-03 |
| 2702424 | 2016-02-10 | 2707094 | 2016-02-03 |
| 2702594 | 2016-02-03 | 2707175 | 2016-02-10 |
| 2702714 | 2016-02-10 | 2707185 | 2016-02-10 |
| 2702801 | 2016-02-10 | 2707286 | 2016-02-10 |
| 2703233 | 2016-02-03 | 2707368 | 2016-02-03 |
| 2703307 | 2016-02-10 | 2707723 | 2016-02-10 |
| 2703318 | 2016-02-03 | 2707781 | 2016-02-03 |
| 2703568 | 2016-02-10 | 2707988 | 2016-02-10 |
| 2703718 | 2016-02-10 | 2708189 | 2016-02-10 |
| 2704004 | 2016-02-03 | 2708221 | 2016-02-03 |
| 2704365 | 2016-02-03 | 2708793 | 2016-02-03 |
| 2704544 | 2016-02-03 | 2709200 | 2016-02-10 |
| 2704672 | 2016-02-10 | 2709275 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2709595 | 2016-02-03 | 2714379 | 2016-02-03 |
| 2709914 | 2016-02-03 | 2714404 | 2016-02-10 |
| 2709941 | 2016-02-10 | 2714552 | 2016-02-10 |
| 2710330 | 2016-02-10 | 2714569 | 2016-02-03 |
| 2710601 | 2016-02-03 | 2714607 | 2016-02-03 |
| 2711242 | 2016-02-10 | 2714789 | 2016-02-03 |
| 2711311 | 2016-02-10 | 2715061 | 2016-02-10 |
| 2711464 | 2016-02-03 | 2715087 | 2016-02-03 |
| 2711500 | 2016-02-10 | 2715153 | 2016-02-10 |
| 2711505 | 2016-02-10 | 2715554 | 2016-02-03 |
| 2711587 | 2016-02-10 | 2716112 | 2016-02-03 |
| 2711719 | 2016-02-03 | 2716170 | 2016-02-03 |
| 2711836 | 2016-02-03 | 2716175 | 2016-02-03 |
| 2712085 | 2016-02-03 | 2716254 | 2016-02-10 |
| 2712508 | 2016-02-03 | 2716277 | 2016-02-10 |
| 2712826 | 2016-02-10 | 2716380 | 2016-02-10 |
| 2713551 | 2016-02-03 | 2716609 | 2016-02-03 |
| 2713656 | 2016-02-10 | 2716791 | 2016-02-10 |
| 2713795 | 2016-02-10 | 2717453 | 2016-02-10 |
| 2714164 | 2016-02-03 | 2718090 | 2016-02-03 |
| 2714301 | 2016-02-03 | 2718156 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2718190 | 2016-02-03 | 2722985 | 2016-02-10 |
| 2718224 | 2016-02-03 | 2723169 | 2016-02-03 |
| 2718386 | 2016-02-03 | 2723222 | 2016-02-10 |
| 2718520 | 2016-02-10 | 2723642 | 2016-02-03 |
| 2718735 | 2016-02-03 | 2723818 | 2016-02-10 |
| 2718807 | 2016-02-10 | 2724054 | 2016-02-10 |
| 2719046 | 2016-02-10 | 2724068 | 2016-02-03 |
| 2719258 | 2016-02-03 | 2724111 | 2016-02-03 |
| 2719324 | 2016-02-03 | 2724579 | 2016-02-10 |
| 2719650 | 2016-02-10 | 2724902 | 2016-02-10 |
| 2720345 | 2016-02-10 | 2724958 | 2016-02-10 |
| 2720597 | 2016-02-03 | 2724959 | 2016-02-10 |
| 2720853 | 2016-02-10 | 2724993 | 2016-02-03 |
| 2721413 | 2016-02-03 | 2725053 | 2016-02-10 |
| 2722213 | 2016-02-10 | 2725424 | 2016-02-10 |
| 2722529 | 2016-02-03 | 2725507 | 2016-02-10 |
| 2722596 | 2016-02-10 | 2725894 | 2016-02-10 |
| 2722760 | 2016-02-03 | 2725948 | 2016-02-10 |
| 2722765 | 2016-02-03 | 2726124 | 2016-02-10 |
| 2722842 | 2016-02-03 | 2726144 | 2016-02-10 |
| 2722845 | 2016-02-10 | 2726224 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2726239 | 2016-02-10 | 2729627 | 2016-02-10 |
| 2726265 | 2016-02-10 | 2729796 | 2016-02-10 |
| 2726764 | 2016-02-03 | 2729920 | 2016-02-03 |
| 2727132 | 2016-02-03 | 2729941 | 2016-02-10 |
| 2727705 | 2016-02-03 | 2730170 | 2016-02-10 |
| 2727852 | 2016-02-03 | 2730314 | 2016-02-03 |
| 2728071 | 2016-02-03 | 2730378 | 2016-02-10 |
| 2728114 | 2016-02-10 | 2730425 | 2016-02-03 |
| 2728119 | 2016-02-03 | 2730622 | 2016-02-03 |
| 2728241 | 2016-02-03 | 2730731 | 2016-02-03 |
| 2728564 | 2016-02-10 | 2730877 | 2016-02-10 |
| 2728573 | 2016-02-03 | 2730954 | 2016-02-03 |
| 2728814 | 2016-02-10 | 2731033 | 2016-02-03 |
| 2728826 | 2016-02-03 | 2731213 | 2016-02-03 |
| 2728999 | 2016-02-03 | 2731220 | 2016-02-10 |
| 2729027 | 2016-02-10 | 2731356 | 2016-02-03 |
| 2729036 | 2016-02-10 | 2731441 | 2016-02-10 |
| 2729088 | 2016-02-03 | 2731496 | 2016-02-10 |
| 2729316 | 2016-02-03 | 2731791 | 2016-02-03 |
| 2729393 | 2016-02-03 | 2731959 | 2016-02-03 |
| 2729431 | 2016-02-10 | 2732325 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2732560 | 2016-02-10 | 2738032 | 2016-02-03 |
| 2732601 | 2016-02-03 | 2738117 | 2016-02-10 |
| 2733274 | 2016-02-03 | 2738124 | 2016-02-03 |
| 2733322 | 2016-02-10 | 2738267 | 2016-02-10 |
| 2733539 | 2016-02-03 | 2738538 | 2016-02-10 |
| 2733734 | 2016-02-03 | 2738572 | 2016-02-03 |
| 2734392 | 2016-02-10 | 2738576 | 2016-02-03 |
| 2734858 | 2016-02-10 | 2738610 | 2016-02-03 |
| 2735043 | 2016-02-03 | 2738613 | 2016-02-03 |
| 2735055 | 2016-02-10 | 2738747 | 2016-02-03 |
| 2735246 | 2016-02-10 | 2738815 | 2016-02-10 |
| 2735429 | 2016-02-10 | 2739210 | 2016-02-10 |
| 2735653 | 2016-02-10 | 2739701 | 2016-02-10 |
| 2736124 | 2016-02-03 | 2739886 | 2016-02-10 |
| 2736639 | 2016-02-10 | 2740042 | 2016-02-03 |
| 2737122 | 2016-02-03 | 2740245 | 2016-02-03 |
| 2737181 | 2016-02-10 | 2740343 | 2016-02-03 |
| 2737552 | 2016-02-03 | 2740619 | 2016-02-03 |
| 2737877 | 2016-02-03 | 2740708 | 2016-02-03 |
| 2738007 | 2016-02-03 | 2741323 | 2016-02-03 |
| 2738031 | 2016-02-03 | 2741655 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2741868 | 2016-02-03 | 2746176 | 2016-02-03 |
| 2742160 | 2016-02-10 | 2746362 | 2016-02-03 |
| 2742281 | 2016-02-10 | 2746439 | 2016-02-03 |
| 2742787 | 2016-02-03 | 2746617 | 2016-02-03 |
| 2742951 | 2016-02-03 | 2747351 | 2016-02-03 |
| 2743103 | 2016-02-03 | 2748083 | 2016-02-10 |
| 2743587 | 2016-02-03 | 2748086 | 2016-02-03 |
| 2743649 | 2016-02-03 | 2748489 | 2016-02-10 |
| 2743658 | 2016-02-10 | 2748503 | 2016-02-10 |
| 2743782 | 2016-02-03 | 2748507 | 2016-02-03 |
| 2743949 | 2016-02-10 | 2748877 | 2016-02-10 |
| 2744194 | 2016-02-10 | 2749932 | 2016-02-03 |
| 2744221 | 2016-02-10 | 2749959 | 2016-02-03 |
| 2744636 | 2016-02-03 | 2750067 | 2016-02-03 |
| 2744727 | 2016-02-10 | 2750081 | 2016-02-03 |
| 2744796 | 2016-02-03 | 2750581 | 2016-02-10 |
| 2744925 | 2016-02-03 | 2750609 | 2016-02-03 |
| 2745040 | 2016-02-10 | 2750813 | 2016-02-10 |
| 2745304 | 2016-02-03 | 2750867 | 2016-02-03 |
| 2745757 | 2016-02-10 | 2750870 | 2016-02-03 |
| 2746129 | 2016-02-03 | 2750994 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2751486 | 2016-02-10 | 2759246 | 2016-02-03 |
| 2753116 | 2016-02-03 | 2759552 | 2016-02-10 |
| 2753204 | 2016-02-10 | 2759555 | 2016-02-03 |
| 2753283 | 2016-02-03 | 2759557 | 2016-02-03 |
| 2753558 | 2016-02-03 | 2760220 | 2016-02-10 |
| 2753567 | 2016-02-10 | 2760623 | 2016-02-03 |
| 2753576 | 2016-02-03 | 2760649 | 2016-02-10 |
| 2753602 | 2016-02-10 | 2760780 | 2016-02-03 |
| 2753674 | 2016-02-10 | 2761016 | 2016-02-03 |
| 2753766 | 2016-02-03 | 2761078 | 2016-02-03 |
| 2753783 | 2016-02-10 | 2761099 | 2016-02-10 |
| 2753857 | 2016-02-10 | 2761295 | 2016-02-10 |
| 2754139 | 2016-02-03 | 2761687 | 2016-02-03 |
| 2754691 | 2016-02-10 | 2762204 | 2016-02-03 |
| 2755532 | 2016-02-03 | 2762784 | 2016-02-03 |
| 2756184 | 2016-02-03 | 2763141 | 2016-02-03 |
| 2756968 | 2016-02-10 | 2763451 | 2016-02-10 |
| 2757607 | 2016-02-10 | 2763947 | 2016-02-10 |
| 2758157 | 2016-02-03 | 2764151 | 2016-02-03 |
| 2758584 | 2016-02-10 | 2764264 | 2016-02-10 |
| 2758588 | 2016-02-03 | 2764529 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2765070 | 2016-02-03 | 2769995 | 2016-02-03 |
| 2765794 | 2016-02-10 | 2770319 | 2016-02-03 |
| 2766149 | 2016-02-10 | 2770368 | 2016-02-03 |
| 2766165 | 2016-02-10 | 2770560 | 2016-02-03 |
| 2766342 | 2016-02-10 | 2770684 | 2016-02-10 |
| 2766519 | 2016-02-10 | 2770869 | 2016-02-03 |
| 2766715 | 2016-02-03 | 2771079 | 2016-02-03 |
| 2766750 | 2016-02-03 | 2771164 | 2016-02-03 |
| 2766884 | 2016-02-03 | 2771495 | 2016-02-03 |
| 2767037 | 2016-02-03 | 2771528 | 2016-02-03 |
| 2767108 | 2016-02-03 | 2771889 | 2016-02-10 |
| 2767368 | 2016-02-10 | 2772320 | 2016-02-03 |
| 2767578 | 2016-02-03 | 2772573 | 2016-02-03 |
| 2767596 | 2016-02-10 | 2773002 | 2016-02-10 |
| 2767989 | 2016-02-10 | 2773147 | 2016-02-03 |
| 2768102 | 2016-02-10 | 2773320 | 2016-02-03 |
| 2768686 | 2016-02-10 | 2773331 | 2016-02-10 |
| 2768988 | 2016-02-03 | 2773514 | 2016-02-03 |
| 2769360 | 2016-02-03 | 2773527 | 2016-02-03 |
| 2769771 | 2016-02-10 | 2773806 | 2016-02-03 |
| 2769938 | 2016-02-10 | 2773831 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2773951 | 2016-02-10 | 2776237 | 2016-02-03 |
| 2774001 | 2016-02-03 | 2776260 | 2016-02-03 |
| 2774245 | 2016-02-03 | 2776270 | 2016-02-03 |
| 2774430 | 2016-02-03 | 2776276 | 2016-02-03 |
| 2774527 | 2016-02-03 | 2776327 | 2016-02-03 |
| 2774550 | 2016-02-03 | 2776348 | 2016-02-10 |
| 2774845 | 2016-02-10 | 2776360 | 2016-02-03 |
| 2774877 | 2016-02-03 | 2776409 | 2016-02-03 |
| 2774938 | 2016-02-03 | 2776415 | 2016-02-03 |
| 2774951 | 2016-02-03 | 2776443 | 2016-02-03 |
| 2775189 | 2016-02-03 | 2776488 | 2016-02-03 |
| 2775251 | 2016-02-03 | 2776598 | 2016-02-03 |
| 2775258 | 2016-02-03 | 2776686 | 2016-02-03 |
| 2775676 | 2016-02-03 | 2776725 | 2016-02-03 |
| 2775732 | 2016-02-03 | 2776733 | 2016-02-10 |
| 2775795 | 2016-02-10 | 2776770 | 2016-02-10 |
| 2775888 | 2016-02-03 | 2776840 | 2016-02-03 |
| 2775909 | 2016-02-03 | 2776874 | 2016-02-03 |
| 2775922 | 2016-02-03 | 2776898 | 2016-02-03 |
| 2775964 | 2016-02-03 | 2777088 | 2016-02-10 |
| 2776222 | 2016-02-03 | 2777090 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2777112 | 2016-02-03 | 2780359 | 2016-02-03 |
| 2777252 | 2016-02-10 | 2780382 | 2016-02-03 |
| 2777968 | 2016-02-10 | 2780616 | 2016-02-10 |
| 2778008 | 2016-02-03 | 2780730 | 2016-02-03 |
| 2778053 | 2016-02-03 | 2780735 | 2016-02-03 |
| 2778196 | 2016-02-03 | 2781042 | 2016-02-10 |
| 2778297 | 2016-02-03 | 2781333 | 2016-02-03 |
| 2778441 | 2016-02-10 | 2781363 | 2016-02-03 |
| 2779872 | 2016-02-03 | 2781436 | 2016-02-03 |
| 2779878 | 2016-02-03 | 2781441 | 2016-02-03 |
| 2779891 | 2016-02-10 | 2782292 | 2016-02-10 |
| 2779964 | 2016-02-03 | 2782443 | 2016-02-10 |
| 2780070 | 2016-02-03 | 2782508 | 2016-02-03 |
| 2780107 | 2016-02-03 | 2782530 | 2016-02-03 |
| 2780130 | 2016-02-10 | 2782638 | 2016-02-03 |
| 2780131 | 2016-02-03 | 2782666 | 2016-02-03 |
| 2780168 | 2016-02-03 | 2782689 | 2016-02-03 |
| 2780216 | 2016-02-03 | 2782785 | 2016-02-03 |
| 2780264 | 2016-02-03 | 2782815 | 2016-02-10 |
| 2780270 | 2016-02-03 | 2782879 | 2016-02-03 |
| 2780325 | 2016-02-03 | 2782910 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2782939 | 2016-02-03 | 2784943 | 2016-02-03 |
| 2783045 | 2016-02-03 | 2785230 | 2016-02-03 |
| 2783066 | 2016-02-03 | 2785285 | 2016-02-03 |
| 2783090 | 2016-02-03 | 2785312 | 2016-02-03 |
| 2783091 | 2016-02-03 | 2785461 | 2016-02-03 |
| 2783101 | 2016-02-03 | 2785482 | 2016-02-03 |
| 2783117 | 2016-02-03 | 2785484 | 2016-02-03 |
| 2783157 | 2016-02-03 | 2785515 | 2016-02-03 |
| 2783164 | 2016-02-03 | 2785535 | 2016-02-10 |
| 2783207 | 2016-02-03 | 2785541 | 2016-02-03 |
| 2783227 | 2016-02-03 | 2785576 | 2016-02-03 |
| 2783238 | 2016-02-03 | 2785614 | 2016-02-10 |
| 2783407 | 2016-02-03 | 2785669 | 2016-02-03 |
| 2783415 | 2016-02-10 | 2785697 | 2016-02-03 |
| 2783500 | 2016-02-03 | 2785785 | 2016-02-03 |
| 2783552 | 2016-02-03 | 2785880 | 2016-02-03 |
| 2783926 | 2016-02-03 | 2785904 | 2016-02-10 |
| 2784026 | 2016-02-03 | 2786028 | 2016-02-03 |
| 2784118 | 2016-02-03 | 2786049 | 2016-02-03 |
| 2784122 | 2016-02-10 | 2786059 | 2016-02-10 |
| 2784421 | 2016-02-03 | 2786207 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2786316 | 2016-02-03 | 2788479 | 2016-02-10 |
| 2786363 | 2016-02-03 | 2788522 | 2016-02-03 |
| 2786436 | 2016-02-03 | 2788631 | 2016-02-10 |
| 2786473 | 2016-02-10 | 2788696 | 2016-02-03 |
| 2786540 | 2016-02-03 | 2788900 | 2016-02-03 |
| 2786545 | 2016-02-03 | 2788923 | 2016-02-03 |
| 2786618 | 2016-02-10 | 2789046 | 2016-02-03 |
| 2786911 | 2016-02-03 | 2789174 | 2016-02-10 |
| 2786979 | 2016-02-03 | 2789208 | 2016-02-03 |
| 2787040 | 2016-02-03 | 2789541 | 2016-02-10 |
| 2787523 | 2016-02-10 | 2789782 | 2016-02-03 |
| 2787887 | 2016-02-10 | 2789786 | 2016-02-10 |
| 2787956 | 2016-02-03 | 2789801 | 2016-02-03 |
| 2788133 | 2016-02-03 | 2789846 | 2016-02-03 |
| 2788197 | 2016-02-03 | 2790061 | 2016-02-10 |
| 2788201 | 2016-02-03 | 2790151 | 2016-02-10 |
| 2788208 | 2016-02-03 | 2790189 | 2016-02-03 |
| 2788256 | 2016-02-03 | 2790200 | 2016-02-03 |
| 2788274 | 2016-02-03 | 2790495 | 2016-02-03 |
| 2788309 | 2016-02-03 | 2790848 | 2016-02-03 |
| 2788426 | 2016-02-10 | 2790872 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2790985 | 2016-02-03 | 2793489 | 2016-02-10 |
| 2791161 | 2016-02-10 | 2793542 | 2016-02-03 |
| 2791303 | 2016-02-03 | 2794046 | 2016-02-03 |
| 2791306 | 2016-02-03 | 2794109 | 2016-02-03 |
| 2791371 | 2016-02-03 | 2794392 | 2016-02-03 |
| 2791401 | 2016-02-03 | 2794417 | 2016-02-03 |
| 2791418 | 2016-02-03 | 2794504 | 2016-02-10 |
| 2791552 | 2016-02-03 | 2794546 | 2016-02-03 |
| 2791934 | 2016-02-10 | 2794833 | 2016-02-03 |
| 2791999 | 2016-02-10 | 2794933 | 2016-02-03 |
| 2792042 | 2016-02-03 | 2795155 | 2016-02-10 |
| 2792275 | 2016-02-03 | 2795199 | 2016-02-03 |
| 2792512 | 2016-02-03 | 2795474 | 2016-02-03 |
| 2792579 | 2016-02-03 | 2795577 | 2016-02-03 |
| 2792588 | 2016-02-03 | 2795649 | 2016-02-03 |
| 2792837 | 2016-02-03 | 2795765 | 2016-02-10 |
| 2792893 | 2016-02-10 | 2796064 | 2016-02-03 |
| 2792920 | 2016-02-03 | 2796277 | 2016-02-03 |
| 2793013 | 2016-02-10 | 2796320 | 2016-02-03 |
| 2793297 | 2016-02-03 | 2796871 | 2016-02-03 |
| 2793352 | 2016-02-03 | 2797295 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2797476 | 2016-02-10 | 2803764 | 2016-02-03 |
| 2797822 | 2016-02-03 | 2803929 | 2016-02-10 |
| 2797827 | 2016-02-03 | 2804004 | 2016-02-03 |
| 2797969 | 2016-02-10 | 2804380 | 2016-02-03 |
| 2798109 | 2016-02-03 | 2804690 | 2016-02-03 |
| 2798111 | 2016-02-10 | 2804902 | 2016-02-03 |
| 2798650 | 2016-02-03 | 2805321 | 2016-02-03 |
| 2798937 | 2016-02-10 | 2805890 | 2016-02-03 |
| 2799382 | 2016-02-03 | 2805912 | 2016-02-03 |
| 2800666 | 2016-02-10 | 2805918 | 2016-02-03 |
| 2801058 | 2016-02-10 | 2806047 | 2016-02-03 |
| 2801383 | 2016-02-03 | 2806108 | 2016-02-10 |
| 2801559 | 2016-02-03 | 2808057 | 2016-02-03 |
| 2801960 | 2016-02-03 | 2808237 | 2016-02-03 |
| 2802036 | 2016-02-03 | 2809113 | 2016-02-03 |
| 2803069 | 2016-02-03 | 2809190 | 2016-02-03 |
| 2803082 | 2016-02-03 | 2811362 | 2016-02-03 |
| 2803452 | 2016-02-03 | 2811972 | 2016-02-03 |
| 2803509 | 2016-02-03 | 2812060 | 2016-02-03 |
| 2803620 | 2016-02-03 | 2812315 | 2016-02-03 |
| 2803716 | 2016-02-03 | 2812317 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2812486 | 2016-02-03 | 2815776 | 2016-02-03 |
| 2812590 | 2016-02-10 | 2815841 | 2016-02-10 |
| 2812592 | 2016-02-03 | 2815960 | 2016-02-10 |
| 2812637 | 2016-02-03 | 2816238 | 2016-02-10 |
| 2812689 | 2016-02-03 | 2816338 | 2016-02-03 |
| 2813033 | 2016-02-03 | 2816876 | 2016-02-03 |
| 2813094 | 2016-02-03 | 2816951 | 2016-02-03 |
| 2813769 | 2016-02-03 | 2817456 | 2016-02-03 |
| 2813973 | 2016-02-03 | 2817722 | 2016-02-10 |
| 2814078 | 2016-02-10 | 2817803 | 2016-02-03 |
| 2814293 | 2016-02-03 | 2817828 | 2016-02-10 |
| 2814645 | 2016-02-10 | 2818311 | 2016-02-03 |
| 2814749 | 2016-02-10 | 2818403 | 2016-02-10 |
| 2814750 | 2016-02-10 | 2818573 | 2016-02-03 |
| 2814751 | 2016-02-10 | 2819132 | 2016-02-10 |
| 2814778 | 2016-02-03 | 2819294 | 2016-02-03 |
| 2814994 | 2016-02-10 | 2820732 | 2016-02-03 |
| 2815088 | 2016-02-10 | 2820911 | 2016-02-03 |
| 2815399 | 2016-02-10 | 2821031 | 2016-02-03 |
| 2815528 | 2016-02-10 | 2821203 | 2016-02-10 |
| 2815705 | 2016-02-03 | 2821228 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2821315 | 2016-02-03 | 2826900 | 2016-02-10 |
| 2821478 | 2016-02-10 | 2827173 | 2016-02-03 |
| 2821551 | 2016-02-10 | 2827200 | 2016-02-03 |
| 2821584 | 2016-02-03 | 2827741 | 2016-02-03 |
| 2821597 | 2016-02-10 | 2827962 | 2016-02-03 |
| 2822151 | 2016-02-03 | 2828052 | 2016-02-03 |
| 2822241 | 2016-02-10 | 2828092 | 2016-02-03 |
| 2822817 | 2016-02-03 | 2828119 | 2016-02-03 |
| 2822905 | 2016-02-03 | 2828166 | 2016-02-03 |
| 2823219 | 2016-02-03 | 2828428 | 2016-02-03 |
| 2823856 | 2016-02-03 | 2828724 | 2016-02-03 |
| 2824671 | 2016-02-03 | 2828916 | 2016-02-10 |
| 2825045 | 2016-02-03 | 2829410 | 2016-02-03 |
| 2825050 | 2016-02-03 | 2830888 | 2016-02-03 |
| 2825081 | 2016-02-03 | 2830958 | 2016-02-03 |
| 2825088 | 2016-02-03 | 2830986 | 2016-02-03 |
| 2825857 | 2016-02-10 | 2831122 | 2016-02-03 |
| 2825933 | 2016-02-10 | 2831972 | 2016-02-03 |
| 2826318 | 2016-02-03 | 2832471 | 2016-02-03 |
| 2826637 | 2016-02-03 | 2833759 | 2016-02-03 |
| 2826736 | 2016-02-03 | 2835179 | 2016-02-10 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data | (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|---|---|
| 2835486 | 2016-02-03 | 2851602 | 2016-02-03 |
| 2837412 | 2016-02-10 | 2852765 | 2016-02-03 |
| 2837549 | 2016-02-03 | 2853847 | 2016-02-03 |
| 2837825 | 2016-02-10 | 2854304 | 2016-02-03 |
| 2838807 | 2016-02-03 | 2854585 | 2016-02-03 |
| 2840408 | 2016-02-10 | 2856741 | 2016-02-03 |
| 2841296 | 2016-02-03 | 2857228 | 2016-02-03 |
| 2841873 | 2016-02-03 | 2857916 | 2016-02-03 |
| 2842785 | 2016-02-03 | 2861935 | 2016-02-10 |
| 2842902 | 2016-02-03 | 2862685 | 2016-02-03 |
| 2843373 | 2016-02-03 | 2865302 | 2016-02-03 |
| 2844565 | 2016-02-10 | 2865767 | 2016-02-03 |
| 2846504 | 2016-02-10 | 2865992 | 2016-02-03 |
| 2846513 | 2016-02-03 | 2868379 | 2016-02-03 |
| 2847911 | 2016-02-03 | 2868420 | 2016-02-03 |
| 2848038 | 2016-02-03 | 2868779 | 2016-02-03 |
| 2848506 | 2016-02-03 | 2870999 | 2016-02-03 |
| 2849218 | 2016-02-03 | 2871024 | 2016-02-03 |
| 2850710 | 2016-02-10 | 2871431 | 2016-02-03 |
| 2850731 | 2016-02-03 | 2872016 | 2016-02-03 |
| 2851450 | 2016-02-03 | 2873637 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|
| 2873695 | 2016-02-03 |
| 2873779 | 2016-02-03 |
| 2874851 | 2016-02-03 |
| 2875879 | 2016-02-03 |
| 2878510 | 2016-02-03 |
| 2879077 | 2016-02-03 |
| 2879252 | 2016-02-03 |
| 2881214 | 2016-02-03 |
| 2886457 | 2016-02-03 |
| 2887980 | 2016-02-03 |
| 2890583 | 2016-02-03 |
| 2893387 | 2016-02-03 |
| 2895282 | 2016-02-03 |
| 2900076 | 2016-02-03 |
| 2903086 | 2016-02-03 |
| 2905365 | 2016-02-03 |
| 2907528 | 2016-02-03 |
| 2908264 | 2016-02-03 |
| 2908602 | 2016-02-03 |
| 2914673 | 2016-02-03 |
| 2915922 | 2016-02-03 |

| (11) EPO paskelbimo numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|
| 2917608 | 2016-02-03 |
| 2918060 | 2016-02-10 |
| 2918523 | 2016-02-03 |
| 2925743 | 2016-02-03 |

## *Paraiškos papildomos apsaugos liudijimui gauti, paskelbtos pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 37 straipsnį*

*(68)* **2404919**
*(21)* PA 2016 015
*(22)* 2016-05-13
*(71)* Vertex Pharmaceuticals Inc., 50 Northern Avenue, Boston, MA 02210, US
*(54)* Heterociklinis junginys, tinkamas panaudoti kaip ATP-rišančių kasečių transporterių moduliatorius
*(93)* EU/1/15/1059, 2015-11-19
*(95)* Lumakaftoras/ivakaftoras

---

*(68)* **1934174**
*(21)* PA 2016 016
*(22)* 2016-05-17
*(71)* Exelixis, Inc., 210 East Grand Avenue, South San Francisco, California 94080, US
*(54)* Azetinidai kaip MEK inhibitoriai, skirti proliferacinių ligų gydymui
*(93)* EU/1/15/1048, 2015-11-20
*(95)* Kobimetinibas

---

*(68)* **1948158**
*(21)* PA 2016 017
*(22)* 2016-05-17
*(71)* Novartis Pharma AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH
*(54)* Angiotenzino receptoriaus antagonisto ir NEP inhibitoriaus farmaciniai deriniai
*(93)* EU/1/15/1058, 2015-11-19
*(95)* Sakubitrilas/valsartanas

---

*(68)* **2101777**
*(21)* PA 2016 018
*(22)* 2016-05-20
*(71)* Gilead Sciences, Inc., 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US
*(54)* Kompozicija, skirta plaučių hipertenzijos gydymui
*(93)* EU/1/08/451 (001-004), 2015-11-20
*(95)* Ambrisentanas

---

## *Papildomos apsaugos liudijimai, paskelbti pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 37 straipsnį*

*(11)* **C 2213661**
*(94)* 2029-03-26
*(21)* PA 2014 033
*(22)* 2014-08-26
*(68)* 2213661
*(93)* EU/1/13/890/001 - EU/1/13/890/003, 2014-03-21
*(95)* Kabozantinibas ir jo farmaciniu požiūriu priimtinos druskos
*(24)* 2024-09-25
*(73)* Exelixis, Inc., 210 East Grand Avenue, South San Francisco, California 94080, US
*(74)* Genė Ona SRUOGIENĖ, 12, UAB TARPINĖ, A.P.Kavoliuko g. 24-152, LT-04328 Vilnius, LT
*(54)* c-Met moduliatoriai ir panaudojimo būdai
*Paraiškos liudijimui gauti paskelbimo data*
2014-09-25

---

*(11)* **C 1884242**
*(94)* 2029-03-27
*(21)* PA 2014 034
*(22)* 2014-09-19
*(68)* 1884242
*(93)* EU/1/14/913, 2014-03-21
*(95)* Lurasidonum
*(24)* 2026-05-27
*(73)* Sumitomo Dainippon Pharma Co., Ltd., 6-8, Dosho-machi 2-chome Chuo-ku, Osaka-shi Osaka 541-8524, JP
*(74)* Tatjana STERLINA, 37, UAB “Intels”, Naugarduko g. 32/2, LT-03225 Vilnius, LT
*(54)* Farmacinė kompozicija, apimanti lurasidoną
*Paraiškos liudijimui gauti paskelbimo data*
2014-09-27

---

*(11)* **C 1761528**
*(94)* 2029-07-02
*(21)* PA 2014 039
*(22)* 2014-11-12
*(68)* 1761528
*(93)* EU/1/14/931/01-06, 2014-06-30
*(95)* Trametinibas
*(24)* 2025-06-11
*(73)* Japan Tobacco, Inc., 2-1, Toranomon 2-chome, Minato-ku, Tokyo 105-8422, JP
*(74)* Reda ŽABOLIENĖ, 7, Advokatų profesinė bendrija “Žabolienė ir partneriai METIDA”, Verslo centras VERTAS, Gynėjų g. 16, LT-01109 Vilnius, LT
*(54)* 5-Amino-2,4,7-triokso-3,4,7,8-tetrahidro-2H-pirido [2,3-D]pirimidino dariniai ir gimininigi junginiai, skirti vėžio gydymui
*Paraiškos liudijimui gauti paskelbimo data*
2014-09-29

---

## *Sprendimai neišduoti papildomos apsaugos liudijimo, pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 37 straipsnį*

| PAL numeris | Pripažinimo negaliojančiu data |
|---|---|
| C 1023834 | 2016 05 25 |

## *Papildomos apsaugos liudijimo perleidimas pagal Lietuvos Respublikos patentų įstatymo 37 straipsnį*

(11) C 1244647

(54) Chinazolino dariniai - VEGF slopikliai

Perėmejo pavadinimas/vardas, pavardė, adresas, valstybės kodas, sutarties data

(73) Genzyme Corporation, 500 Kendall Street, Cambridge, MA 02142, US

2016-05-20

# *Atitaisymai*

*(11)* **C 0823900**
*(21)* PA 2009 009
*(22)* 2009-12-16
*(95)* Gefitinibum
*Biuro atitaisymas*
Paskelbta: Išradimai. Dizainas. Prekių ženklai 2010 / 9,.260 puslapis
*(94)* 2021-04-24
*(15)* *Atitaisymas*
*(94)* 2019-03-02
*(48)* 2016-06-10

# SISTEMINĖ EUROPOS PATENTŲ RODYKLĖ

| (51) | (11) |
|---|---|
| A01B 35/26 | 2592918 |
| A01K 31/16 | 2410844 |
| A01N 43/42 | 2282636 |
| A01N 43/56 | 2699563 |
| A01N 43/58 | 2699563 |
| A01N 43/707 | 2542538 |
| A01N 43/707 | 2785708 |
| A01N 43/80 | 2542538 |
| A01N 43/84 | 2542538 |
| A01N 47/02 | 2542538 |
| A01P 13/02 | 2542538 |
| A23L 33/105 | 2473065 |
| A24D 1/00 | 2775865 |
| A24D 3/04 | 2775865 |
| A24D 3/06 | 2775865 |
| A24F 47/00 | 2770860 |
| A24F 47/00 | 2797445 |
| A45C 5/03 | 2117372 |
| A45C 13/10 | 2117372 |
| A47B 81/06 | 2823732 |
| A47B 96/20 | 2823732 |
| A47J 31/06 | 2566784 |
| A61J 1/05 | 2731577 |
| A61J 1/14 | 2731577 |
| A61K 8/27 | 2257266 |

| (51) | (11) |
|---|---|
| A61K 8/35 | 2257266 |
| A61K 8/49 | 2257266 |
| A61K 8/67 | 2257266 |
| A61K 8/73 | 2257266 |
| A61K 9/00 | 2611415 |
| A61K 9/00 | 2727582 |
| A61K 9/06 | 2440199 |
| A61K 9/08 | 2611415 |
| A61K 9/10 | 1731138 |
| A61K 9/10 | 2723320 |
| A61K 9/107 | 1814520 |
| A61K 9/48 | 1814520 |
| A61K 31/122 | 2051706 |
| A61K 31/122 | 2723320 |
| A61K 31/167 | 2146704 |
| A61K 31/167 | 2727582 |
| A61K 31/195 | 2440199 |
| A61K 31/22 | 2215124 |
| A61K 31/221 | 2440199 |
| A61K 31/33 | 2399583 |
| A61K 31/337 | 2636736 |
| A61K 31/343 | 1731138 |
| A61K 31/352 | 1731138 |
| A61K 31/366 | 2215124 |
| A61K 31/40 | 2215124 |

| (51) | (11) |
|---|---|
| A61K 31/4025 | 2315591 |
| A61K 31/4025 | 2784075 |
| A61K 31/404 | 2410844 |
| A61K 31/4045 | 1859798 |
| A61K 31/405 | 2215124 |
| A61K 31/415 | 2531191 |
| A61K 31/416 | 2505586 |
| A61K 31/416 | 2531191 |
| A61K 31/4164 | 2772482 |
| A61K 31/4178 | 2505586 |
| A61K 31/4178 | 2772482 |
| A61K 31/4178 | 2784075 |
| A61K 31/4196 | 2531191 |
| A61K 31/4196 | 2772482 |
| A61K 31/422 | 2505586 |
| A61K 31/426 | 2695881 |
| A61K 31/427 | 2505586 |
| A61K 31/433 | 2505586 |
| A61K 31/435 | 2787345 |
| A61K 31/437 | 2505586 |
| A61K 31/438 | 2410844 |
| A61K 31/439 | 2636736 |
| A61K 31/44 | 2215124 |
| A61K 31/4402 | 1859798 |
| A61K 31/4402 | 2695881 |
| A61K 31/4406 | 1859798 |
| A61K 31/4409 | 1859798 |
| A61K 31/4427 | 2611415 |
| A61K 31/4439 | 2505586 |
| A61K 31/4439 | 2611415 |
| A61K 31/4439 | 2772482 |
| A61K 31/444 | 2772482 |
| A61K 31/445 | 2246345 |
| A61K 31/452 | 2246345 |
| A61K 31/454 | 2505586 |
| A61K 31/454 | 2772482 |
| A61K 31/4545 | 2636736 |
| A61K 31/4545 | 2695881 |
| A61K 31/4545 | 2772482 |
| A61K 31/46 | 2772482 |
| A61K 31/47 | 2215124 |
| A61K 31/4709 | 1731138 |
| A61K 31/4709 | 2246345 |
| A61K 31/4725 | 2772482 |
| A61K 31/4745 | 1814520 |
| A61K 31/4745 | 2636736 |
| A61K 31/475 | 2636736 |
| A61K 31/495 | 2695881 |
| A61K 31/496 | 2505586 |
| A61K 31/496 | 2695881 |
| A61K 31/496 | 2772482 |
| A61K 31/497 | 1731138 |
| A61K 31/498 | 2822954 |
| A61K 31/4995 | 2637663 |
| A61K 31/505 | 2215124 |
| A61K 31/505 | 2695881 |

| (51) | (11) | (51) | (11) |
|---|---|---|---|
| A61K 31/506 | 1859798 | A61K 31/69 | 2632927 |
| A61K 31/506 | 2695881 | A61K 31/69 | 2637663 |
| A61K 31/506 | 2748151 | A61K 31/7048 | 1731138 |
| A61K 31/513 | 2636736 | A61K 31/706 | 2637663 |
| A61K 31/513 | 2637663 | A61K 31/7068 | 2637663 |
| A61K 31/517 | 2637663 | A61K 31/7072 | 2637663 |
| A61K 31/519 | 2096919 | A61K 31/737 | 2303930 |
| A61K 31/519 | 2637663 | A61K 36/28 | 2473065 |
| A61K 31/529 | 2822954 | A61K 38/00 | 2147116 |
| A61K 31/537 | 2772482 | A61K 38/00 | 2225261 |
| A61K 31/537 | 2822954 | A61K 38/05 | 2225261 |
| A61K 31/5377 | 2096919 | A61K 38/06 | 2225261 |
| A61K 31/5377 | 2505586 | A61K 38/15 | 2637663 |
| A61K 31/5377 | 2663561 | A61K 38/16 | 2586456 |
| A61K 31/5377 | 2695881 | A61K 39/00 | 2215124 |
| A61K 31/5377 | 2772482 | A61K 39/00 | 2636736 |
| A61K 31/5377 | 2776430 | A61K 39/095 | 2255826 |
| A61K 31/5386 | 2772482 | A61K 39/395 | 1865986 |
| A61K 31/541 | 2772482 | A61K 39/395 | 2215124 |
| A61K 31/55 | 2505586 | A61K 39/395 | 2516469 |
| A61K 31/551 | 2695881 | A61K 39/395 | 2636736 |
| A61K 31/551 | 2822954 | A61K 39/395 | 2714740 |
| A61K 31/553 | 2772482 | A61K 41/00 | 2440199 |
| A61K 31/555 | 2636736 | A61K 45/06 | 2215124 |
| A61K 31/57 | 2146704 | A61K 45/06 | 2611415 |
| A61K 31/573 | 2727582 | A61K 45/06 | 2637663 |
| A61K 31/655 | 2399583 | A61K 45/06 | 2822954 |
| A61K 31/66 | 2215124 | A61K 47/10 | 2440199 |

| (51) | (11) |
|---|---|
| A61K 47/12 | 2440199 |
| A61K 47/14 | 2440199 |
| A61K 47/18 | 1865986 |
| A61K 47/24 | 2440199 |
| A61K 47/26 | 2440199 |
| A61K 47/32 | 1731138 |
| A61K 47/34 | 1731138 |
| A61K 47/36 | 1731138 |
| A61K 47/44 | 2440199 |
| A61K 47/48 | 2147116 |
| A61K 47/48 | 2939696 |
| A61M 15/00 | 2496294 |
| A61M 15/06 | 2770860 |
| A61P 1/02 | 2695881 |
| A61P 1/04 | 2695881 |
| A61P 1/04 | 2772482 |
| A61P 1/16 | 2695881 |
| A61P 3/00 | 2723320 |
| A61P 3/04 | 2225261 |
| A61P 3/04 | 2695881 |
| A61P 3/04 | 2776430 |
| A61P 3/06 | 2215124 |
| A61P 3/10 | 2695881 |
| A61P 5/00 | 2714740 |
| A61P 5/24 | 2399583 |
| A61P 5/48 | 2399583 |
| A61P 9/00 | 2695881 |
| A61P 9/10 | 2695881 |
| A61P 9/10 | 2772482 |
| A61P 9/12 | 2695881 |
| A61P 9/12 | 2772482 |
| A61P 11/00 | 2695881 |
| A61P 11/06 | 2146704 |
| A61P 11/06 | 2315591 |
| A61P 13/10 | 2303930 |
| A61P 17/14 | 2772482 |
| A61P 19/02 | 2303930 |
| A61P 21/00 | 2051706 |
| A61P 25/00 | 2051706 |
| A61P 25/00 | 2663561 |
| A61P 25/00 | 2772482 |
| A61P 25/16 | 2051706 |
| A61P 25/18 | 1859798 |
| A61P 25/18 | 2748151 |
| A61P 25/22 | 2776430 |
| A61P 25/26 | 2776430 |
| A61P 25/28 | 1859798 |
| A61P 25/28 | 2051706 |
| A61P 25/30 | 2776430 |
| A61P 27/02 | 2473065 |
| A61P 27/06 | 2611415 |
| A61P 29/00 | 2505586 |
| A61P 29/00 | 2531191 |
| A61P 31/00 | 2410844 |
| A61P 31/04 | 2255826 |
| A61P 31/12 | 2784075 |

| (51) | (11) |
|---|---|
| A61P 35/00 | 1814520 |
| A61P 35/00 | 1865986 |
| A61P 35/00 | 2516469 |
| A61P 35/00 | 2636736 |
| A61P 35/00 | 2637663 |
| A61P 35/02 | 2637663 |
| A61P 37/02 | 2505586 |
| A61P 37/06 | 2505586 |
| A61P 37/08 | 2505586 |
| A61P 39/06 | 2303930 |
| A61P 43/00 | 2505586 |
| A61P 43/00 | 2636736 |
| A61Q 17/04 | 2257266 |
| B01J 20/04 | 2773453 |
| B01J 20/10 | 2049645 |
| B01J 20/32 | 2773453 |
| B29B 9/12 | 1953179 |
| B29B 13/02 | 2614952 |
| B29C 57/02 | 2614952 |
| B29K 67/00 | 1953179 |
| B65B 3/00 | 2731577 |
| B65D 23/08 | 2731577 |
| B65D 25/24 | 2731577 |
| B65D 51/00 | 2731577 |
| B65D 85/804 | 2566784 |
| B65F 3/04 | 1955970 |
| B65G 15/14 | 2016010 |
| B65G 39/06 | 2016010 |

| (51) | (11) |
|---|---|
| C02F 1/28 | 2773453 |
| C02F 1/56 | 2773453 |
| C02F 1/66 | 2773453 |
| C02F 11/14 | 2773453 |
| C02F 103/28 | 2773453 |
| C03B 3/00 | 2788294 |
| C03B 3/02 | 2788294 |
| C03B 5/00 | 2788294 |
| C03B 5/12 | 2102118 |
| C03B 5/12 | 2788294 |
| C03B 5/235 | 2102118 |
| C07C 217/54 | 1859798 |
| C07C 233/40 | 1430020 |
| C07C 233/44 | 1430020 |
| C07C 233/51 | 1430020 |
| C07C 235/78 | 1430020 |
| C07C 237/20 | 1430020 |
| C07C 237/22 | 1430020 |
| C07C 277/02 | 2399583 |
| C07C 279/20 | 2399583 |
| C07C 317/14 | 1859798 |
| C07C 323/01 | 1859798 |
| C07D 205/04 | 2695881 |
| C07D 207/333 | 2315591 |
| C07D 207/335 | 2315591 |
| C07D 207/444 | 2772482 |
| C07D 209/10 | 2516394 |
| C07D 209/14 | 1859798 |

| (51) | (11) |
|---|---|
| C07D 209/14 | 2516394 |
| C07D 209/16 | 1859798 |
| C07D 209/16 | 2516394 |
| C07D 211/46 | 2246345 |
| C07D 211/48 | 2246345 |
| C07D 211/58 | 2246345 |
| C07D 213/64 | 1859798 |
| C07D 217/26 | 2595960 |
| C07D 233/24 | 1859798 |
| C07D 239/34 | 1859798 |
| C07D 251/60 | 2212302 |
| C07D 253/06 | 2542538 |
| C07D 277/34 | 1859798 |
| C07D 295/13 | 1430020 |
| C07D 307/91 | 1859798 |
| C07D 311/26 | 2310379 |
| C07D 333/20 | 1859798 |
| C07D 401/04 | 2542538 |
| C07D 401/06 | 2246345 |
| C07D 401/12 | 1859798 |
| C07D 401/12 | 2246345 |
| C07D 401/12 | 2748151 |
| C07D 401/12 | 2785708 |
| C07D 401/14 | 2246345 |
| C07D 401/14 | 2410844 |
| C07D 401/14 | 2505586 |
| C07D 401/14 | 2699563 |
| C07D 401/14 | 2748151 |

| (51) | (11) |
|---|---|
| C07D 401/14 | 2784075 |
| C07D 401/14 | 2785708 |
| C07D 403/04 | 2505586 |
| C07D 403/04 | 2542538 |
| C07D 403/06 | 2542538 |
| C07D 403/10 | 2315591 |
| C07D 403/12 | 1859798 |
| C07D 403/12 | 2699563 |
| C07D 403/12 | 2785708 |
| C07D 403/14 | 2410844 |
| C07D 403/14 | 2505586 |
| C07D 403/14 | 2784075 |
| C07D 403/14 | 2785708 |
| C07D 405/04 | 2542538 |
| C07D 405/12 | 2246345 |
| C07D 405/14 | 2246345 |
| C07D 405/14 | 2410844 |
| C07D 405/14 | 2505586 |
| C07D 405/14 | 2699563 |
| C07D 405/14 | 2748151 |
| C07D 405/14 | 2785708 |
| C07D 409/04 | 2542538 |
| C07D 409/06 | 2246345 |
| C07D 409/12 | 2246345 |
| C07D 409/14 | 2246345 |
| C07D 409/14 | 2315591 |
| C07D 409/14 | 2410844 |
| C07D 409/14 | 2699563 |

| (51) | (11) |
|---|---|
| C07D 411/14 | 2699563 |
| C07D 413/04 | 2542538 |
| C07D 413/10 | 2776430 |
| C07D 413/12 | 2611415 |
| C07D 413/14 | 2410844 |
| C07D 413/14 | 2663561 |
| C07D 413/14 | 2776430 |
| C07D 413/14 | 2785708 |
| C07D 417/04 | 2542538 |
| C07D 417/12 | 2611415 |
| C07D 417/14 | 2611415 |
| C07D 417/14 | 2699563 |
| C07D 417/14 | 2748151 |
| C07D 417/14 | 2776430 |
| C07D 453/02 | 2246345 |
| C07D 471/04 | 2410844 |
| C07D 471/04 | 2663561 |
| C07D 471/08 | 2246345 |
| C07D 471/18 | 2822954 |
| C07D 471/22 | 2822954 |
| C07D 487/04 | 2096919 |
| C07D 487/04 | 2410844 |
| C07D 487/04 | 2663561 |
| C07D 487/04 | 2748151 |
| C07D 498/04 | 2410844 |
| C07D 498/18 | 2822954 |
| C07F 5/02 | 2632927 |
| C07F 5/04 | 2632927 |

| (51) | (11) |
|---|---|
| C07H 11/00 | 2303930 |
| C07H 13/02 | 2303930 |
| C07K 5/06 | 2225261 |
| C07K 5/062 | 2225261 |
| C07K 5/065 | 2225261 |
| C07K 5/072 | 2225261 |
| C07K 5/08 | 2225261 |
| C07K 5/083 | 2225261 |
| C07K 5/087 | 2225261 |
| C07K 5/09 | 2225261 |
| C07K 14/705 | 1536234 |
| C07K 14/705 | 2636736 |
| C07K 16/16 | 2297585 |
| C07K 16/28 | 1865986 |
| C07K 16/28 | 2516469 |
| C07K 16/28 | 2636736 |
| C07K 16/28 | 2714740 |
| C07K 16/30 | 2636736 |
| C07K 16/32 | 2516469 |
| C07K 16/40 | 2215124 |
| C08B 37/00 | 2303930 |
| C08G 63/183 | 1953179 |
| C08G 63/185 | 1953179 |
| C12H 1/04 | 2049645 |
| C12N 1/15 | 2636736 |
| C12N 1/19 | 2636736 |
| C12N 1/21 | 2636736 |
| C12N 5/10 | 2636736 |

| (51) | (11) |
|---|---|
| C12N 9/78 | 2147116 |
| C12N 15/09 | 2636736 |
| C12N 15/113 | 2215124 |
| C12P 21/08 | 2636736 |
| C12Q 1/68 | 2504449 |
| E01F 9/529 | 2373847 |
| E04C 2/04 | 2155983 |
| E04C 2/292 | 2432948 |
| E04G 21/32 | 2824255 |
| E05B 19/26 | 2468987 |
| E05B 47/00 | 2468987 |
| F03D 80/00 | 2521859 |
| F04D 25/08 | 2488759 |
| F04D 29/54 | 2488759 |
| F04D 29/60 | 2488759 |
| F24C 7/00 | 2315976 |
| G01N 33/53 | 2787345 |
| G01N 33/567 | 2787345 |
| G01N 33/573 | 2787345 |
| G01N 33/68 | 1536234 |
| G01N 33/94 | 2246345 |
| G01N 33/94 | 2297585 |
| G02B 27/09 | 2194426 |
| G02F 1/35 | 2194426 |
| G03G 15/08 | 2796936 |
| G21F 5/015 | 2731577 |
| G21F 5/08 | 2731577 |
| G21F 5/12 | 2731577 |

| (51) | (11) |
|---|---|
| H01C 7/12 | 2725588 |
| H01H 83/10 | 2725588 |
| H01R 4/70 | 2759032 |
| H01R 13/518 | 2759032 |
| H01R 13/52 | 2759032 |
| H01R 43/00 | 2759032 |
| H01T 1/14 | 2725588 |
| H02G 15/18 | 2759032 |
| H04L 27/26 | 2132912 |
| H04N 19/105 | 2545713 |
| H04N 19/11 | 2545713 |
| H04N 19/122 | 2545713 |
| H04N 19/176 | 2545713 |
| H04N 19/186 | 2545713 |
| H04N 19/593 | 2545713 |
| H04N 19/96 | 2545713 |
| H05B 41/30 | 2605623 |
| H05H 7/22 | 2825000 |
| H05H 9/04 | 2825000 |

# NUMERINĖ EUROPOS PATENTŲ RODYKLĖ

| (11) | (51) |
|---|---|
| 1430020 | C07C 233/40 |
| 1430020 | C07C 233/44 |
| 1430020 | C07C 233/51 |
| 1430020 | C07C 235/78 |
| 1430020 | C07C 237/20 |
| 1430020 | C07C 237/22 |
| 1430020 | C07D 295/13 |
| 1536234 | C07K 14/705 |
| 1536234 | G01N 33/68 |
| 1731138 | A61K 9/10 |
| 1731138 | A61K 31/343 |
| 1731138 | A61K 31/352 |
| 1731138 | A61K 31/4709 |
| 1731138 | A61K 31/497 |
| 1731138 | A61K 31/7048 |
| 1731138 | A61K 47/32 |
| 1731138 | A61K 47/34 |
| 1731138 | A61K 47/36 |
| 1814520 | A61K 9/107 |
| 1814520 | A61K 31/4745 |
| 1814520 | A61P 35/00 |
| 1814520 | A61K 9/48 |
| 1859798 | A61K 31/4045 |
| 1859798 | C07D 209/16 |
| 1859798 | A61P 25/18 |

| (11) | (51) |
|---|---|
| 1859798 | A61P 25/28 |
| 1859798 | C07D 403/12 |
| 1859798 | C07D 401/12 |
| 1859798 | A61K 31/4406 |
| 1859798 | A61K 31/4409 |
| 1859798 | A61K 31/506 |
| 1859798 | A61K 31/4402 |
| 1859798 | C07C 217/54 |
| 1859798 | C07C 323/01 |
| 1859798 | C07C 317/14 |
| 1859798 | C07D 213/64 |
| 1859798 | C07D 277/34 |
| 1859798 | C07D 239/34 |
| 1859798 | C07D 233/24 |
| 1859798 | C07D 333/20 |
| 1859798 | C07D 307/91 |
| 1859798 | C07D 209/14 |
| 1865986 | A61K 39/395 |
| 1865986 | A61K 47/18 |
| 1865986 | A61P 35/00 |
| 1865986 | C07K 16/28 |
| 1953179 | B29B 9/12 |
| 1953179 | B29K 67/00 |
| 1953179 | C08G 63/183 |
| 1953179 | C08G 63/185 |

| (11) | (51) |
|---|---|
| 1955970 | B65F 3/04 |
| 2016010 | B65G 15/14 |
| 2016010 | B65G 39/06 |
| 2049645 | C12H 1/04 |
| 2049645 | B01J 20/10 |
| 2051706 | A61K 31/122 |
| 2051706 | A61P 25/00 |
| 2051706 | A61P 25/16 |
| 2051706 | A61P 25/28 |
| 2051706 | A61P 21/00 |
| 2096919 | C07D 487/04 |
| 2096919 | A61K 31/519 |
| 2096919 | A61K 31/5377 |
| 2102118 | C03B 5/12 |
| 2102118 | C03B 5/235 |
| 2117372 | A45C 5/03 |
| 2117372 | A45C 13/10 |
| 2132912 | H04L 27/26 |
| 2146704 | A61K 31/167 |
| 2146704 | A61K 31/57 |
| 2146704 | A61P 11/06 |
| 2147116 | C12N 9/78 |
| 2147116 | A61K 47/48 |
| 2147116 | A61K 38/00 |
| 2155983 | E04C 2/04 |
| 2194426 | G02F 1/35 |
| 2194426 | G02B 27/09 |
| 2212302 | C07D 251/60 |
| 2215124 | C07K 16/40 |
| 2215124 | A61P 3/06 |
| 2215124 | A61K 39/395 |
| 2215124 | A61K 45/06 |
| 2215124 | A61K 31/22 |
| 2215124 | A61K 31/366 |
| 2215124 | A61K 31/40 |
| 2215124 | A61K 31/405 |
| 2215124 | A61K 31/44 |
| 2215124 | A61K 31/47 |
| 2215124 | A61K 31/505 |
| 2215124 | A61K 31/66 |
| 2215124 | A61K 39/00 |
| 2215124 | C12N 15/113 |
| 2225261 | C07K 5/06 |
| 2225261 | C07K 5/08 |
| 2225261 | A61K 38/00 |
| 2225261 | A61P 3/04 |
| 2225261 | C07K 5/062 |
| 2225261 | C07K 5/083 |
| 2225261 | C07K 5/087 |
| 2225261 | C07K 5/09 |
| 2225261 | C07K 5/065 |
| 2225261 | C07K 5/072 |
| 2225261 | A61K 38/05 |
| 2225261 | A61K 38/06 |
| 2246345 | C07D 401/12 |
| 2246345 | A61K 31/4709 |

| (11) | (51) |
|---|---|
| 2246345 | C07D 211/46 |
| 2246345 | C07D 211/48 |
| 2246345 | C07D 211/58 |
| 2246345 | C07D 401/14 |
| 2246345 | C07D 405/14 |
| 2246345 | C07D 409/14 |
| 2246345 | C07D 453/02 |
| 2246345 | A61K 31/445 |
| 2246345 | A61K 31/452 |
| 2246345 | C07D 401/06 |
| 2246345 | C07D 405/12 |
| 2246345 | C07D 409/06 |
| 2246345 | C07D 409/12 |
| 2246345 | C07D 471/08 |
| 2246345 | G01N 33/94 |
| 2255826 | A61K 39/095 |
| 2255826 | A61P 31/04 |
| 2257266 | A61K 8/27 |
| 2257266 | A61K 8/35 |
| 2257266 | A61K 8/49 |
| 2257266 | A61K 8/67 |
| 2257266 | A61K 8/73 |
| 2257266 | A61Q 17/04 |
| 2282636 | A01N 43/42 |
| 2297585 | G01N 33/94 |
| 2297585 | C07K 16/16 |
| 2303930 | C08B 37/00 |
| 2303930 | A61K 31/737 |
| 2303930 | A61P 19/02 |
| 2303930 | A61P 39/06 |
| 2303930 | A61P 13/10 |
| 2303930 | C07H 11/00 |
| 2303930 | C07H 13/02 |
| 2310379 | C07D 311/26 |
| 2315591 | A61K 31/4025 |
| 2315591 | C07D 403/10 |
| 2315591 | C07D 207/333 |
| 2315591 | C07D 207/335 |
| 2315591 | C07D 409/14 |
| 2315591 | A61P 11/06 |
| 2315976 | F24C 7/00 |
| 2373847 | E01F 9/529 |
| 2399583 | A61K 31/655 |
| 2399583 | A61K 31/33 |
| 2399583 | C07C 279/20 |
| 2399583 | C07C 277/02 |
| 2399583 | A61P 5/24 |
| 2399583 | A61P 5/48 |
| 2410844 | C07D 471/04 |
| 2410844 | C07D 401/14 |
| 2410844 | C07D 403/14 |
| 2410844 | C07D 405/14 |
| 2410844 | C07D 409/14 |
| 2410844 | C07D 413/14 |
| 2410844 | C07D 487/04 |
| 2410844 | C07D 498/04 |

| (11) | (51) |
|---|---|
| 2410844 | A01K 31/16 |
| 2410844 | A61K 31/404 |
| 2410844 | A61K 31/438 |
| 2410844 | A61P 31/00 |
| 2432948 | E04C 2/292 |
| 2440199 | A61K 31/195 |
| 2440199 | A61K 9/06 |
| 2440199 | A61K 41/00 |
| 2440199 | A61K 47/10 |
| 2440199 | A61K 47/14 |
| 2440199 | A61K 47/44 |
| 2440199 | A61K 47/12 |
| 2440199 | A61K 47/24 |
| 2440199 | A61K 47/26 |
| 2440199 | A61K 31/221 |
| 2468987 | E05B 19/26 |
| 2468987 | E05B 47/00 |
| 2473065 | A23L 33/105 |
| 2473065 | A61K 36/28 |
| 2473065 | A61P 27/02 |
| 2488759 | F04D 25/08 |
| 2488759 | F04D 29/54 |
| 2488759 | F04D 29/60 |
| 2496294 | A61M 15/00 |
| 2504449 | C12Q 1/68 |
| 2505586 | C07D 401/14 |
| 2505586 | A61K 31/416 |
| 2505586 | A61K 31/4178 |
| 2505586 | A61K 31/422 |
| 2505586 | A61K 31/427 |
| 2505586 | A61K 31/433 |
| 2505586 | A61K 31/437 |
| 2505586 | A61K 31/4439 |
| 2505586 | A61K 31/454 |
| 2505586 | A61K 31/496 |
| 2505586 | A61K 31/5377 |
| 2505586 | A61K 31/55 |
| 2505586 | A61P 29/00 |
| 2505586 | A61P 37/02 |
| 2505586 | A61P 37/06 |
| 2505586 | A61P 37/08 |
| 2505586 | A61P 43/00 |
| 2505586 | C07D 403/04 |
| 2505586 | C07D 403/14 |
| 2505586 | C07D 405/14 |
| 2516394 | C07D 209/10 |
| 2516394 | C07D 209/14 |
| 2516394 | C07D 209/16 |
| 2516469 | C07K 16/28 |
| 2516469 | C07K 16/32 |
| 2516469 | A61K 39/395 |
| 2516469 | A61P 35/00 |
| 2521859 | F03D 80/00 |
| 2531191 | A61K 31/415 |
| 2531191 | A61K 31/416 |
| 2531191 | A61K 31/4196 |

| (11) | (51) |
|---|---|
| 2531191 | A61P 29/00 |
| 2542538 | C07D 253/06 |
| 2542538 | A01N 43/707 |
| 2542538 | A01N 43/80 |
| 2542538 | A01N 43/84 |
| 2542538 | A01N 47/02 |
| 2542538 | A01P 13/02 |
| 2542538 | C07D 401/04 |
| 2542538 | C07D 403/04 |
| 2542538 | C07D 403/06 |
| 2542538 | C07D 405/04 |
| 2542538 | C07D 409/04 |
| 2542538 | C07D 413/04 |
| 2542538 | C07D 417/04 |
| 2545713 | H04N 19/176 |
| 2545713 | H04N 19/593 |
| 2545713 | H04N 19/105 |
| 2545713 | H04N 19/11 |
| 2545713 | H04N 19/186 |
| 2545713 | H04N 19/96 |
| 2545713 | H04N 19/122 |
| 2566784 | B65D 85/804 |
| 2566784 | A47J 31/06 |
| 2586456 | A61K 38/16 |
| 2592918 | A01B 35/26 |
| 2595960 | C07D 217/26 |
| 2605623 | H05B 41/30 |
| 2611415 | A61K 9/00 |

| (11) | (51) |
|---|---|
| 2611415 | A61K 31/4427 |
| 2611415 | A61K 31/4439 |
| 2611415 | A61P 27/06 |
| 2611415 | A61K 45/06 |
| 2611415 | A61K 9/08 |
| 2611415 | C07D 413/12 |
| 2611415 | C07D 417/12 |
| 2611415 | C07D 417/14 |
| 2614952 | B29C 57/02 |
| 2614952 | B29B 13/02 |
| 2632927 | C07F 5/02 |
| 2632927 | C07F 5/04 |
| 2632927 | A61K 31/69 |
| 2636736 | C12N 15/09 |
| 2636736 | A61K 31/337 |
| 2636736 | A61K 31/475 |
| 2636736 | A61K 39/395 |
| 2636736 | A61P 35/00 |
| 2636736 | A61P 43/00 |
| 2636736 | C07K 16/28 |
| 2636736 | C12N 1/15 |
| 2636736 | C12N 1/19 |
| 2636736 | C12N 1/21 |
| 2636736 | C12N 5/10 |
| 2636736 | C12P 21/08 |
| 2636736 | A61K 31/439 |
| 2636736 | A61K 31/4545 |
| 2636736 | A61K 31/4745 |

| (11) | (51) |
|---|---|
| 2636736 | A61K 31/513 |
| 2636736 | A61K 31/555 |
| 2636736 | C07K 14/705 |
| 2636736 | C07K 16/30 |
| 2636736 | A61K 39/00 |
| 2637663 | A61K 31/4995 |
| 2637663 | A61K 31/69 |
| 2637663 | A61K 45/06 |
| 2637663 | A61K 38/15 |
| 2637663 | A61P 35/00 |
| 2637663 | A61P 35/02 |
| 2637663 | A61K 31/513 |
| 2637663 | A61K 31/519 |
| 2637663 | A61K 31/7068 |
| 2637663 | A61K 31/706 |
| 2637663 | A61K 31/7072 |
| 2637663 | A61K 31/517 |
| 2663561 | C07D 413/14 |
| 2663561 | C07D 471/04 |
| 2663561 | C07D 487/04 |
| 2663561 | A61K 31/5377 |
| 2663561 | A61P 25/00 |
| 2695881 | C07D 205/04 |
| 2695881 | A61K 31/426 |
| 2695881 | A61K 31/4402 |
| 2695881 | A61K 31/4545 |
| 2695881 | A61K 31/495 |
| 2695881 | A61K 31/496 |

| (11) | (51) |
|---|---|
| 2695881 | A61K 31/505 |
| 2695881 | A61K 31/506 |
| 2695881 | A61K 31/5377 |
| 2695881 | A61K 31/551 |
| 2695881 | A61P 1/02 |
| 2695881 | A61P 1/04 |
| 2695881 | A61P 1/16 |
| 2695881 | A61P 3/04 |
| 2695881 | A61P 3/10 |
| 2695881 | A61P 9/00 |
| 2695881 | A61P 9/10 |
| 2695881 | A61P 9/12 |
| 2695881 | A61P 11/00 |
| 2699563 | A01N 43/56 |
| 2699563 | A01N 43/58 |
| 2699563 | C07D 401/14 |
| 2699563 | C07D 403/12 |
| 2699563 | C07D 405/14 |
| 2699563 | C07D 411/14 |
| 2699563 | C07D 417/14 |
| 2699563 | C07D 409/14 |
| 2714740 | C07K 16/28 |
| 2714740 | A61K 39/395 |
| 2714740 | A61P 5/00 |
| 2723320 | A61K 9/10 |
| 2723320 | A61K 31/122 |
| 2723320 | A61P 3/00 |
| 2725588 | H01C 7/12 |

| (11) | (51) |
|---|---|
| 2725588 | H01T 1/14 |
| 2725588 | H01H 83/10 |
| 2727582 | A61K 9/00 |
| 2727582 | A61K 31/167 |
| 2727582 | A61K 31/573 |
| 2731577 | A61J 1/14 |
| 2731577 | B65B 3/00 |
| 2731577 | B65D 23/08 |
| 2731577 | B65D 25/24 |
| 2731577 | B65D 51/00 |
| 2731577 | G21F 5/015 |
| 2731577 | G21F 5/08 |
| 2731577 | G21F 5/12 |
| 2731577 | A61J 1/05 |
| 2748151 | C07D 401/12 |
| 2748151 | C07D 401/14 |
| 2748151 | C07D 405/14 |
| 2748151 | C07D 417/14 |
| 2748151 | C07D 487/04 |
| 2748151 | A61K 31/506 |
| 2748151 | A61P 25/18 |
| 2759032 | H02G 15/18 |
| 2759032 | H01R 13/518 |
| 2759032 | H01R 13/52 |
| 2759032 | H01R 43/00 |
| 2759032 | H01R 4/70 |
| 2770860 | A24F 47/00 |
| 2770860 | A61M 15/06 |

| (11) | (51) |
|---|---|
| 2772482 | C07D 207/444 |
| 2772482 | A61K 31/4164 |
| 2772482 | A61K 31/4178 |
| 2772482 | A61K 31/4196 |
| 2772482 | A61K 31/4439 |
| 2772482 | A61K 31/444 |
| 2772482 | A61K 31/454 |
| 2772482 | A61K 31/4545 |
| 2772482 | A61K 31/46 |
| 2772482 | A61K 31/4725 |
| 2772482 | A61K 31/496 |
| 2772482 | A61K 31/537 |
| 2772482 | A61K 31/5377 |
| 2772482 | A61K 31/5386 |
| 2772482 | A61K 31/541 |
| 2772482 | A61K 31/553 |
| 2772482 | A61P 1/04 |
| 2772482 | A61P 9/10 |
| 2772482 | A61P 9/12 |
| 2772482 | A61P 17/14 |
| 2772482 | A61P 25/00 |
| 2773453 | B01J 20/04 |
| 2773453 | B01J 20/32 |
| 2773453 | C02F 1/28 |
| 2773453 | C02F 11/14 |
| 2773453 | C02F 1/56 |
| 2773453 | C02F 1/66 |
| 2773453 | C02F 103/28 |

| (11) | (51) |
|---|---|
| 2775865 | A24D 1/00 |
| 2775865 | A24D 3/04 |
| 2775865 | A24D 3/06 |
| 2776430 | C07D 413/10 |
| 2776430 | C07D 413/14 |
| 2776430 | C07D 417/14 |
| 2776430 | A61K 31/5377 |
| 2776430 | A61P 3/04 |
| 2776430 | A61P 25/22 |
| 2776430 | A61P 25/30 |
| 2776430 | A61P 25/26 |
| 2784075 | C07D 401/14 |
| 2784075 | C07D 403/14 |
| 2784075 | A61P 31/12 |
| 2784075 | A61K 31/4025 |
| 2784075 | A61K 31/4178 |
| 2785708 | C07D 401/12 |
| 2785708 | C07D 401/14 |
| 2785708 | C07D 403/12 |
| 2785708 | C07D 403/14 |
| 2785708 | C07D 405/14 |
| 2785708 | C07D 413/14 |
| 2785708 | A01N 43/707 |
| 2787345 | G01N 33/53 |
| 2787345 | G01N 33/567 |
| 2787345 | G01N 33/573 |
| 2787345 | A61K 31/435 |
| 2788294 | C03B 3/00 |
| 2788294 | C03B 5/12 |
| 2788294 | C03B 3/02 |
| 2788294 | C03B 5/00 |
| 2796936 | G03G 15/08 |
| 2797445 | A24F 47/00 |
| 2822954 | A61K 45/06 |
| 2822954 | A61K 31/498 |
| 2822954 | A61K 31/529 |
| 2822954 | A61K 31/537 |
| 2822954 | A61K 31/551 |
| 2822954 | C07D 471/18 |
| 2822954 | C07D 498/18 |
| 2822954 | C07D 471/22 |
| 2823732 | A47B 96/20 |
| 2823732 | A47B 81/06 |
| 2824255 | E04G 21/32 |
| 2825000 | H05H 7/22 |
| 2825000 | H05H 9/04 |
| 2939696 | A61K 47/48 |

# 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. 11, 1 dalis „Išradimai“
Lietuvos Respublikos valstybinis patentų biuras,
Kalvarijų g. 3, LT-09310 Vilnius