



PATENTI

un preču zīmes

LATVIJAS REPUBLIKAS PATENTU VALDES OFICIĀLAIS VĒSTNESIS

11 / 2012

The Official Gazette of the Patent Office of the Republic of Latvia - "Patenti un preču zīmes" - contains recordings in the Registers of Inventions, Trademarks and Service marks, Industrial designs and Topographies of Semiconductor Products.

Date of publication of the registered inventions and trademarks - November 20, 2012.

Latvijas Republikas Patentu valde

Citadeles iela 7/70, Rīga, LV - 1010
a/k 824, Rīga, LV - 1010
LATVIJA

Tālruni: 67 099 600

Fakss: 67 099 650

E-pasts: valde@lrpv.lv

Mājaslapa: <http://www.lrpv.lv>

Patent Office of the Republic of Latvia

7/70 Citadeles iela, Rīga, LV - 1010
P.O. Box 824, Rīga, LV - 1010
LATVIA

Phones: 371 67 099 600

Fax: 371 67 099 650

E-mail: valde@lrpv.lv

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

PATENTI un PREČU ZĪMES

LATVIJAS REPUBLIKAS PATENTU VALDES OFICIĀLAIS VĒSTNESIS

Latvijas Republikas Patentu valde, Rīga, Citadeles ielā 7/70
Pasta adrese: a/k 824, Rīga, LV-1010, Latvija
Tālrunis 67 099 600 Fakss 67 099 650

11/2012
20.novembris

1509. - 1682. lappuse

S A T U R S

INFORMĀCIJA

Hronika 1510

IZGUDROJUMI

Izgudrojumu pieteikumu publikācijas 1517

Izgudrojumu patentu publikācijas 1522

Attiecināto Eiropas patentu publikācijas
(LR Patentu likuma 19. panta 2. un 4. daļa) 1527

Attiecināto Eiropas patentu publikācijas
(LR Patentu likuma 19. panta 3. daļa) 1547

Latvijā apstiprināto Eiropas patentu
publikācijas 1549

Papildu aizsardzības sertifikāti 1653

Pieteicēju, izgudrotāju un īpašnieku
alfabētiskais rādītājs 1654

Izgudrojumu pieteikumu un patentu
numuru rādītājs 1656

PREČU ZĪMES

Reģistrētās preču zīmes 1657

Preču zīmju pieteikumu numerācijas rādītājs 1669

Preču zīmju īpašnieku rādītājs 1670

Preču zīmju rādītājs pēc preču un
pakalpojumu klasēm 1671

GROZĪJUMI VALSTS REĢISTROS

Grozījumi Patentu reģistrā 1672

Grozījumi Papildu aizsardzības sertifikātu valsts
reģistrā 1673

Grozījumi Valsts dizainparaugu reģistrā 1673

Grozījumi Valsts preču zīmju reģistrā 1673

Pamanīto kļūdu labojums 1681

C O N T E N T S

INFORMATION

Activities of LPO 1510

INVENTIONS

Publication of Patent Applications 1517

Publication of Invention Patents 1522

Publication of Extended European Patents
(Patent Law, Article 19, Paragraphs 2 and 4) ... 1527

Publication of Extended European Patents
(Patent Law, Article 19, Paragraph 3) 1547

Publication of European Patents Validated in
Latvia 1549

Supplementary Protection Certificates 1653

Name Index of Applicants, Inventors and
Owners 1654

Application and Patent Number Index
of Inventions 1656

TRADEMARKS

Registered Trademarks 1657

Application Number Index of Trademarks 1669

Name Index of Trademark Owners 1670

Trademark Registrations Listed by Classes of
Goods and Services 1671

CHANGES IN THE STATE REGISTERS

Changes in the Patent Register 1672

Changes in the Register of Supplementary
Protection Certificates 1673

Changes in the Industrial Designs Register 1673

Changes in the Trademarks Register 1673

Correction of Mistakes 1681

Hronika

Šā gada 25. septembrī Beļģijā (Brisele) Patentu valdes Juridiskās nodaļas juriskonsulte Linda Zommere piedalījās Eiropas komisijas darba grupas „Labās prakses projekts intelektuālā īpašuma tiesību īstenošanas atbalsta pasākumiem maziem un vidējiem uzņēmumiem” sanāksmē.

Pasākumā piedalījās pārstāvji no Eiropas Komisijas, Eiropas Savienības dalībvalstīm, Norvēģijas, Serbijas, Horvātijas, Turcijas un Albānijas.

Eiropas Komisijas pārstāvji iepazīstināja darba grupas dalībniekus ar ziņojuma projektu un tā struktūru. Tikšanās laikā dalībnieki pārrunāja attīstību atbalsta pasākumos maziem un vidējiem uzņēmumiem (MVU) kopš pirmā projekta ziņojuma publicēšanas, kā arī ieteikumus, kas būtu ietverami jaunajā ziņojumā.

Lai to veiksmīgāk īstenotu, atbalsta pasākumi tika sadalīti 4 daļās (attieciņi izveidojot 4 darba grupas):

A) tiesību aizsardzības politika;

B) atbalsta pasākumu kopums;

C) inovācija, intelektuālā ieguldījuma pārvalde, novērtēšana;

D) tiesību aizsardzības īpašie pasākumi, finansējums.

Katras apakšgrupas ietvaros dalībnieki pārrunāja svarīgākos atbalsta pasākumus attiecīgajā jomā, izvēlējās labās prakses piemērus, kā arī formulēja ieteikumus (balstoties uz citu valstu labās prakses piemēriem).

Latvija piedalījās A apakšgrupas „tiesību aizsardzības politika” diskusijās. Kā svarīgākie pasākumi valstu intelektuālā īpašuma tiesību aizsardzības politikas jomā tika izvirzīti:

- stratēģijas (vienas vai vairāku) izstrāde;
- sadarbība un koordinācija, kuru veido 2 līmeņos:
 - augstākā līmeņa koordinācija (politiskā līmenī, oficiālā pieeja);
 - tehniskā līmeņa koordinācija.

Abu līmeņu sadarbība ir noderīga, taču būtiskākais ir tas, kā tā tiek realizēta, līdz ar to ir svarīgi novērtēt sadarbības ietekmi un īstenošanu (cik daudz ir kopīgu darbību, vai ziņojumi tiek gatavoti kopā, kā tiek mainīta prakse u.tml.). Lielā daļā dalībvalstu lielākais robs ir tieši sadarbības novērtēšanas jomā, jo tāda netiek veikta;

- atbalsta pasākumi ar intelektuālo īpašumu saistīta biznesa eksportam („*help-desk*”, intelektuālā īpašuma atašeji u.tml.). Tā kā daudzās valstīs šajā jomā jau tiek piedāvāti atbalsta pasākumi, ieteikums būtu organizēt informācijas apmaiņu, daloties pieredzē

savā starpā un ar citu dalībvalstu interesentiem, kuriem eksporta valstī nav savu pārstāvju;

- sadarbība starp nacionālajām patentu iestādēm un tirdzniecības un rūpniecības kamerām, kas nodrošinātu apmācību biznesa cilvēkiem. Ir dažādi veidi, kā to veikt – oficiāli, uz līguma pamata, intelektuālā īpašuma akadēmijas u.tml.

B apakšgrupa „atbalsta pasākumu kopums” kā atbalstāmos pasākumus izvirzīja:

- finansiāls atbalsts MVU – novērtējot savu intelektuālo īpašumu, aizsargājot savas tiesības ārpus savas valsts robežām (tiesāšanās izdevumi) u.c.;

- vienas pieturas aģentūras, kontaktpersonas;

- „domāšana ārpus kastes”. Jāaicina uzņēmēji tiesāšanos izmantot kā galējo tiesību aizsardzības līdzekli. Piemēram, Somijas kompānija, kas izgudroja spēli „Angry birds”, nevis cēla prasību tiesā pret Ķīnas „pirātiskajiem” izstrādājumiem, bet devās uz Ķīnu un licencēja tās kompānijas, kuru produktu kvalitāte bija laba. Lai aicinātu patērētājus pirkt oriģinālo produktu, oriģināli iegādātām spēlēm un lietām tiek doti līdzīgi kodi, kas spēlē atver bonusa līmeņus. Bez tam Somijas kompānija redzēja, ka Ķīnā tiek ražoti „Angry birds” baloni, un nolēma, ka arī viņi varētu tādus ražot („pirating the pirates”);

- sabiedrības informēšana, jo, ja cilvēki nepirktu viltotas preces, nebūtu jāiegulda tik daudz naudas tiesību aizsardzības pasākumu veidošanā.

C apakšgrupa „inovācija, intelektuālā ieguldījuma pārvalde, novērtēšana” kā svarīgākos pasākumus šajā jomā izvirzīja:

- intelektuālā ieguldījuma pārvaldes iekļaušanu inovācijas programmās kā programmas sastāvdaļu. Piemēram, norvēģi ir izstrādājuši „balto grāmatu” (*white paper*) par intelektuālo īpašumu. Bez tam iestādēm, kas izsniedz finansējumu intelektuālā īpašuma reģistrēšanai (piemēram, LIAA), pirms finansējuma izsniegšanas jāprasa, lai tiktu veikta intelektuālā ieguldījuma pārvalde;

- veidi, kā informācija par intelektuālā ieguldījuma pārvaldi nonāk pie MVU:

a) publikācijas, mājaslapas;

b) sadarbība ar iestādēm, kurām ir sadarbība ar MVU (Tirdzniecības un rūpniecības kameras, asociācijas u.tml.);

c) individuāla pieeja uzņēmumiem:

- uzņēmums pats meklē informāciju;

- iestāde meklē uzņēmumu (šādā gadījumā svarīgi ir izvēlēties pareizo mērķauditoriju);

- vienotais patents – dalībvalstīm jāņem vērā, ko tas mainīs uzņēmumiem, jo īpaši mazajās valstīs,

kurās ir mazs patentu skaits, jo attiecībā uz tām ietekme varētu būt nelabvēlīga);

- informēt dalībvalstu valdības par dažādiem pasākumiem, kuri tiek īstenoti, vai kurus plānots ieviest;

- ieviest universitātēs mācību kursu par intelektuālo īpašumu un tā pārvaldību;

- sabiedrības informēšana ar mērķi mainīt sabiedrības attieksmi, ka intelektuālais īpašums ir ne tikai aizsardzības līdzeklis, bet arī iespēja iegūt finansējumu;

- novērtēšana – ko dara iestādes, reālais efekts uz MVU (kas saistīti ar intelektuālo īpašumu);

- mērķis panākt, lai tiesību aizsardzības pasākumi (tiesāšanās kā Amerikā) būtu pēc iespējas mazāk nepieciešami.

D apakšgrupas „tiesību aizsardzības īpašie pasākumi, finansējums” izvirzītie svarīgākie pasākumi šajā jomā:

- grupa secināja, ka šādu pasākumu ir samērā maz, jo šobrīd lielāks uzsvars tiek likts uz inovācijas sistēmas attīstību, bet tā nav intelektuālā īpašuma tiesību aizsardzības sistēma;

- vairāk nepieciešams atbalstīt „aktīvās”, nevis „pasīvās” aktivitātes;

- Apvienotā Karaliste veikusi savas patentu tiesas reorganizāciju, nosakot MVU zemāku tiesas nodevu;

- ieteikums veidot tiesību aizsardzības datu bāzes, ar kuru palīdzību tiktu nodrošināta pieredzes apmaiņa;

- finansējums tiesāšanās izdevumiem ārpus valsts robežām. Tāds, piemēram, ir Austrijā. MVU, kas saistīti ar sava intelektuālā īpašuma eksportu, var saņemt finansējumu no fonda, ja vēlas uzsākt tiesas procesu kādā no eksporta valstīm. Pirms finansējuma piešķiršanas fonda darbinieki izvērtē vai strīdu nevar atrisināt bez tiesāšanās, sniedz konsultācijas, kā arī izvērtē intelektuālā īpašuma kvalitāti un spēku. Finansējums tiek piešķirts kā līdzfinansējums 50 % apmērā, bet tikai līdz 50 000 eiro uz vienu uzņēmumu.

- Portugālē kā alternatīva tiesai ir izveidota šķīrējtiesa intelektuālā īpašuma jomā (*Arbitrage*). Šķīrējtiesā lietu var skatīt tikai tad, ja visas puses tam piekrīt. Tās izmaksas ir nelielas (~100 eiro), un process ātrs (~1-2 mēneši). Šķīrējtiesneši ir speciālisti intelektuālā īpašuma jomā. Diemžēl līdzšinējā Portugāles pieredze rāda, ka puses pārsvarā izvēlas iet uz tiesu, līdz ar to jāmaina cilvēku paradums un jāiegūst uzticēšanās. MVU jāiedrošina izmantot alternatīvos strīdu risināšanas veidus.

Darba grupa pārrunāja iepriekšējā ziņojuma ieteikumus un nolēma, kurus kā svarīgākos atstāt arī šajā ziņojumā:

- „nav nepareizu durvju” politika (*no wrong door policy*);

- apvienot autortiesības ar pārējo rūpniecisko īpašumu vai vismaz autortiesības likt zem tās pašas ministrijas, kur pārējais rūpnieciskai īpašums;

- palīdzības punktu izveide (*help-desk*).

Pēc ziņojuma projekta precizēšanas Eiropas Komisija to nosūtīs vēlreiz apstiprināšanai darba grupas dalībniekiem, un pēc apstiprināšanas publicēs to Eiropas Komisijas mājaslapā, kā arī centīsies vismaz kopsavilkumu iztulkot visu dalībvalstu valodās.

* * *

No 1. līdz 9. oktobrim Patentu valdes direktors Reinis Bērziņš un Patentu valdes direktora vietnieks rūpnieciskā īpašuma jautājumos, Izgudrojumu ekspertīzes departamenta direktors Guntis Ramāns piedalījās ikgadējā Pasaules Intelektuālā īpašuma organizācijas (WIPO) 50. Ģenerālajā asamblejā. Asamblejā piedalījās 185 valstu pārstāvji. Tās noslēgumā WIPO ģenerāldirektors Frānsiss Garijs (*Francis Gurry*) un Ģenerālās asamblejas priekšsēdētājs Serbijas pastāvīgais pārstāvis ANO Ženēvā, vēstnieks Uglješa Zvekičs (*Uglješa Zvekić*) pauda gandarījumu par panāktajiem pozitīvajiem risinājumiem un noteiktajiem termiņiem, lai pabeigtu sagatavot normatīvos dokumentus vairākās jomās.

Pie 50. sesijas galvenajiem rezultātiem var piešķaitīt trīs jautājumus:

1) tika panākta vienošanās, kā nobeigt sarunas par diplomātiskās konferences sasaukšanu nākamajā gadā saistībā ar piekļuvi ar autortiesībām aizsargātiem darbiem cilvēkiem ar redzes traucējumiem un drukāt nespējīgiem cilvēkiem;

2) dalībvalstis vienojās par darba programmu 2013. gadam WIPO Starpvaldību intelektuālā īpašuma un ģenētisko resursu, tradicionālo zināšanu un folkloras komitejā, kur turpinās sarunas, lai nodrošinātu efektīvu aizsardzību ģenētisko resursu, tradicionālo zināšanu un folkloras izpausmēm;

3) svarīgākais lēmums, kas ir nozīmīgs arī Latvijai un kuram piekrita 185 dalībvalstis, bija par nepieciešamību paātrināt darbu pie Dizainparaugu tiesību līguma, lai, līdzīgi kā tas ir patentu jomā (Patentu tiesību līgums) un preču zīmju jomā (Singapūras līgums), izstrādātu standartus dizainparaugu reģistrācijas kārtībai. Reģionālo grupu tikšanās laikā Latvijas delegācija, paužot atbalstu paātrinātam darbam pie Dizainparaugu tiesību līguma, atgādināja, ka 2005. gadā tā bija viena no iniciatorēm priekšlikumam par minētā līguma izstrādes nepieciešamību.

Ģenerālajā asamblejā tika izskatīta arī virkne citu jautājumu (visi materiāli pieejami www.wipo.int).

Ģenerālās asamblejas laikā Latvijas delegācija tikās ar WIPO Centrāleiropas un Baltijas valstu nodaļas darbiniekiem un vienojās par sadarbību 2013. gadā. Plānā paredzēti divi semināri, kas veltīti izpratnes veidošanai par rūpniecisko īpašumu mazos un vidējos uzņēmumos, kā arī starptautisko preču zīmju aizsardzības procedūrām un starptautisko dizainparaugu aizsardzības procedūrām. Tāpat Ģenerālās asamblejas laikā notika Baltijas un Ziemeļvalstu grupas tikšanās, kuras ietvaros iestāžu direktori pārrunā ar rūpniecisko īpašumu saistītus jautājumus. Sanāksmes dalībnieki vienojās nākamo šāda veida sanāksmi rīkot Latvijā 2013. gada pirmajā pusē.

Notika arī tikšanās B+ grupas ietvaros, kurā dalībvalstis tika informētas par pašreizējo situāciju, meklējot risinājumus patentu materiālo tiesību harmonizācijai starptautiskā līmenī. Dažu valstu patentu iestādes un organizācijas (Eiropas Patentu iestāde, Eiropas Savienība, Austrālija, ASV) informēja par jauninājumiem starptautiskās sadarbības jomā.

* * *

Patentu valdes Preču zīmju un dizainparaugu departamenta vecākā eksperte Asja Dišlere Ženēvā (Šveice) no 8. līdz 14. oktobrim piedalījās Pasaules Intelektuālā īpašuma organizācijas rīkotajā Lokarno nolīguma par dizainparaugu starptautiskās klasifikācijas izveidošanu ekspertu komitejas vienpadsmitajā sesijā.

Sesijas darba gaitā tika izskatītas Lokarno nolīguma dalībvalstu intelektuālā īpašuma iestāžu piedāvātās izmaiņas un papildinājumi šobrīd spēkā esošajai dizainparaugu starptautiskās klasifikācijas devītajai redakcijai. Aktīvākie priekšlikumu iesniedzēji bija Zviedrijas, Vācijas, Ķīnas, Beniluksa valstu pārstāvji, no kuru piedāvātajiem ieteikumiem atbalstīti tika aptuveni 150, bet noraidīti 56. Darba gaitā tika atsaukti aptuveni 60 iesniegtie priekšlikumi.

Lai atvieglotu dizainparaugu meklēšanu datubāzēs, ekspertu komitejas desmitās sesijas laikā tika izteikts un atbalstīts priekšlikums izveidot klasifikatoru, kuru lietotu paralēli jau esošajam Lokarno klasifikatoram un izstrādājumus līdz ar to klasificētu, pamatojoties vienlaicīgi gan uz izstrādājuma funkciju, gan izstrādājuma formas īpatnībām. Darba veikšanai izveidoja pilotgrupu, kuras sastāvā iekļāva Beniluksa, Čehijas, Japānas, ITSB, Kanādas un ASV intelektuālā īpašuma iestāžu speciālistus. Pilotgrupas pārstāvis sniedza īsu atskaiti par paveikto klasifikatora projekta sagatavošanā. Tā kā darbs ir ļoti sarežģīts un darbietilpīgs, vēlēšanos aktīvi darboties šajā jomā izteica arī Francijas un Vācijas delegāciju pārstāvji, vienlaicīgi dodot cerības, ka aptuveni pēc diviem gadiem jauno klasifikatoru varēs piedāvāt izmēģināt testa režīmā.

* * *

9. oktobrī Minhenē (Vācija) notika Eiropas Patentu organizācijas Patenttiesību komitejas 42. sesija, kurā piedalījās Patentu valdes Izgudrojumu ekspertīzes departamenta vadošā eksperte Eiropas patentu jautājumos Māra Rozenblate un vecākā eksperte Karīna Akimova.

Sanāksmē izskatīja šādus jautājumus:

1. EPO prezentēja ziņojumu par aktualitātēm patentu materiālo tiesību (*substantive patent law*) harmonizācijas projektā. Šī projekta ietvaros pēdējos gados ir izveidota t.s. Tegernzē (*Tegernsee*) ekspertu grupa, kurā piedalās EPO, ASV, Japānas, Dānijas, Vācijas un Lielbritānijas patentu iestāžu vadītāji. Šīs grupas mandāts ir faktiskās situācijas konstatēšana attiecīgos tiesību jautājumos katrā minētajā jurisdikcijā un iespējamo harmonizācijas risinājumu jomu identificēšana. Šis ziņojums aptver aktuālāko informāciju par situāciju četrās jomās: labvēlības periods (*grace period*), 18 mēnešu pieteikumu publikācija, konfliktējošo pieteikumu jeb „slepenā tehnikas līmeņa” loma un iepriekšlietojuma tiesības. Ziņojums aptver 144 lappuses, bet tas tika izplatīts tikai 5. oktobra vakarā, tādēļ dalībnieki izteicās, ka līdz sanāksmei 9. oktobrī nav bijis iespējams ar to iepazīties, nerunājot par kāda viedokļa formulēšanu. EPO informēja, ka decembrī-janvārī plānotas konsultācijas ar sistēmas lietotājiem, šajā laikā arī citās dalībvalstīs varētu veikt līdzīgas konsultācijas, bet pēc tam Patenttiesību komitejā varētu lemt par turpmāko darbu.

2. Tika izskatīts dalībvalstu atbilžu apkopojums jau 2010. gadā izsūtītajai aptaujai par to, vai valstu likumos ir speciālas normas par Eiropas patenta uzturēšanas maksas iekasēšanu gadījumos, kad EPO Paplašinātā apelācijas padome pieņem lēmumu par pieteikuma izskatīšanas atsākšanu atbilstoši Eiropas Patentu konvencijas (EPK) 112a(5). panta nosacījumiem. Atbilžu apkopojums rāda, ka vairumā valstu speciāla regulējuma nav, taču vairākas valstis informēja, ka domā šo jautājumu risināt. EPO vēlētos saņemt no dalībvalstīm informāciju, lai to varētu ievietot EPO mājaslapas nacionālo valstu noteikumu apkopojumā attiecībā uz rīcību ar Eiropas patentiem.

3. Dānijas patentu iestāde vēlējās uzzināt citu valstu praksi jautājumā par dažiem tiesību atjaunošanas (*re-establishment of rights*) kritērijiem, jo tā ir konstatējusi, ka to pašu lietu Dānijā un Norvēģijā ir izsprieduši dažādi. Proti, runa ir par nosacījumu, vai var kā pierādījumu labi nostādītai darbu plūsmai birojā prasīt no pieteicēja „dubultpārbaudes” (*cross-check*) sistēmas ieviešanu. Dalībvalstis principā teica, ka šāda mehānisma ieviešanu nevar obligāti prasīt, taču visas teica, ka lūgumus par tiesību atjaunošanu vienmēr skata atsevišķi katrā lietā, vērtējot visu pierādījumu kopumu, nav nekādu metodisko norādījumu vai testu. Vairākas dalībvalstis teica, ka pamatā vadās pēc EPO apelācijas padomju prakses.

4. EPO izteica vēlmi grozīt Noteikumu par maksām 9. un 11. pantu. Tajos ir noteikts, ka tiek atmaksāta patentmeklējuma un ekspertīzes maksa, ja pieteikums tiek atsaukts vai noraidīts, vai uzskatīts par atsauktu laikposmā pirms iestāde sākusī gatavot patentmeklējuma ziņojumu vai tas nonāk Ekspertīzes departamenta atbildībā. EPO šos grozījumus pamatoja ar to, ka tā vēlas mudināt pieteicējus savlaicīgi atsaukt pieteikumus, par kuriem ir zudusi interese, vai vispār neiesniegt pieteikumus, ja nav nopietna nodoma saņemt patentu. Pašreiz šādi iesniegti, bet pieteicēju vairs neinteresējoši pieteikumi apgrūtina EPO darbu un veido lieku pieteikumu uzkrājumu, kā arī rada neskaidrības trešām personām.

Dalībvalstis uz šo priekšlikumu reaģēja negatīvi, jo uzskata, ka maksu atdošana par neveiktām darbībām ir principiāli svarīga. Dalībvalstis izteica šaubas, vai maksu neatmaksāšana ietekmēs pieteicēju uzvedību, jo tai pamatā var būt arī citi stratēģiski mērķi. Dažas valstis izteicās, ka ne vienmēr trešo personu intereses jāstāda augstāk par pieteicēju interesēm. Citas valstis izteicās, ka esošā sistēma ir apmierinoša, nav dzirdētas sūdzības šajā sakarā.

5. EPO sagatavojusi priekšlikumus PCT ekspertīzes vadlīniju papildināšanai ar noteikumiem, ka starptautiskās pirmējās ekspertīzes iestādes var veikt papildu patentmeklējumu, ja tās uzskata, ka var būt publicēta informācija, kuras nebija pamata patentmeklējuma veikšanas laikā, bet kas var būt noderīga reģionālajā/nacionālajā fāzē, lai pieņemtu labāk pamatotu lēmumu par patenta piešķiršanu/pieteikuma noraidīšanu. Šī papildinājuma mērķis ir iespējami daudz paveikt pieteikumu starptautiskajā fāzē, lai pieteicējiem un nacionālajām iestādēm jau savlaicīgi būtu pieejama iespējami pilnīga informācija, kas var ietekmēt pieteikuma likteni.

6. EPO informēja, ka no 2014. gada vairs neizdos savu oficiālo vēstnesi (*Official Journal*) papīra formātā.

* * *

10. oktobrī Minhenē notika Baltijas un Ziemeļvalstu patenta iestāžu patenta ekspertu darba grupas 26. sanāksme.

No Latvijas tajā piedalījās Patenta valdes Izgudrojumu ekspertīzes departamenta vadošā eksperte Eiropas patenta jautājumos Māra Rozenblate un Karīna Akimova, vecākā eksperte ķīmijas un biotehnoloģijas jomā.

Sanāksmē Dānija informēja, ka viņi sāk apzināt riskus, kādi var rasties nacionālajām patenta iestādēm, kad tiks ieviests vienotais Eiropas patents.

Zviedrija informēja, ka šai darba grupai tiks uzdots jauns uzdevums - visām valstīm lūgs veikt līdzīgu novērtējumu. Valstis vienojās, ka par pamatu

ņems Somijas patenta iestādes veikto vērtējumu, kurā vienotā patenta finansiālās ietekmes vērtēšana tika veikta pirms pāris gadiem. Pārējās valstis izstrādās savus vērtējumus un iespējamus rīcības scenārijus uz šī pamata.

Dānija informēja, ka drīzumā EPO Budžeta komitejā sāks skatīt jautājumu par vienotā patenta iespējamām maksām. Dānija vēlējas zināt, vai šīs grupas valstis varētu vienoties par vienota viedokļa izstrādi. Zviedrija informēja, ka viņu valdība grib, lai vienotais patents būtu iespējami lētāks. Taču tas var radīt finansiālas problēmas nacionālajām iestādēm, taču viņi pašlaik vēl par šo situāciju nedomā, jo Zviedrijai aktuālāka ir PCT pieteikumu skaita samazināšanās. Somija informēja, ka sāks iepazīstināt ar nākotnē iespējamo situāciju savu Finanšu ministriju, lai sāktu domāt par iestādes nākotnes finansēšanas modeli. Arī Dānija ir ieplānojusi konsultācijas ar lietotājiem tuvākajā laikā, pēc tam sāks veidot savu viedokli.

Somija informēja, ka no 2013. gada septembra tiek likvidēta patenta iestādes apelācijas padome un tiek nodibināta jauna, specializēta tiesa intelektuālā īpašuma administratīvo un civilstrīdu izskatīšanai. Turpmāk visus iestādes lēmumus varēs pārsūdzēt tikai šajā tiesā. Lietuva informēja, ka aktuālākais ir sagatavošanās darbs Eiropas Savienības prezidentūrai. No patenta iestādes šajā darbā ir iesaistīti 6 cilvēki. Norvēģija informēja, ka viņiem notiek apelācijas padomes pilnīga atdalīšana no patenta iestādes. 2013. gadā stāsies spēkā jauns likums par apelācijas padomi, kuras locekļus izvēlēsies atbildīgā ministrija. Islande informēja, ka viņiem ir nomainījusies visa vadība, ir pieņemti jauni patenta noteikumi, kuros apvienoti agrākie noteikumi ar vadlīnijām. Klienti ar šiem noteikumiem ir ļoti apmierināti. Pašlaik tiek veidots patenta e-reģistrs. Zviedrija informēja, ka valdība ir izveidojusi darba grupu patenta likuma modernizēšanai, kurā tiktu ietverts arī ar vienotā Eiropas patenta ieviešanu saistāmais regulējums. Igaunija informēja par grūtībām, kas radušās informācijas tehnoloģiju lietu centralizācijas sakarā. Darbu traucē nespēja operatīvi novērst radušās problēmas. Vidēji katras problēmas novēršana prasa 2 dienas. Dānija līdzīgi informēja, ka personālietu funkciju centralizācija viņiem ir sarežģījusi darbu, jo centralizētais dienests nespēj atrisināt specifiskas problēmas. Latvija informēja par jaunu darbinieku pieņemšanu pēc ilgiem laikiem, kā arī par to, ka jaunais likums par rūpniecisko īpašumu vēl joprojām nav pieņemts.

Vēl izskatīja jautājumu par patenta uzturēšanas maksām par Eiropas patentiem EPK 112a. panta izpratnē.

Šo jautājumu uzdeva Latvija, jo bija vēlme uzziņāt, kāda ir valstu prakse uzturēšanas maksu jautājumos, vai ir atšķirības noteikumos par Eiropas patenta uzturēšanu un nacionālo patenta uzturēšanu. Visas valstis informēja, ka situācija ir tāda pati kā Latvijā, proti, par abiem patenta veidiem uzturēšanas maksas regulē tās pašas normas. Zviedrija izteicās, ka EPK

112a. panta situācijās paredzētās uzturēšanas maksas būtu jāregulē atsevišķi un būtu labi, ja šajā jautājumā valstis varētu saskaņot savus viedokļus.

Latvija uzdeva jautājumu par Patenttiesību līguma (PLT) normām prioritātes perioda noteikšanā. Vēlējāmie pārliecināties, vai pareizi saprotam PLT 13.2 panta nosacījumu, ka gadījumos, kad ir nokavēts parastais prioritātes termiņš (12 mēneši), vēl 2 mēnešu laikā var prasīt prioritātes piešķiršanu, ja tiek pierādīti „all due care” apstākļi, kas faktiski nozīmē, ka prioritātes termiņš var būt 14 mēneši. Valstis apliecināja, ka tāpat to saprot arī citi. Visu saprātīgi iespējamo pūļu pierādīšana ir tāda pati kā citos tiesību atjaunošanas gadījumos. Zviedrijā jau ir bijuši vairāki šādi gadījumi, Dānijā - viens.

Islande uzdeva jautājumu par to, vai var pieņemt no izdalītā pieteikuma vēlreiz izdalītu pieteikumu, un kāds ir šādu pieteikumu iesniegšanas termiņš. Visas valstis informēja, ka var vairākkārt izdalīt pieteikumus no sākotnējā pieteikuma, bet to iesniegšanas termiņš katrā valstī nedaudz atšķiras. Principā to var darīt līdz lēmuma pieņemšanai par patenta piešķiršanu sākotnējā pieteikuma lietā.

Somija vēlējās zināt, vai Eiropas patenta apstiprināšanai tiek pieņemti mašintulkojumi. Zviedrija un Dānija informēja, ka pieņem jebkādu tulkojumu. Tulkojumi nekādi netiek pārbaudīti. Ja tulkojums nav adekvāts, tā ir īpašnieka atbildība, jo, ja tulkojums nav kvalitatīvs, ar to viņa tiesību apjoms ir izkropļots. Igaunija informēja, ka viņu likumā ir norma par to, ka tulkojumam jābūt labā igauņu valodā, tādēļ mašintulkokumu visticamāk nepieņems. Latvija informēja, ka eksperti pārbauda tulkojumus un iesaka labojumus, ja tulkojums ir slikts, taču, ja īpašnieks tos neatbalsta, tie netiek uzspiesti.

Lietuva izklāstīja vienu lietu, kas pašreiz atrodas apelācijas stadijā, kurā kā iemesls termiņa neievērošanai tika minēts, ka patentpilnvarotā birojā zināmas funkcijas veica pieredzējuši asistente, kura aizgāja no darba, un palikušās lietas tika uzticētas jaunai asistentei, bet patentpilnvarotais nepārliecinājās, vai kādai lietai netuvojas termiņš. Pārējās valstis informēja, ka tiesību atjaunošanas lietās noteikumu vai vadlīniju nav. Katrā lietā vērtē iesniegtā pierādījumu kopuma ticamību. Kā atsauce kalpo EPO prakse šajā jautājumā.

Jautājumus par papildu aizsardzības sertifikātiem valstis vienojās šoreiz neskatīt, jo novembrī Īrijas Patentu iestāde rīko speciālu sanākumi sertifikātu aktuālajos jautājumos. Vienojās apskatīt šos jautājumus nākamajā sanāksmē, jo varbūt Īrijā tiks noskaidroti vairāki no šajā sanāksmē plānotajiem jautājumiem.

* * *

10. un 11. oktobrī Alikantē (Spānija), Eiropas Savienības Iekšējā tirgus saskaņošanas birojā (preču zīmju un dizainparaugu jomā) (turpmāk - ITSB) notika

8. preču zīmju saziņas sanāksme (*8th Liaison Meeting on Trade Marks*).

Sanāksmes dalībnieki lielākoties bija preču zīmju reģistrācijas iestāžu darbinieki, kā arī starptautisko organizāciju – Pasaules Intelektuālā īpašuma iestādes (WIPO), Eiropas Kopienas preču zīmju asociācijas (ECTA), Starptautiskās preču zīmju asociācijas (INTA) un Eiropas preču zīmju īpašnieku asociācijas (MARQUES) pārstāvji. Pirmo reizi sanāksmē piedalījās pārstāvis no Serbijas. Latviju pārstāvēja Patentu valdes Preču zīmju un dizainparaugu departamenta Nacionālo zīmju nodaļas vadītāja Baiba Graube un Iebildumu un apelāciju nodaļas vadītājas p.i. Ilze Bukina.

Sanāksmes galvenais mērķis bija apzināt esošo pieredzi dalībvalstīs saistībā ar preču un pakalpojumu salīdzināšanu, preču zīmju ekspertīzi valodās, kuras nav oficiālās valstu valodas, kā arī valstu attieksmi pret pozīciju preču zīmēm.

Attiecībā uz preču un pakalpojumu salīdzināšanu valstis dalījās pieredzē par to, kā vērtēt gadījumus, kad patērētāji preces un/vai pakalpojumus, kas atrodas dažādās Nicas klasifikācijas klasēs, izmanto kopā. Vai šādā gadījumā var pieņemt, ka tie vienmēr būs līdzīgi?

Īpaši interesants bija jautājums par valodām, attiecībā uz kurām valstis veic preču zīmju ekspertīzi. Izrādījās, ka daudzas valstis veic ekspertīzi tikai vienā valodā (piemēram, Itālija, Francija u.c.), bet lielākajā daļā valstu tomēr bez oficiālās valsts valodas ekspertīzi veic arī angļu valodā. Tikai dažas valstis tāpat kā Latvija pārbauda reģistrācijai pieteiktā apzīmējuma nozīmi 5 valodās (latviešu, angļu, vācu, franču un krievu).

Attiecībā uz pozīciju preču zīmēm valstis secināja, ka vienīgi Šveices preču zīmju iestāde un ITSB šādas zīmes uzskata par īpašu, speciāli izdalāmu preču zīmju veidu (kategoriju). Pārējās valstis pieņem šādu zīmju reģistrācijas pieteikumus, tomēr ekspertīzi tām veic tāpat kā jebkurai figurālai vai telpiskai zīmei. Turklāt šādu preču zīmju pieteikumu skaits ir visai niecīgs.

Saziņas sanāksmes ietvaros tika ziņots arī par konverģences programmu (*The Convergence Programme*) attīstības gaitu; šo programmu mērķis ir, nemainot likumus, tuvināt dalībvalstu praksi preču zīmju jomā.

* * *

No 18. līdz 20. oktobrim Patentu valdes Preču zīmju un dizainparaugu departamenta Nacionālo zīmju nodaļas vecākā eksperte Inese Klišāne piedalījās Eiropas Savienības Iekšējā tirgus saskaņošanas birojā (preču zīmju un dizainparaugu jomā) (turpmāk – ITSB) organizētajā Konverģences darba grupas sanāksmē par klasifikācijas harmonizāciju (*CP 1: Harmonisation of Classification – New Initiative*) Alikantē (Spānija). Sanāksmē piedalījās 20 ES valstu, Starptautiskās preču

zīmju asociācijas (INTA), Eiropas preču zīmju īpašnieku asociācijas (MARQUES), Pasaules Intelektuālā īpašuma organizācijas (WIPO) un ITSB pārstāvji.

Šobrīd pastāv dažāda pieeja attiecībā uz Nicas klasifikācijas klašu virsrakstiem un to atbilstību klasifikācijas nolūkiem. Darba grupa izstrādāja 3 vadlīnijas, kas palīdzētu noskaidrot, kuri no 197 Nicas klasifikācijas klašu virsrakstu formulējumiem ir pietiekami skaidri un precīzi, tātad pieņemami klasifikācijas nolūkiem, un kuri nav.

1. vadlīnija

„Ja klašu virsrakstu apzīmējumi nav pietiekami skaidri un precīzi un nenosaka piešķirtās aizsardzības apjomu, tie ir tuvāk jāpaskaidro, norādot preču vai pakalpojumu veidu, nolūku un pielietojumu. Apzīmējumi, kas beidzas ar teikumu „kas nav ietverti citās klasēs” nav pieņemami tikai tajos gadījumos, ja šis apzīmējums neatbilst šīm vadlīnijām.”

Piemēri: mašīnas un darbmašīnas (7. kl.). Nicas klasifikācijas klašu virsraksta apzīmējums – „mašīnas” aptver preces, kurām var būt daudz nozīmju, un tas ir pārāk plašs, lai to varētu akceptēt preču sarakstos. Pieteicējam ir tuvāk jāpaskaidro, konkrēti kādu mašīnu aizsardzība tiek pieprasīta. Tas pats attiecas arī uz pakalpojumiem, kas ir atspoguļots *IP Translator* 45. paragrāfā (Pilns *IP Translator* sprieduma teksts angļu valodā, arī latviešu valodā pieejams Eiropas Savienības Tiesas mājaslapā – Court in case C-307/10). „Lai gan nav jāprecizē, konkrēti attiecībā uz kuru pakalpojumu vai kuriem pakalpojumiem tiek lūgta reģistrācija, jo šo pakalpojumu identificēšanai ir pietiekami izmantot vispārīgus formulējumus, tomēr reģistrācijas pieteicējam ir jāuzliek pienākums precīzi noteikt preces vai preču tipus, uz kuriem šie pakalpojumi attiecas, izmantojot, piemēram, citas, precīzākas norādes.” Piemēram, „remonts” (37. kl.) – virtuves iekārtu remonts.

Sanāksmē tika izteikts viedoklis, ka ierosinātā 1. vadlīnija, iespējams, ir plašāka un stingrāka par *IP Translator* lēmumā noteiktajām prasībām (īpaši 54. un 55. paragrāfā). Spriedumā norādīts, ka „daži Nicas klasifikācijas klašu nosaukumu vispārīgie apzīmējumi paši par sevi ir pietiekami skaidri un precīzi, lai ļautu kompetentajām iestādēm un uzņēmējiem noteikt preču zīmei piešķirtās aizsardzības apjomu, savukārt citi nespēj izpildīt šo prasību tādēļ, ka tie ir pārāk vispārīgi un aptver ļoti atšķirīgas preces vai pakalpojumus, lai varētu būt saderīgi ar preču zīmes kā izcelsmes norādes funkciju. Tādējādi kompetentajām iestādēm, lai noteiktu, vai šie apzīmējumi atbilst izvirzītajām skaidrības un precizitātes prasībām, katrā atsevišķā gadījumā vērtējums ir jāveic, ņemot vērā preces vai pakalpojumus, attiecībā uz kuriem reģistrācijas pieteicējs lūdz preču zīmes piešķirto aizsardzību.”

2. vadlīnija

„Dažus apzīmējumus, kas apzīmē preces vai pakalpojumus, kas pieder vienam tirgus sektoram var arī

izmantot, lai aprakstītu īpašas preces vai pakalpojumu veidus, kuri atrodami citos tirgus sektoros. Šajā gadījumā ir nepieciešams precizēt tikai tās preces vai pakalpojumus, kas neietilpst galvenajā tirgus sektorā.”

Ierosinātā 2. vadlīnija, galvenokārt, attiecas tikai uz 25. klasi. Tiek uzskatīts, ka apģērbi pieder pie viena galvenā tirgus sektora un tādējādi jāpaskaidro un jāprecizē tikai tie apģērbi, kas atrodami citos tirgus sektoros, proti, speciālie aizsargapģērbi ietilpst 9. klasē („aizsargapģērbi pret uguni, nelaimes gadījumiem”), speciālie medicīnas apģērbi 10. klasē („speciālie operāciju apģērbi”) un 18. klasē („dzīvnieku apģērbi”). Līdzīgi izņēmumi attiecas arī uz apaviem un galvassegām.

3. vadlīnija

„Nicas klasifikācijas klašu virsrakstu apzīmējumi ir jāizskata katrs atsevišķi saskaņā ar izvirzītajām vadlīnijām.

Piemērs: „Virves, auklas, tīkli, teltis, nojumes, brezents, buras, maisi un maisiņi, somas (izņemot citās klasēs ietvertos šo preču veidus)” (22. kl.).

Šis apzīmējums kopumā nav pieņemams tāpēc, ka „somas” ir pārāk plašs termins. Tomēr pārējie apzīmējumi ir akceptējami, ja pieteicējs novērsīs problemātisko terminu vai terminus.

Jāuzsver, ka latviešu valodā šīs klases virsrakstā angļu valodas vārds „bags” ir tulkots kā maisiņi, lai novērstu sajaukšanas iespējas ar 18. klasē ietvertajām somām.

Sanāksmē tika apspriestas iepriekš minētās vadlīnijas un to piemērošana Nicas klašu virsrakstiem. Tika apskatīti Nicas klašu virsrakstu apzīmējumi, analizēti, vai tie ir pietiekami skaidri un precīzi, lai varētu noteikt preces un pakalpojumus, vai arī pārāk neskaidri un plaši, kurus tuvāk jāpaskaidro. Jāuzsver, ka Nicas klasifikācijas klašu virsrakstu terminu izskatīšanu lielā mērā iespaidoja *IP Translator* spriedums (Court in case C-307/10).

Domas dalījās un tika nolemts, ka apspriešanu turpinās, jo jautājumu bija vairāk nekā atbilžu. Tomēr visiem bija skaidrs, lai kaut ko mainītu klašu virsrakstos, jāiesniedz priekšlikumi izskatīšanai WIPO.

Jāuzsver, ka Latvijas Patentu valde akceptē visus Nicas klasifikācijas klašu virsrakstus preču un pakalpojumu saraksta sastādīšanā, tikai jāievēro, ka Nicas klasifikācijas klašu virsraksti jēdzieniski neaptver visas preces vai pakalpojumus, kas pieder pie attiecīgās klases. Vienīgais izņēmums no Nicas klasifikācijas virsrakstiem, kuru Patentu valde neakceptē preču un pakalpojumu saraksta sastādīšanā ir 45. klases virsrakstā lietotais formulējums „privātie un sabiedriskie pakalpojumi personu individuālo vajadzību apmierināšanai”. Tas ir pārāk nekonkrēts klasifikācijas nolūkiem, tādēļ pakalpojumu sarakstā ir nepieciešams norādīt noteiktus šīs klases pakalpojumus, attiecībā uz kuriem ir paredzēts lietot preču zīmi, piem., „iepazīšanās biroju

pakalpojumi”, „laulību aģentūru pakalpojumi”, „apgārību noma”, „apbedīšanas biroju pakalpojumi”.

* * *

No 23. līdz 26. oktobrim Patentu valdes direktors Reinis Bērziņš un Izgudrojumu ekspertīzes departamenta direktors Guntis Ramāns Minhenē (Vācija) piedalījās Eiropas Patentu organizācijas 104. Budžeta un finanšu komitejas sēdē un 133. Administratīvās padomes sēdē.

Budžeta un finanšu komiteju pirmo reizi vadīja jaunais komitejas priekšsēdētājs – Grieķijas Patentu iestādes ģenerāldirektors Serafeims Stasins (*Serafeim Stasinos*).

Budžeta komitejā viens no svarīgākajiem jautājumiem bija saistīts ar Eiropas Patentu iestādes prezidenta priekšlikumu sakarā ar 2011. gada finanšu labajiem rezultātiem daļu (EUR 27656000) no saņemto maksājumu kopējā pārpalikuma EUR 89231639.57 piešķirt darbiniekiem par aktīvu darbu, kā kolektīvu atlīdzību (tāds gadījums bija pirmo reizi). Katram darbiniekam būs paredzēta noteikta summa, kas tiks koriģēta atkarībā no nostrādāto dienu skaita.

Komiteja izskatīja un atbalstīja priekšlikumu pagarināt uz nākamajiem trijiem gadiem maksu samazināšanu Eiropas patenta patentmeklējumam, ja to starptautiskajā fāzē ir veikusi kāda no starptautiskajām patentmeklējumu institūcijām.

Pēc starptautiska konkursa veikšanas ir noskaidrota kompānija, kas EPI veiks drukāšanas, fotokopēšanas un skenēšanas darbus turpmāko 5-10 gadu laikā par maksimālo summu EUR 23 miljoni. Uzvarētājs ir Xerox Nederland B.V.

Atskaitē par pensiju fondu darbību uzraudzības padomes vadītājs informēja komiteju, ka darba rezultāti būs labāki nekā 2011. gadā. Šajos sasniegumos lieli nopelni ir fonda menedžmenta komandai.

Dalībvalstis neatbalstīja paredzētās izmaiņas maksājumu noteikumos, kas paredzēja vienkāršot un samazināt iespējas pieteicējiem, piedaloties apelācijas vai iebildumu procedūrās, atgūt iztērēto naudu.

Prezidents informēja komiteju par sasniegtajiem rezultātiem 2012. gada plāna izpildē un par nākamā gada budžeta prognozēm. Paredzams, ka ienākumi šogad pārsniegs budžetā plānotos ienākumus par 51 miljonu EUR, kas galvenokārt saistīts ar lielākiem ienākumiem no ekspertīzes maksām un iekšējām un ārējām gada uzturēšanas maksām. Runājot par nākamā gada budžeta ienākumiem, kas balstīti uz pieņēmumu, ka 2013. gadā tiks iesniegti 257000 pieteikumi (2017. gadā šis skaitlis sasniegs 273000), paredzams ienākumu pieaugums par 3-4 %, salīdzinot ar 2012. gadu, ja vien izdevumi informācijas tehnoloģiju (IT) ceļa kartes īstenošanai neprasīs lielākus līdzekļus. Darbaspēka skaita izmaiņas (pašlaik 4172 eksperti)

nav paredzamas. Dalībvalstis atzīmēja iestādes labos rezultātus un vienbalsīgi atbalstīja budžeta projektu. Taču dalībvalstu pārstāvji arī brīdināja iestādi par patentu pieteikumu skaita samazināšanos, kas varētu radīt problēmas nākotnē.

Administratīvajā padomē atskaitē par iepriekšējo periodu EPI prezidents Benuā Batistelli (*Benoît Battistelli*) ziņojumā atzīmēja darba efektivitātes palielinājumu par 8 %, aktīvu darbu pie IT ceļa kartes izstrādes. Viņš sniedza īsu informāciju par nākamā gada budžetu un par jaunās mājas Hāgā projektēšanas gaitu. 2013. gadā tiks ieviesta arī EPI un ASV Patentu un preču zīmju iestādes izstrādātā jaunā klasifikācijas sistēma CPC (*Corporate Patent Classification*).

Padome vienbalsīgi piešķirta novērotāja statusu Melnkalnei Administratīvajā padomē un ITSB Eiropas Patentu organizācijas Akadēmijas Pārraudzības padomē.

Eiropas Patentu organizācijas Administratīvās padomes priekšsēdētājs ieskicēja nākamajā sēdē (2012. gada 11. līdz 13. decembrī) paredzēto diskusiju par organizācijas vadības principiem. Tie ietver trīs galvenos virzienus:

- organizācijas komiteju darbību;
- B28 padomes efektivitātes palielināšanu;
- iekšējā un ārējā audita struktūras.

Svarīgas bija arī debates saistībā ar EPI iekšējās apelācijas sistēmas reformu. Dalībvalstis atzina, ka jautājums jārisina un tā pieņemšanu nevar atlikt uz nākamo sēdi. Problēma ir apstākļi, ka Starptautiskās Darba organizācijas administratīvajā tribunālā (ILO-AT) no 425 iesniegtajām lietām 150 ir EPI darbinieku lietas, un ILO-AT ir paziņojusi, ka gadā izskatīs tikai 5 EPI darbinieku lietas. EPI priekšlikums paredzēja jauna veida iekšējās apelācijas sistēmas izveidi, kurā lietas tiktu apvienotas pēc to rakstura un samazināts arī dažādo apelācijas komiteju skaits. Pēc ilgām diskusijām tika panākta kopēja vienošanās.

Dalībnieki noklausījās Patentu komitejas, Budžeta un finanšu komitejas un Tehniskās un operāciju padomes priekšsēdētāju atskaites, Kipras (kā Eiropas Savienības prezidējošās valsts) ziņojumu par vienotā spēka patenta ieviešanas gaitu (problēmu risinājumi tiek nodoti nākamajai prezidentūrai – Īrijai). Apstiprināja Eiropas patentu attiecināšanas līgumu ar Tunisiju, piešķirta EPI mandātu darba līguma sagatavošanai ar Sanmarīno par patentmeklējumu veikšanu. Par Patentu komitejas priekšsēdētāja vietnieku tika ievēlēts Johanness Karhers (*Johannes Karcher*) no Vācijas Tieslietu ministrijas. Nākamo Patentu komiteju paredzēts sasaukt 2012. gada aprīlī.

Sēžu starplaikā Latvijas delegācija sāka sarunas par iespēju EPI sagatavot patentmeklējumu ziņojumus Latvijas nacionālajiem patentu pieteikumiem, līdzīgi kā to šajā sanāksmē izdarīja Sanmarīno.

Publikācijas par patenta pieteikumiem ir sakārtotas Starptautiskās patenta klasifikācijas (IPC) indeksu kārtībā. Starp svītrām ir izdalītas klases, kuras dotajam patentam nav pamatklase un, kur kreisajā pusē pēc uzrādītās klases izceltā šriftā uzrādīts patenta numurs, uz kuru attiecas dotā klase, kā arī labajā pusē pamatklases indekss. Publikācijas patentiem sakārtotas dokumenta numura kārtībā.

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

Tālāk ir paskaidroti Starptautisko standartu numerācijas (INID) kodi.

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

- (94) Papildu aizsardzības sertifikāta darbības termiņš.
Duration of the SPC.
- (95) Produkta nosaukums patentā.
Name of product in the basic patent.
- (96) Patentpieteikuma numurs, pieteikuma datums.
Number and date of patent application.
- (97) Patenta numurs, patenta publikācijas datums.
Number and date of the grant of basic patent.

Izgdrojumu pieteikumu publikācijas

A sekcija

A01N63/04 14608

- (51) **A21D13/08** (11) **14602 A**
(21) P-12-113 (22) 02.07.2012
(41) 20.11.2012
(71) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;
Lielā iela 2, Jelgava LV-3001, LV
(72) Daiga KUNKULBERGA (LV),
Solvita KALNIŅA (LV)
(54) **GRAUDAUGU BATONIŅU GATAVOŠANAS PAŅĒMIENS
A METHOD FOR PRODUCING CEREAL BARS**
(57) Izgdrojums attiecas uz graudaugu batoniņu ražošanas metodi. Tiek piedāvāts kā saistvielu batoniņu ražošanā izmantot glikozes-galaktozes sīrupu.

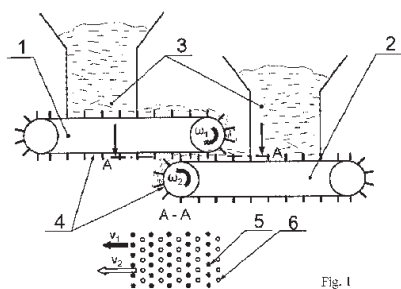
Invention relates to methods for producing cereal bars. The method provides for using glucose-galactose syrup as a binder.

**A61K31/205 14606
A61P9/00 14606**

B sekcija

- (51) **B01F13/00** (11) **14603 A**
(21) P-12-96 (22) 12.06.2012
(41) 20.11.2012
(71) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;
Lielā iela 2, Jelgava LV-3001, LV
(72) Imants NULLE (LV),
Aivars KAĶĪTIS (LV),
Dainis ANCĀNS (LV),
Mārtiņš OZOLLAPIŅŠ (LV)
(54) **BIRSTOŠU MASU MAISĪTĀJS
MIXER FOR BULK MATERIALS**
(57) Izgdrojums attiecas uz birstošu masu maisītājiem. Lai paplašinātu maisītāja funkcionālās iespējas, konveijeri ar izcīļņiem aprīkotām lentēm ir novietoti viens virs otra noteiktā attālumā, pie kam konveijeru lentes kustas ar saskaņotiem ātrumiem, veicot dozēto masu savstarpēju sajaukšanu. Piedāvātais maisītājs ir piemērots dažādu birstošu masu samaisīšanai.

The present invention concerns bulk material mixers. To increase functionality of bulk material mixer, the conveyors provided with knobby belts are placed above each other in determined height, and belts are moving with appropriate speeds. The mixer is recommended for mixing different kinds of bulk materials.



B01J29/00 14612

(51) B30B1/16 (11) 14604 A

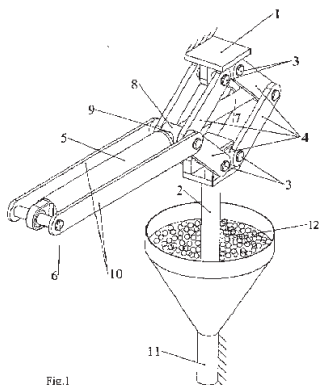
(21) P-12-95 (22) 12.06.2012

(41) 20.11.2012

(71) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;
Lielā iela 2, Jelgava LV-3001, LV(72) Ēriks KRONBERGS (LV),
Edgars REPŠA (LV)(54) HIDRAULISKS KOMPACTĒŠANAS MEHĀNISMS
HYDRAULIC COMPACTING MECHANISM

(57) Izgudrojums attiecas uz kompaktēšanas mehānismiem, kurus darbina ar hidraulisko piedziņu. Izgudrojuma mērķis ir ierīces funkcionālo iespēju paplašināšana, un tas ir īstenots, starp statni un presēšanas puansonu pievienojot simetriski ar šarnīru starpniecību vienāda garuma locekļu pārus, kas ir saistīti ar hidrauliskā cilindra šarnīriem. Piedāvātā mehānisma shēma ir parādīta Fig. 1. Kompaktēšanas mehānisma statnei 1 un puansonam 2 ar šarnīriem 3 ir pievienoti vienāda garuma locekļu pāri 4, kas ir saistīti ar hidrocilindra 5 šarnīriem 6. Konkrētos izgudrojuma izpildījuma variantos ir iespējams hidrocilindra 5 kātu 7 kustīgi savienot ar šarnīra tapu 8 caur atveri 9 un savienot šo tapu 8, izmantojot stieņus 10, ar hidrocilindra šarnīru 6. Statnei 1 ir piestiprināta presforma 11 ar kompaktējamo masu 12.

The invention relates to compacting machinery, powered by a hydraulic drive. Its purpose is to expand functional capacity of compacting mechanism by reducing the dimensions of the mechanism and providing possibility of punch operating at different inclination. It is provided by connecting press punch and frame via symmetrically added pairs of equal length links connected with the hydraulic cylinder pivots. The particular use in the design of compacting mechanism is connecting the rod of hydraulic cylinder with the pivot pin through the hole in it and linking this pivot pin with the pivot pin of the hydraulic cylinder barrel by means of rod links. The proposed hydraulic compacting mechanism is recommended for use in mobile devices where there is possibility of punch operating at different inclination. Compacting may be performed in closed dies and continuous-flow dies.



(51) B65G33/24 (11) 14605 A

(21) P-12-112 (22) 02.07.2012

(41) 20.11.2012

(71) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;

Lielā iela 2, Jelgava LV-3001, LV

(72) Juris PRIEKULIS (LV),

Ansis SALIŅŠ (LV),

Armīns LAURS (LV),

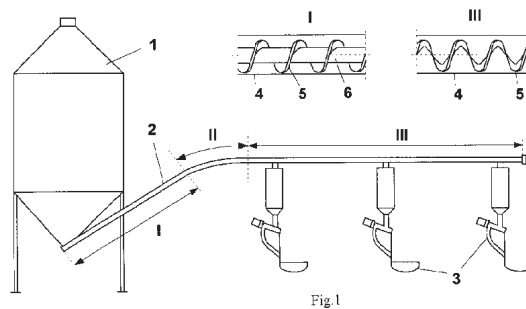
Artis VICINSKIS (LV)

(54) SPĒKBARĪBAS IZDALES LĪNIJA AR SPIRĀLTRANSPORTIERI

DISTRIBUTION OF COMBINED CONCENTRATED FEED USING SPIRAL CONVEYOR

(57) Izgudrojums attiecas uz lauksaimniecību, konkrēti – uz kombinētās spēkbarības izdali mājdzīvnieku novietnēs, lietojot spirāltransportieri. Mērķis tiek sasniegts, pārveidojot spirāltransportiera 2 slīpo posmu I (Fig.1) par gliemežtransportieri. Šim nolūkam spirāles 5 vidusdaļā ir ievietots elastīga materiāla serdenis 6, piemēram, elastīga plastmasas caurule, kura sniedz visa slīpā posma I garumā. Tādēļ, transportējot spēkbarību no bunkura 1 uz barības izēdināšanas stacijām 3, spēkbarība virzās uz priekšu bez būtiskām atpakajātbrīšanas iespējām. Turklāt šī transportiera slīpajā posmā I, kurš darbojas kā gliemežtransportieris, tiek radīts spēkbarības spiediens, kas papildus uzlabo barības virzīšanos arī transportiera izliektajā posmā II un horizontālajā posmā III. Izgudrojuma raksturīga pazīme ir tā, ka elastīgais serdenis 6 var atstāties ne tikai transportiera slīpajā posmā I, bet arī tā izliektajā posmā II, jo elastīgais serdenis pielāgojas apvalkcaurules 4 un spirāles 5 izliekumam.

The invention is related to agriculture, particularly to combined concentrated feed distribution at animal barns using the spiral conveyor. Its novelty is characterized in that the sloping part of the spiral conveyor is supplemented with a flexible material core in the spiral, for example, a flexible plastic pipe. Therefore, this part of the conveyor operates analogous to the snail conveyor ensuring that during work animal feed does not drop back through the middle part of the spiral, as well as pressure on animal feed is created that additionally facilitates its movement into the convex and horizontal part of the conveyor where the conveyor operates according to the spiral conveyor principle. The bend can be also in the sloping part of the conveyor as the flexible core (flexible pipe) in the spiral adapts to the bend of the coating pipe and the spiral.



B66C3/00 14610

C sekcija

C01B21/16 14606

C07C69/90 14606

(51) C07C243/12 (11) 14606 A

A61K31/205

A61P9/00

C01B21/16

C07C69/90

C07D311/46

(21) P-11-69 (22) 17.05.2011

(41) 20.11.2012

(71) TETRA, SIA; Aizkraukles iela 21, Rīga LV-1006, LV

(72) Ivars KALVIŅŠ (LV),
Anatolijs BIRMANS (LV),
Māris VĒVERIS (LV)

(54) **JAUNS XII FAKTORA INHIBITORS
NOVEL FACTOR XII INHIBITOR**

(57) Izgdrojumā aprakstīts meldonija acetilsalicilāts kā jauns XII faktora inhibitors un tā lietošana par antikoagulantu. Izgdrojumā papildus ir aprakstīta sinerģiska ārstnieciskā kombinācija, kas ietver meldonija acetilsalicilātu un varfarīna nātrija sāli pielietojumam par antikoagulantu.

The present invention provides meldonium acetylsalicylate as novel factor XII inhibitor and use thereof as anticoagulant agent. Further the present invention provides for synergistic therapeutic combination comprising meldonium acetylsalicylate and warfarin sodium for use as anticoagulant agent.

C07D311/46 14606

(51) **C11B9/02** (11) **14607 A**
(21) P-12-105 (22) 26.06.2012
(41) 20.11.2012

(71) LATVIJAS VALSTS MEŽZINĀTNES INSTITŪTS 'SILAVA'; Rīgas iela 111, Salaspils, Salaspils nov. LV-2169, LV

(72) Kaspars SPALVIS (LV),
Māris DAUGAVIETIS (LV),
Uldis DAUGAVIETIS (LV)

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

(54) **ĒTERISKO EĻĻU IEGUVES IEKĀRTA
ESSENTIAL OILS PRODUCTION CONSTRUCTION**

(57) Izgdrojums attiecas uz ķīmisko un farmaceitisko rūpniecību.

Izstrādāta ēterisko eļļu ieguves iekārta, kur nostādinātāja (7) apakšējā izeja (9) ar cauruļvadu (10) tiek pievienota vārstam (11), turklāt cauruļvads (10) aprīkots ar izvadu (12) gaisa piekļuvei, vārsts (11) ar cauruļvadu (13) pievienots tvaika vadam (2), vārsts (11) ar cauruļvadu (14) pievienots hidrosola savācējam (15), hidrosola savācējā (15) uzstādīti augšējā (16) un apakšējā (17) hidrosola līmeņa devēji, hidrosola savācējs (15) ar cauruļvadu (18) savienots ar vārstu (19), kurš ar cauruļvadu (20) savienots ar tvaika generatoru (1).

The invention relates to chemical and pharmaceutical industry.

Device of essential oils is worked out wherein the lower outlet (9) of separation tank (7) is linked to valve (11) with pipe (10), where the pipe (10) has an air outlet (12), the valve (11) is linked with steam pipe (2) by a pipe (13), the valve (11) is linked to collector (15) of hydrosol by pipe (14), the collector (15) of hydrosol is equipped by upper (16) and lower (17) sensors of hydrosol level in the collector (15), the collector (15) of hydrosol by pipe (18) is linked with valve (19), where the valve (19) is linked to steam generator (1) by pipe (20).

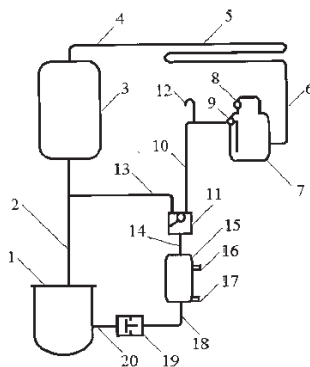


Fig.1.

(51) **C12N1/14** (11) **14608 A**
A01N63/04

(21) P-12-70 (22) 07.05.2012

(41) 20.11.2012

(71) LATVIJAS VALSTS MEŽZINĀTNES INSTITŪTS 'SILAVA'; Rīgas iela 111, Salaspils, Salaspils nov. LV-2169, LV

(72) Tālis GAITNIEKS (LV),
Alīna MIHAILOVA (LV),
Kari KORHONEN (FI)

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

(54) **BIOĻĢISKAIS LĪDZEKLIS SKUJU KOKU CELMU AIZSARDZĪBAI PRET HETEROBASIDION ANNOSUM S.L. BAZĪDIJSPORU INFEKCIJU
BIOLOGICAL AGENT FOR CONIFERS STUMP PROTECTION AGAINST HETEROBASIDION ANNOSUM S.L. BASIDIIONS SPP INFECTION**

(57) Izgdrojums attiecas uz mežsaimniecības nozari, mikoloģiju un mikrobioloģiju.

Izstrādāts jauns bioloģisks līdzeklis skuju koku celmu bioloģiskai aizsardzībai pret *Heterobasidion annosum s.l.* bazīdijsporu infekciju. Lietojot Latvijas izcelsmes sēnes *Phlebiopsis gigantea* jaunu izolātu G1 ar ģenētiskas sekvences 110 bāzu pāriem (bp) lokusā 18. Izolāts deponēts LMKK ar Nr. P1272.

The invention refers to forestry, mycology and microbiology.

A new biological preparation for conifers stump protection against *Heterobasidion annosum s.l.* basidiions spp. infection is worked out. Latvian native *Phlebiopsis gigantea* isolate G1 having 110 bp long genetic sequences in locus 18 is used. The isolate G1 is deposited in LMKK under No. P1272.

E sekcija

(51) **E05B31/00** (11) **14609 A**
(21) P-12-42 (22) 13.03.2012

(41) 20.11.2012

(31) PV 2011-262 (32) 05.05.2011 (33) CZ

(71) ASSA ABLOY Rychnov, s.r.o.; Strojnicka 633, 516 21 Rychnov nad Kněžnou, CZ

(72) Jiri HOLDA (CZ)

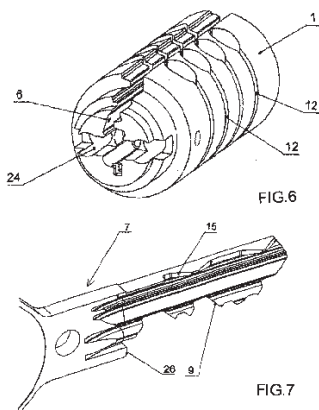
(74) Artis KROMANIS, PĒTERSONA PATENTS; p/k 61, Rīga LV-1010, LV

(54) **SLĒDZENE UN ATSLĒGA
LOCK AND KEY**

(57) Izgdrojums attiecas uz slēdzeni un atslēgu, pie kam slēdzeni ir divi koaksiāli bloķēšanas cilindri (1), katrs cilindrs ir šarnīrveidīgi grozāms pats savā apvalkā (2) un starp tiem atrodas aksiāli grozāms slēdzenes darba izcilnis (5). Izliektās radiālās rievās (12), kas ir izkārtotas gareniski cilindra (1) visa cilindriskā korpusa garumā, satur vismaz vienu rindu ar atsperēm nospriegotu pusmēness formas disku (11), kas slīdņveidīgi ir salāgoti ar minētajām radiālajām rievām (12), izmantojot to izvīrztījumus (13), kas ir izvietoti katrā diska (11) ārējā un stiepijas apvalkā (2) esošajās iekšējās radiālās rievās (20), pie kam minētie izvīrztījumi (13) viens attiecībā pret otru ir izkārtoti noteiktā leņķī un salāgojas ar aksiālajām rievām (14), kas atrodas uz apvalka (2) iekšējās cilindriskās virsmas. Aksiālo rievu (14) skaits un leņķiskā nobīde atbilst izvīrztījumu (13) skaitam un leņķiskajai nobīdei, pie tam atsevišķu disku (11) izvīrztījumu (13) pārbīdi atbilstošajās aksiālajās rievās (14) realizē pirmais kodējums (15), kas ir izveidots vienas kores malas vai slēdzenes plakanās atslēgas (7) attiecīgajā sēnmalā, kurā pēc atslēgas (7) ievietošanas slēdzenē elastīgi iespiežas diski (11). Cilindra (1) pagriešanās novēršanai pēc autorizētas plakanās atslēgas (7) ievietošanas, cilindrā (1) ir ievietota ierobežojošā tapa (21) zonā, kas ir minētā cilindra (1) iekšējā galā, pie kam ierobežojošās tapas (21) ārējā izvīrztītā daļa ir slīdņveidīgi iemontēta apvalkā (2) izveidotajā garenrievā (22), kura darba izcilņa (5) virzienā ieiet apvalka (2) radiālajā rievā (23). Darba stāvoklī, pēc autorizētas plakanās atslēgas (7) ievietošanas, visi diski (11) ir pagriezti tā, ka to ārējie izvīrztījumi (13) sakrīt ar gareniskajām aksiālajām rievām (14), un pēc cilindra (1) iespiešanās slēdzenē

plakanās atslēgas (7) kāta apturdaļas (26) ietekmē cilindra (1) aksiālo pārbīdi ierobežojošā tapa (21) izvietojas apvalka (2) radiālajā rievā (23) noteiktā aksiālā pozīcijā, lai secīgi pagrieztu apvalkā (2) esošo cilindru (1).

The invention pertains to lock and key, where the lock has two co-axial locking cylinders (1), each cylinder is pivoting in its own housing (2) and between them the axially pivoting operating cam (5) of the lock is located. The arched radial grooves (12), arranged lengthwise along the cylindrical body of the cylinder (1), contain at least one row of spring-loaded crescent-shaped discs (11), which are slide-guided in these radial grooves (12) by means of their protrusions (13) located on the outer side of each lamella (11) and reaching into the inner radial grooves (20) in the housing (2). Said protrusions (13) are angularly set off from each other and cooperate with the axial grooves (14) in the inner cylindrical surface of the housing (2). The number and angular offset of the axial grooves (14) corresponds to the angular offset of the protrusions (13). The shift of the protrusions (13) of individual discs (11) into the corresponding axial groove (14) is operated by the first coding (15), created on one side of the ridge or in the corresponding lateral side of the flat key (7) of the lock, into which the lamella (11) is flexibly pushed after the insertion of the key (7) into the lock. To prevent the turning of the cylinder (1) after the insertion of an authorised flat key (7), a limiting pin is inserted in the cylinder (1) in the area of the inner end of this cylinder (1). The outer protruding part of the limiting pin (21) is arranged to slide in the longitudinal groove (22), created in the housing (2), which, in the direction towards the operating cam (5), passes into the radial groove (23) of the housing (2). In the functional position after the insertion of an authorised flat key (7), in which all discs (11) are turned so that their outer protrusions (13) match the longitudinal axial grooves (14), and then after pushing the cylinder (1) into the lock by the effect of the stop part (26) of the shank of the flat key (7), the limiting pin (21) of the axial shift of the cylinder (1) is situated in the radial groove (23) of the housing (2) in the defined axial position for the subsequent turning of the cylinder (1) in the housing (2).



(57) Izgdrojums attiecas uz svārstību slāpētājiem, jo īpaši uz svārstību slāpētājiem ar disku bremzēm. Darba elementu svārstību slāpētājs (1) satur augšējo daļu (2), kurai ir vismaz divas ausis (4), un apakšējo daļu (3), kurai ir vismaz divas ausis (5), pie kam starp augšējās daļas (2) ausīm (4) un apakšējās daļas (3) ausīm (5) ir izvietoti bremžu diski (6a, 6b; 7a, 7b). Svārstību slāpētājs (1) ir raksturīgs ar to, ka augšējā daļā (2) starp tās divām ausīm (4) izveidotajā izgriezumā ir izvietots bremžu disku (6a, 6b; 7a, 7b) spriegošanas mehānisms (10) un tam paredzētais vadības līdzeklis (30), kas nodrošina bremžu disku (6a, 6b; 7a, 7b) saspiešanu, slāpējot piekares svārstības.

The invention refers to swing dampers, in particular to the swing dampers with disc brakes. Swing damper (1) for damping work elements comprises an upper part (2) having at least two lugs (4) and a lower part (3) having at least two lugs (5), where brake discs (6a, 6b; 7a, 7b) are arranged between lugs (4) of upper part (2) and lugs (5) of lower part (3). Swing damper (1) is characterized in that a tensioning element (10) and associated control means (30) are provided in the cut-out "a" between two lugs (4) in the upper part (2) providing a pressing of brake discs (6a, 6b; 7a, 7b) therefore damping a swing.

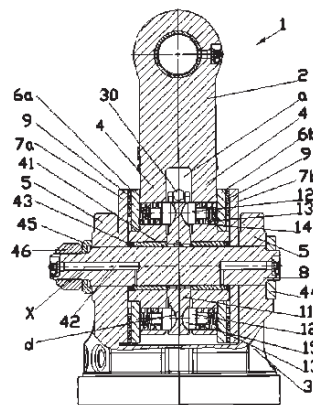


Fig. 2

F sekcija

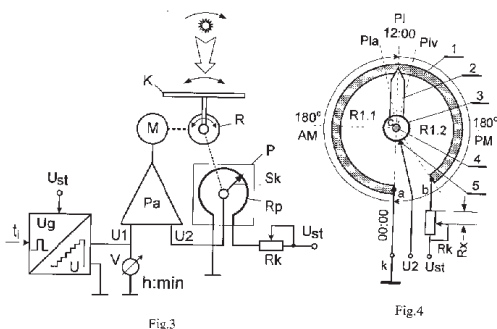
- (51) **F16F7/02** (11) **14610 A**
B66C3/00
 (21) P-11-62 (22) 02.05.2011
 (41) 20.11.2012
 (71) BALTRATORS, SIA; Institūta iela 1, Salaspils, Salaspils nov. LV-2169, LV
 (72) Andris MARTINSONS (LV)
 (74) Armīns PĒTERSONS; PĒTERSONA PATENTS, p/k 61, Rīga LV-1010, LV
 (54) **SVĀRSTĪBU SLĀPĒTĀJS AR DISKU BREMZĒM UN TO REGULĒŠANAS MEHĀNISMS**
SWING DAMPER WITH DISK BRAKES AND CONTROL MECHANISM THEREOF

- (51) **F24J2/00** (11) **14611 A**
F24J2/40
 (21) P-12-94 (22) 12.06.2012
 (41) 20.11.2012
 (71) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;
 Lielā iela 2, Jelgava LV-3001, LV
 (72) Henriks PUTĀNS (LV),
 Imants ZIEMELIS (LV),
 Viktorija ZAGORSKA (LV),
 Liene KANCEVIČA (LV)
 (54) **SAULES ENERĢIJAS KOLEKTORA VADĪBAS IERĪCE, KAS NODROŠINA TĀ SEKOŠANU SAULEI**
CONTROL DEVICE FOR SOLAR COLLECTOR TRACKING THE SUN

(57) Izgdrojums attiecas uz saules enerģijas kolektora vadības ierīci, kura nodrošina tā sekošanu saulei. Ierīcē ir izmantots griešanas ap polāro asi princips, un tā sastāv no motora-reduktora, potenciometra, diennakts laikā lineāri pieaugoša sprieguma ģenerators, ģenerators un potenciometra spriegumu salīdzināšanas-pastiprināšanas bloka, pie kam motora-reduktora sekundārā vārpsta ir savienota ar saules enerģijas kolektoru un potenciometra piedziņas asi, potenciometra un sprieguma ģenerators izejas spriegumu elektriskās ķēdes ir pieslēgtas sprieguma salīdzināšanas-pastiprināšanas bloka izejas sprieguma ķēdēm, bet sprieguma salīdzināšanas-pastiprināšanas bloka izejas ķēde ir saslēgta ar motora-reduktora izejas sprieguma ķēdi. Piedāvātā vadības ierīce ir raksturīga ar to, ka, lai uzlabotu ierīces tehniskos rādītājus un paaugstinātu kolektora orientēšanas uz sauli precizitāti, virknē ar potenciometra pretestību ir ieslēgta maiņpretestība, kuras otra spāile ir pieslēgta pie barošanas sprieguma, bet potenciometra otra spāile ir pieslēgta pie elektriskās ķēdes kopējā vada. Lai vienkāršotu

saules kolektora orientēšanu uz sauli, mainīgās pretestības ass ir aprīkota ar rādītāju un skalu, kas graduēta saskaņā ar laika vienādojumu.

The invention pertains to control device for tracking the sun solar energy collector. Its construction is based on the principle of rotation around the polar axis. The device consists of a motor-gearbox, a potentiometer, the voltage generator with linearly increasing voltage depending on the time of a day, a generator and the potentiometer block for voltage reference-amplification. The motor-gearbox secondary shaft is connected with the solar collector and the potentiometer's driving axis. The output voltage electric circuits of the potentiometer and the voltage generator are connected to the input voltage electrical circuits of the voltage reference-amplification block. The output voltage electric circuit of the voltage reference-amplification block is connected to the motor-gearbox input voltage circuit. In order to improve the device's technical parameters and to rise the collector's tracking the sun accuracy, the construction of the device was improved by connecting the potentiometer's resistor in series with a variable resistor, which second clamp is connected to the voltage. The second clamp of the potentiometer is connected to the common electric circuit. In order to simplify the solar collector's orientation to the sun, the variable resistor's axis is equipped with indicator and scale, which is graduated using time equation.



mas un dažāda skaita atšķirīgu līmeņu kameras, tā piemērojot reģeneratora ražīgumu bioetanola dehidratēšanas mezgla ražīgumam. Ūdens atdalīšana no granulām notiek termiskā ceļā, apakšējā kamerā no kurtuves ievadot dūmgāzes, kas pēc tam izplūst cauri visām kamerām. Ūdeni no iekārtas izvada tvaika stāvoklī caur tvaika izvadiem, kas izveidoti katras kameras līmenī. Kameras vienu no otras atdala dūmgāzu plūsmas virziena maiņas plaukti.

A regenerator of the pipe grid water adsorbent granules is provided for the restoration of the working efficiency of the used granules, which is necessary when a congruent dehydration technology of bio-ethanol is applied. In any place of the regenerator its pipes, collectors, inlets and outlets are arranged in a slanting position exceeding the angle of natural falling of the granules. This ensures continuous, reliable pouring of the granules inside the equipment and active heat exchange. The pipe grids can be completed in a number of ways, forming a variety of flows and chambers of different levels so adjusting the regenerator efficiency to the efficiency of the bio-ethanol dehydration unit. Water separation from the granules proceeds in a thermal way by introducing flue gases into the bottom chamber from the furnace which afterwards flows through all the chambers. The water in vaporous state is removed from the equipment through the heat outlets provided on the level of each chamber. Chambers are separated from each other by shelves that change the direction of the flue gas flow.

F26B15/00 14612 F26B3/00

F24J2/40 14611

(51) F26B3/00 (11) 14612 A
F26B15/00
B01J29/00

(21) P-11-68 (22) 16.05.2011
(41) 20.11.2012

(71) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTES AĢENTŪRA 'LAUKSAIMNIECĪBAS TEHNIKAS ZINĀTNISKAIS INSTITŪTS'; Institūta iela 1, Ulbroka, Stopiņu nov. LV-2130, LV;

LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;
Lielā iela 2, Jelgava LV-3001, LV

(72) Gunārs BRĒMERS (LV),
Ādolfs RUCIŅŠ (LV),
Arnolds ŠĶĒLE (LV),
Gints BIRZIETIS (LV),
Arturs BALTIŅŠ (LV)

(54) **BIOETANOLA PUSSAUSĀS KONGRUENTĀS DEHIDRATĒŠANAS IEKĀRTAS ADSORBENTA GRANULU REĢENERĀCIJAS BLOKS**
BLOCK OF BIO-ETHANOL'S SEMI-DRY CONGRUENT DEHYDRATION APPARATUS FOR REGENERATION OF ADSORBENT GRANULES

(57) Ūdens adsorbenta granulu cauruļu režģu reģenerators, kurš paredzēts izmantoto granulu darba spēju atjaunošanai, kas nepieciešams, realizējot bioetanola kongruentās dehidratēšanas tehnoloģiju. Reģeneratora konstrukcijā ietilpstošās caurules, kolektori, ievadi un izvadi, jebkurā vietā novietoti slīpi, pārsniedzot granulu dabiskās biršanas leņķi. Tas nodrošina granulu nepārtrauktu drošu pārbiršanu iekārtā un aktīvu siltuma apmaiņu. Caurules režģus var komplektēt dažādā skaitā, veidot dažāda skaita plūs-

Izgdrojumu patentu publikācijas

- (51) **G01N33/49** (11) **14437 B**
 (21) P-10-66 (22) 29.04.2010
 (45) 20.11.2012
 (73) RĪGAS STRADIŅA UNIVERSITĀTE; Dzirciema iela 16, Rīga LV-1007, LV;
 INTERNATIONAL CLASSIC COSMOENERGY FEDERATION; Staiceles iela 1/3-31, Rīga LV-1035, LV
 (72) Emīls BAGIROVS (LV),
 Jeļena KRASILŅIKOVA (LV),
 Viktors BAIDAK (LV),
 Irina SERGELIS (LV),
 Māra GIRGENSONE (LV)
 (74) Ludmila IVANOVA; Dzirciema iela 16, Rīga LV-1007, LV
 (54) **SIRDS ASINSVADU PATOLOĢIJAS EFEKTĪVAS ĀRSTĒŠANAS NOTEIKŠANAS PAŅĒMIENS GADOS VEČĀKIEM CILVĒKIEM AR 2. TIPIA CUKURA DIABĒTU**

(57) 1. Sirsds asinsvadu patoloģijas efektīvas ārstēšanas noteikšanas paņēmieni gados vecākiem cilvēkiem ar 2. tipa cukura diabētu (insulīnneatkarīgais tips) atšķiras ar to, ka nosaka totālo antioksidantu statusu (TAS) asins plazmā ar spektrometrijas metodi un glikozes līmeni asinīs ar enzīmololoģisko metodi pirms un pēc ārstēšanas kursa; ja pēc ārstēšanas kursa totālais antioksidantu statuss (TAS) ir 1,65 mmol/l un glikozes līmenis – 6,0 mmol/l, tas liecina par ārstēšanas kursa efektīvāti, bet ja pēc ārstēšanas kursa totālais antioksidantu statuss (TAS) ir 1,2 mmol/l un glikozes līmenis – 7,0 mmol/l vai augstāks, tas liecina par ārstēšanas kursa neefektīvāti.

- (51) **A61K35/20** (11) **14500 B**
A23L1/09
A23L1/305
 (21) P-11-173 (22) 21.12.2011
 (45) 20.11.2012
 (73) RĪGAS STRADIŅA UNIVERSITĀTE; Dzirciema iela 16, Rīga LV-1007, LV;
 ANIMA LAB, SIA; Rātsupītes iela 5, Rīga LV-1067, LV
 (72) Guntis VĪTOLS (LV),
 Lilija PEŠKOVA (LV),
 Jevgeņijs JERMOLAJEVŠ (LV)
 (74) Ludmila IVANOVA; Dzirciema iela 16, Rīga LV-1007, LV
 (54) **UZTURA BAGĀTINĀTĀJS AR PRETVĒŽA, HEPATOPROTEKTORĀM UN IMŪNMODULĒJOŠĀM ĪPAŠĪBĀM**

(57) 1. Uztura bagātinātājs ar pretvēža, hepatoprotektorām un imūnmodulējošām īpašībām raksturīgs ar to, ka satur pirmpienu, *beta*-glikānus un glikopeptīdus sekojošā daudzumā (mg):

pirmpiens	100,0 – 1000,0;
<i>beta</i> -glikāni	0,2 – 250,0;
glikopeptīdi	0,1 – 50,0.

2. Uztura bagātinātājs saskaņā ar 1. pretenziju raksturīgs ar to, ka tiek izmantots pirmpiens galvenokārt no govju piena, *beta*-glikāni galvenokārt no sēnēm, glikopeptīdi galvenokārt no pienskābām baktērijām *Lactobacillus helveticus*.

- (51) **C02F1/32** (11) **14555 B**
B01J47/00
B01D36/00
 (21) P-11-01 (22) 03.01.2011
 (45) 20.11.2012
 (73) Jānis FRIDRIHSONS; Maskavas iela 254 k-2 - 54, Rīga LV-1063, LV
 (72) Jānis FRIDRIHSONS (LV)
 (54) **ŪDENS DZIEDNIECISKĀS APSTRĀDES IEKĀRTA**

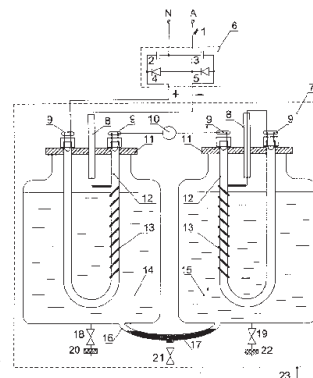
(57) 1. Ūdens dziednieciskās apstrādes iekārta, kas sastāv no vienas U-tipa baltās gaismas starojuma luminiscences spuldzes, kura ir ievietota tās hidrotermisko balasta pretestību veidojošajā neaktivizētā ūdens traukā un kura no spuldzes korpusa virsmas kontaktplāksnītēm ir tieši pievienota vienfāzīgam elektrotīklam,

atšķirīga ar to, ka, ar mērķi paaugstināt iekārtas efektivitāti un jonizētā ūdens dziedniecisko iedarbību, iekārta ir izveidota no diviem, lejasdaļā ar stikla cauruli savienotiem, aktivizējamā ūdens traukiem.

2. Iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas atšķirīga ar to, ka abos ūdens traukos ievietotās dezinficējošās ultravioletā starojuma U-tipa luminiscences spuldzes no korpusu virsmas ar spirālveida nerūsējošā tērauda stieples elektrodiem ir pieslēgtas vienfāzīgam elektrotīklam caur sprieguma dubultotāju.

3. Iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas atšķirīga ar to, ka ūdenim ir pievienots tāds veselībai nekaitīga ķīmiskā sastāva koagulators, piemēram, māls, kurš savienojošās stikla caurules lejasdaļā automātiski izveido anjonu un katjonu frakcijas atdalīšanu nogulšņu hidroizvaru.

4. Iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas atšķirīga ar to, ka abi ūdens trauki to lejasdaļās ir aprīkoti ar krānu un ogles filtraiem, kas ļauj selektīvi savākt aktivizētā ūdens atsevišķās frakcijas un iegūt no nogulsnēm attīrītu un antibakteriāli apstrādātu dzeramo ūdeni, sajaucot vienādās proporcijās ar anjoniem un katjoniem bagātinātās ūdens frakcijas.



- (51) **A23K1/16** (11) **14559 B**
A23K1/18
A23K1/02
 (21) P-12-68 (22) 02.05.2012
 (45) 20.11.2012
 (73) SF 17, SIA; Matīsa iela 44A-38, Rīga LV-1009, LV
 (72) Joachim SCHULTHEISS (LV)
 (74) Jevgeņijs FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA; a/k 98, Rīga LV-1050, LV
 (54) **DZĪVNIEKU BARĪBA**

(57) 1. Sīklopu, tai skaitā aitu barība, kas satur miežus, melases ekstraktu, placinātas rapšu sēklas, kviešus, rapšu raušus, kalcija karbonātu, cukurniedru melasi, nātrija hlorīdu un uzturfizioloģiskās piedevas šādās komponentu attiecībās, g/kg: mieži no 220 g līdz 370 g, labāk no 290 g līdz 310 g, melases ekstrakts no 190 g līdz 230 g, labāk no 210 g līdz 225 g,

placinātas rapšu sēklas no 160 g līdz 190 g, labāk no 170 g līdz 180 g,

kvieši no 120 g līdz 150 g, labāk no 135 g līdz 140 g, rapšu rauši no 70 g līdz 115 g, labāk no 90 g līdz 100 g, kalcija karbonāts no 23 g līdz 40 g, labāk no 30 g līdz 35 g, cukurniedru melase no 17 g līdz 35 g, labāk no 23 g līdz 30 g, nātrija hlorīds no 5 g līdz 15 g, labāk no 7 g līdz 10 g, uzturfizioloģiskās piedevas no 2 g līdz 95 g.

2. Sīklopu barība saskaņā ar 1. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka uzturfizioloģiskās piedevas satur vienu vai vairākus komponentus, kas ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no: A vitamīna, D3 vitamīna, E vitamīna, C vitamīna, mangāna, cinka, joda, kobalta, selēna.

3. Sīklopu barība saskaņā ar 1. pretenziju, kurā uzturfizioloģiskās piedevas satur šādus komponentus šādos daudzumos, mg/kg vai SV/kg:

A vitamīns	no 10000 SV līdz 15000 SV,
D3 vitamīns	no 1200 SV līdz 1600 SV,
E vitamīns	no 10 mg līdz 30 mg,

mangāns no 10 mg līdz 30 mg,
cinks no 10 mg līdz 30 mg,
jods no 0,1 mg līdz 0,17 mg,
kobalts no 0,1 mg līdz 0,5 mg,
selēns no 0,3 mg līdz 0,6 mg.

4. Sīklopu barība saskaņā ar 1. pretenziju, kurā uzturfizioloģiskās piedevas sastāv no komponentiem šādos daudzumos, mg/kg vai SV/kg:

A vitamīns no 11000 SV līdz 12500 SV,
D3 vitamīns no 1300 SV līdz 1500 SV,
E vitamīns no 17 mg līdz 23 mg,
mangāns no 17 mg līdz 23 mg,
cinks no 17 mg līdz 23 mg,
jods no 0,1 mg līdz 0,17 mg,
kobalts no 0,1 mg līdz 0,5 mg,
selēns no 0,3 mg līdz 0,6 mg.

(51) **A63G31/16** (11) **14571 B**
B64D25/02

(21) P-12-119 (22) 11.07.2012
(45) 20.11.2012

(73) Ivars BEITĀNS; Līvkalni-2, Pēteralas iela, Sigulda, Siguldas nov. LV-2150, LV

(72) Ivars BEITĀNS (LV)

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

(54) **VERTIKĀLAM VĒJA TUNELIM PAREDZĒTA DROŠĪBAS SISTĒMA**

(57) 1. Drošības sistēma, kas paredzēta vertikālam vēja tunelim, kurš satur rāmīveida konstrukciju (1) ar tajā iemontētu vertikālas gaisa plūsmas ģeneratoru (2), pie kam virs vertikālā plūsmas ģeneratora (2) atrodas lidojuma platforma (3), kuru veido triecienus slāpējošs matracis (4) un drošības tīkls (5), kas atrodas virs vertikālās plūsmas ģeneratora (2), raksturīga ar to, ka sistēma papildus satur elastīga materiāla aploci (10), kurā ir iestiprināts minētais tīkls (5), un minētā elastīgā materiāla aploce (10) ir piestiprināta pie triecienus slāpējošā matrača (4).

2. Drošības sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka virs minētās aploces (10) papildus ir izvietots triecienus slāpējošs matracis (4), kas nosedz minēto aploci (10).

3. Drošības sistēma saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka aploce (10) ir veidota no elastīga materiāla, vēlams no stiklšķiedras.

4. Drošības sistēma saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka aploce (10) papildus ir aprīkota ar polsterējošu apdari.

5. Drošības sistēma saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka aploce (10) ir savienota ar matraci (4), izmantojot Velcro® tipa savienojumu (12).

6. Drošības sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka minētais drošības matracis (4) aptver vertikālās gaisa plūsmas ģeneratoru (2), neveidojot starp tiem gaisa kabatas.

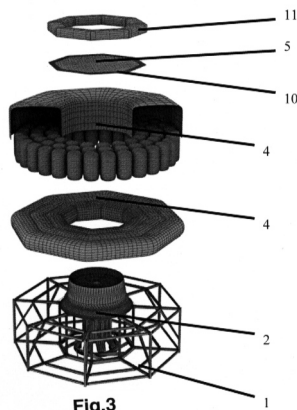


Fig.3

(51) **B66C13/06** (11) **14574 B**

(21) P-11-18 (22) 11.02.2011

(45) 20.11.2012

(73) BALTRORS, SIA; Institūta iela 1, Salaspils, Salaspils nov. LV-2169, LV

(72) Andris MARTINSONS (LV)

(74) Armīns PĒTERSONS, PĒTERSONA PATENTS; a/k 61, Rīga LV-1010, LV

(54) **SVĀRSTĪBU SLĀPĒTĀJS AR DISKU BREMZĒM**

(57) 1. Svārstību slāpētājs (1) darba elementa svārstību slāpēšanai, kurš satur augšējo daļu (2), kuru savieno ar piekari, un apakšējo daļu (3), kuru savieno ar rotoru, pie kam: augšējā daļa (2) un apakšējā daļa (3) ir šarnīrveidīgi savienotas viena ar otru; starp augšējo daļu (2) un apakšējo daļu (3) ir izvietoti diski (7, 8, 9, 10, 11), kas var šūpoties ap centra asi (6); vismaz viens no minētajiem diskiem (7, 8) ir nodrošināts pret rotācijas iespēju attiecībā pret augšējo daļu (2) un vismaz viens no minētajiem diskiem (9, 10, 11) ir nodrošināts pret rotācijas iespēju attiecībā pret apakšējo daļu (3).

kas raksturīgs ar to, ka augšējā daļa (2) un apakšējā daļa (3) ir šarnīrveidīgi savienotas viena ar otru, izmantojot veselu centra tapu (14), un ar to, ka svārstību slāpētājs (1) satur piespiedējelementus (20, 21, 22), kas darbojas, lai svārstību bremsēšanas operācijas laikā saspiestu kopā diskus (7, 8, 9, 10, 11), pie kam piespiedējelementi (20, 21, 22) ir ievietoti vismaz vienā vai vairākos diskos (7, 8, 10, 11).

2. Svārstību slāpētājs (1) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka piespiedējelementi ir ieliktnis (20), savilcējelements (21) un atspere (22).

3. Svārstību slāpētājs (1) saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka ieliktnī (20) aksiālā virzienā un ap tā centra asi ar atstarpi ir izveidotas vairākas ligzdas (23), vēlams divpadsmit ligzdas (23), pie kam katrā ligzdā (23) ir izvietots savilcējelements (21) un atspere (22).

4. Svārstību slāpētājs (1) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka ieliktnis (20) ar vismaz vienu augšējās daļas (2) disku (7, 8) ir savienots caur ritgultni (71, 81), pie kam vismaz viens apakšējās daļas (3) disks (9, 10, 11) ir uzmontēts slīdsēžā uz ieliktna (20).

5. Svārstību slāpētājs (1) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka, lai vadītu piespiedējelementu (20, 21, 22) piespiedējspēku, svārstību slāpētājs (1) papildus satur piespiedējelementu (20, 21, 22) vadības palīgierīci (30), kas satur skrūvi (35), ar kuru regulē piespiedējspēku, piespiedēju (34), uzgriezni (33) un pārvietojamu ieliktni (32a), ar kuru palīdzību skrūves (35) pārvietojums tiek pārvadīts uz diskveida plāksni (31), kas balstās pret savilcējelementiem (21).

6. Svārstību slāpētājs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka vismaz viens apakšējās daļas (3) disks (9) ir uzmontēts slīdsēžā uz centra tapas (14) un kalpo kā nekustīgais disks (9).

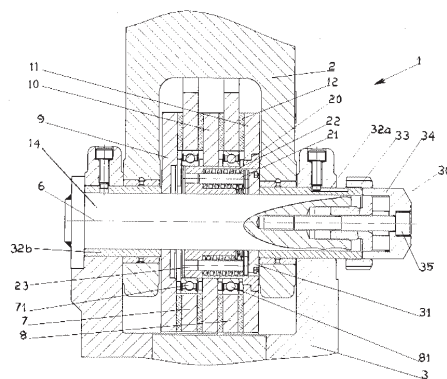


Fig. 3

(51) **C02F1/30** (11) **14576 B**

C02F1/42
A01K63/04
F21V33/00

- (21) P-11-16 (22) 10.02.2011
 (45) 20.11.2012
 (73) Jānis FRIDRIHSONS; Maskavas iela 254 k-2 - 54, Rīga LV-1063, LV;
 Māris FRIDRIHSONS; Zemeņu iela 2, Ogre, Ogres nov. LV-5001, LV
 (72) Jānis FRIDRIHSONS (LV),
 Māris FRIDRIHSONS (LV)

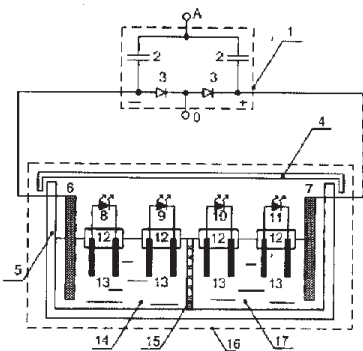
(54) HIDROTEHNOLOĢISKA GAISMAS DIOŽU IEKĀRTA

(57) 1. Hidrotehnoģiska gaismas diožu iekārta, kura satur virknes slēgumā savienotas gaismas diodes, kas ievietotas sadzīves ūdens tīlnes hermētiski noslēgtā prožektorā un pieslēgtas pazeminošā transformatora iztaisnotam spriegumam,

atšķirīga ar to, ka, ar mērķi paaugstināt pielietojuma efektivitāti, samazināt spuldžu nomenklatūras elementu skaitu, iegūt elektroenerģijas ekonomiju un paplašināt izpildāmo funkciju diapazonu, nomenklatūras barošanas avotus nesaturēšanas gaismas diodes individuāli nostiprinātas uz nehidroskopiska materiāla pamatnēm un iegremdētas tehnoloģiskas ūdens apstrādes iekārtā, kura caur sprieguma dubultotāju pieslēgta paaugstinātam iztaisnotam spriegumam.

2. Iekārta saskaņā ar 1. punktu, kas atšķirīga ar to, ka tās strāvu vadošais virsējais ūdens slānis izpilda šķidrās konsistences sprieguma dalītāja funkciju.

3. Iekārta saskaņā ar 1. punktu, kas atšķirīga ar to, ka katras gaismas diodes galiem pielodēti metāliski elektrodi, no kuriem, saskaroties ar ūdens virsmu, tiek saņemtas diožu darbībai nepieciešamais soļa spriegums.



- (51) C02F1/30 (11) 14577 B
 C02F1/42
 A01K63/04
 F21V33/00
 (21) P-11-31 (22) 08.03.2011
 (45) 20.11.2012
 (73) Jānis FRIDRIHSONS; Maskavas iela 254 k-2 - 54, Rīga LV-1063, LV
 (72) Jānis FRIDRIHSONS (LV)
 (54) **APGAISMOŠANAS IEKĀRTA ŪDENS AKTIVIZĒŠANAI HIDROPONIKAS VAJADZĪBĀM**

(57) 1. Apgaismošanas iekārta ūdens aktivizēšanai hidroponikas vajadzībām, kura sastāv no taisnstūra ūdens trauka ar tā galos novietotiem plakaniem ogles elektrodiem, kas pieslēgti sprieguma dubultotājam, un kurā uz nehidroskopiska materiāla pamatnes ir nostiprinātas spektrālās gaismas diodes, kas iegremdētas iekārtas virsējā ūdens slānī, no kura caur pielodētajiem metāliskajiem elektrodiem tās saņem savai darbībai nepieciešamo soļa spriegumu,

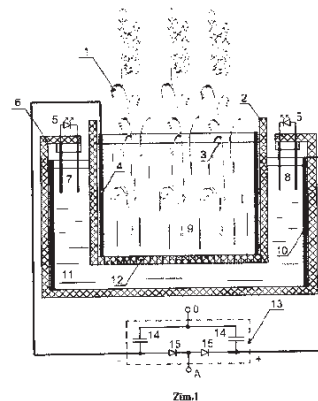
atšķirīga ar to, ka, ar mērķi paplašināt iekārtas funkciju diapazonu un paaugstināt darbības efektivitāti, iekārta ir izveidota no diviem koaksiāli novietotiem cilindriskiem elektroizolācijas materiāla ūdens traukiem, pie kuru iekšējām sienām ir piestiprināti nerūsējoša tērauda gredzenveida elektrodi.

2. Iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas atšķirīga ar to, ka mazākā diametra trauka ūdens masā elektriskā potenciāla lauks ir homogēns un tajā ievietotie augi saņem enerģētiski uzlādētu barošanu no ar katjoniem aktivizēta ūdens.

3. Iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas atšķirīga ar to, ka lielākā diametra trauka ūdens masā starp anodu un katodu ir

izveidots elektriskā potenciāla lauka gradients, kurā ievietotās spektrālās gaismas diodes saņem tām nepieciešamo elektrisko barošanu no ar anjoniem aktivizētā ūdens frakcijā izveidotā soļa sprieguma.

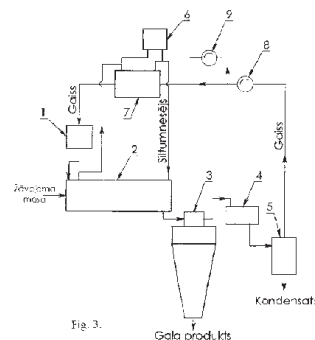
4. Iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas atšķirīga ar to, ka stacionārie ūdens trauki ir mehāniski atdalīti un strukturizētā ūdens frakcijas mobili tiek izmantotas citiem, to iedarbībai atbilstošiem, nolūkiem.



- (51) C02F11/12 (11) 14578 B
 C02F11/18
 F26B21/06
 (21) P-11-136 (22) 10.10.2011
 (45) 20.11.2012
 (73) Igors GUSAREVS; Brīvības iela 60-29, Rīga LV-1011, LV
 (72) Igors GUSAREVS (LV)
 (54) **DZERAMĀ ŪDENS NOSĒDUMU UN NOTEKŪDEŅU DŪŅU ŽĀVĒŠANAS PAŅĒMIENS UN IEKĀRTA, KARSTĀ GAISA PLŪSMU PADODOT IMPULSVEIDĪGI**

(57) 1. Paņēmiens sauso dūņu iegūšanai no dzeramā ūdens nosēdumiem un notekūdeņu dūņām ar mitrumu līdz 75-80 %, kas ietver to turbožāvēšanu un kas raksturīgs ar to, ka, ar mērķi ievērojami samazināt žāvēšanai nepieciešamo enerģijas patēriņu, tehnoloģiskajā shēmā tiek ieslēgts pulsators, kas žāvēšanai nepieciešamo karstā gaisa daudzumu padod ar pārtraukumiem impulsveidā.

2. Iekārta 1. pretenzijā definētā paņēmiena īstenošanai ar pulsatoru dūņu atūdeņošanas tehnoloģiskajā shēmā, kas parādīta fig. 3 un satur: pulsatoru 1; turbokalti 2; ciklonu 3; turbokondensatoru 4; hidrociklonu 5; diatermiskās eļļas tvertni 6; siltummaiņi 7 un ventilatorus 8 un 9.



- (51) C05F11/00 (11) 14579 B
 C05F11/02
 C05F15/00
 (21) P-11-39 (22) 10.03.2011
 (45) 20.11.2012
 (73) Raitis ZIEMELIS; Saules iela 112-41, Ventspils LV-3601, LV
 (72) Raitis ZIEMELIS (LV)

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

(54) **PAŅĒMIENS EKOLOĢISKI TĪRA ŠĶIDRA HUMUSVIELU KONCENTRĀTA IEGŪŠANAI**

(57) 1. Paņēmiens ekoloģiski tīra šķidra humusvielu koncentrāta iegūšanai, kas ietver humusvielu saturošās organiskās vielas apstrādi ar sārmainu reaģentu ūdenī un šķidrā humusvielu koncentrāta atdalīšanu no cietās frakcijas, kas ir raksturīgs ar to, ka sārmainais reaģents ir koka pelni.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka humusvielu saturošās organiskās vielas, labāk tās smalko frakciju, sajauc ar koka pelniem no 10 līdz 40 masas %, un iegūtajai masai pievieno ūdeni proporcijā 1:1 un iztur 0,5 līdz 24 stundas, labāk 1 līdz 3 stundas, pēc izvēles apstrādājot ar kavitācijas metodi un/vai ultraskaņu.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka ūdeni sajauc ar pelniem attiecībās 7:1 līdz 1:1 un pievieno humusvielu saturošās organiskās vielas, labāk tās smalko frakciju, proporcijā 1:1, un iegūto masu apstrādā ar kavitācijas metodi un/vai ultraskaņu.

4. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka ūdenī ar temperatūru 70°C līdz 120°C iejauc humusvielu saturošās organiskās vielas un maisot pievieno koka pelnus masas daļu attiecībās 5:4:1 (ūdens:humusvielu saturošās organiskās vielas:koka pelni).

5. Paņēmiens saskaņā ar 2., 3. vai 4. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka ūdens vietā izmanto šķidru humusvielu koncentrātu.

6. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšminētajām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka humusvielu saturošās organiskās vielas izvēlas no grupas, kas ietver kūdru, sarpopeli, jūras zāles, kaulus, leonardītu.

7. Šķidrā humusvielu koncentrāts, kas ir iegūts saskaņā ar paņēmienu atbilstoši jebkurai no iepriekšminētajām pretenzijām.

(51) **B01F13/00** (11) **14603 B**
(21) P-12-96 (22) 12.06.2012

(45) 20.11.2012

(73) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;
Lielā iela 2, Jelgava LV-3001, LV

(72) Imants NULLE (LV),
Aivars KAĶĪTIS (LV),
Dainis ANCĀNS (LV),
Mārtiņš OZOLLAPINŠ (LV)

(54) **BIRSTOŠU MASU MAISĪTĀJS**

(57) 1. Birstošu masu maisītājs, kas satur divus lentes tipa konveijerus un atšķiras ar to, ka, ar mērķi paplašināt funkcionālās iespējas, konveijeri ar izcilņiem aprīkotām lentēm ir novietoti viens virs otra noteiktā attālumā un to lentes kustas ar saskaņotiem ātrumiem.

2. Smalcinātas biomasas maisītājs saskaņā ar 1. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka abu konveijeru lentu izcilņi savstarpēji pārsežas un tās pārvietojas ar dažādiem ātrumiem.

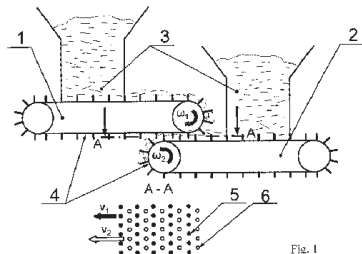


Fig. 1

(51) **B30B1/16** (11) **14604 B**
(21) P-12-95 (22) 12.06.2012

(45) 20.11.2012

(73) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;
Lielā iela 2, Jelgava LV-3001, LV

(72) Ēriks KRONBERGS (LV),
Edgars REPŠA (LV)

(54) **HIDRAULISKS KOMPAKTĒŠANAS MEHĀNISMS**

(57) 1. Hidraulisks kompaktēšanas mehānisms, kurš satur hidrocilindru un stieņmehānismu un atšķiras ar to, ka, ar mērķi paplašināt mehānisma funkcionālās iespējas, starp statni un presēšanas puansonu ar šarnīru starpniecību simetriski ir pievienoti vienāda garuma locekļu pāri, kas ir saistīti ar hidrauliskā cilindra šarnīriem.

2. Hidraulisks kompaktēšanas mehānisms saskaņā ar 1. punktu, kurš atšķiras ar to, ka, hidrocilindra kāts ir kustīgi savienots ar locekļu pāra šarnīra tapu, kurai ar stieņiem ir pievienots hidrocilindra šarnīrs.

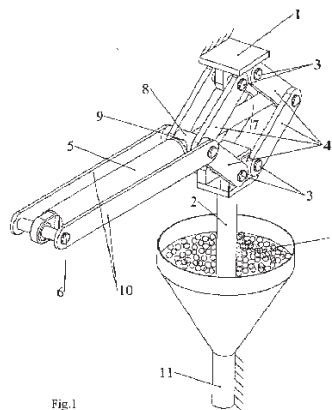


Fig. 1

(51) **B65G33/24** (11) **14605 B**

(21) P-12-112 (22) 02.07.2012

(45) 20.11.2012

(73) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;
Lielā iela 2, Jelgava LV-3001, LV

(72) Juris PRIEKULIS (LV),
Ansis SALIŅŠ (LV),
Armīns LAURS (LV),
Artis VICINSKIS (LV)

(54) **SPĒKBARĪBAS IZDALES LĪNIJA AR SPIRĀLTRANSPORTIERI**

(57) 1. Spēkbarības izdales līnija ar spirāltransportieri, kura sastāv no spēkbarības bunkura, spirāltransportiera un spēkbarības izdales stacijām un atšķiras ar to, ka spirāltransportiera slīpajā posmā ir izvietots elastīgs serdenis un tādēļ šis transportiera posms darbojas analogi gliemežtransportierim.

2. Spēkbarības izdales līnija ar spirāltransportieri, saskaņā ar 1. pretenziju, kura atšķiras ar to, ka elastīgais serdenis atrodas transportiera izliektajā posmā, pie kam serdenļa parametri nodrošina tā pielāgošanos apvalkcaurules un spirāles izliekumam.

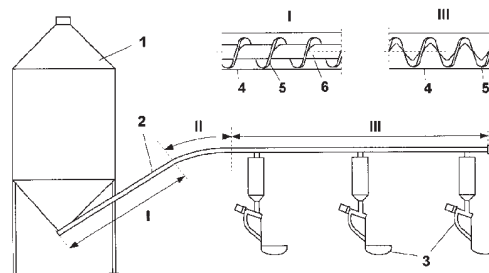


Fig. 1

(51) **F24J2/00** (11) **14611 B**
F24J2/40

(21) P-12-94 (22) 12.06.2012

(45) 20.11.2012

(73) LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE;
Lielā iela 2, Jelgava LV-3001, LV

(72) Henriks PUTĀNS (LV),
Imants ZIEMELIS (LV),

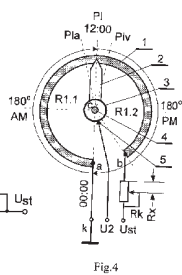
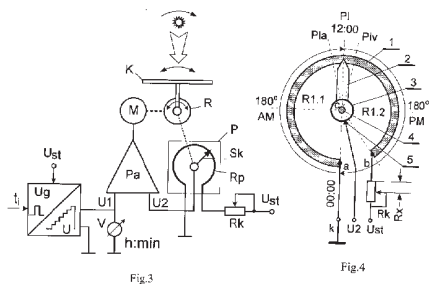
Viktorija ZAGORSKA (LV),
Liene KANCEVIČA (LV)

(54) **SAULES ENERĢIJAS KOLEKTORA VADĪBAS IERĪCE,
KAS NODROŠINA TĀ SEKOŠANU SAULEI**

(57) 1. Saules enerģijas kolektora vadības ierīce, kura nodrošina tā sekošanu saulei, izmantojot griešanas ap polāro asi principu, un kura sastāv no motora-reduktora, potenciometra, diennakts laikā lineāri pieaugoša sprieguma ģenerators, ģenerators un potenciometra spriegumu salīdzināšanas-pastiprināšanas bloka, pie kam motora-reduktora sekundārā vārpsta ir savienota ar saules enerģijas kolektoru un potenciometra piedziņas asi, potenciometra un sprieguma ģenerators izejas spriegumu elektriskās ķēdes ir pieslēgtas sprieguma salīdzināšanas-pastiprināšanas bloka spriegumu ieejas ķēdēm, bet sprieguma salīdzināšanas-pastiprināšanas bloka izejas ķēde ir savienota ar motora-reduktora ieejas sprieguma ķēdi,

atšķirīga ar to, ka, lai uzlabotu ierīces tehniskos rādītājus un paaugstinātu kolektora orientēšanas uz sauli precizitāti, virknē ar potenciometra pretestību ir ieslēgta maiņpretestība, kuras otra spāile ir pieslēgta pie barošanas sprieguma, bet potenciometra otra spāile ir pieslēgta pie elektriskās ķēdes kopējā vada.

2. Ierīce saskaņā ar 1. pretenziju, kas atšķirīga ar to, ka, lai vienkāršotu kolektora orientēšanu uz sauli, mainīgās pretestības ass ir aprīkota ar rādītāju un skalas, kura ir graduēta saskaņā ar laika vienādojumu un uz kuras ir norādīti datumi, kuriem pretī attiecīgajā laika posmā ir jāatrodas mainīgās pretestības ass stāvokļa rādītājam.



Uz Latviju attiecināto Eiropas patentu publikācijas

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

Pieteikumi sakārtoti Eiropas patentu numuru kārtībā.

- (51) **A61K 9/06**^(2006.01) (11) **1178808**
A61K 47/10^(2006.01)
A61K 31/56^(2006.01)
A61K 31/573^(2006.01)
A61K 31/59^(2006.01)
A61K 31/593^(2006.01)
A61K 47/06^(2006.01)
A61K 9/00^(2006.01)
- (21) 00901483.8 (22) 27.01.2000
(43) 13.02.2002
(45) 30.05.2012
(31) 56199 (32) 23.04.1999 (33) DK
(86) PCT/DK2000/000033 27.01.2000
(87) WO 2000/064450 02.11.2000
(73) LEO PHARMA A/S, Industriparken 55, 2750 Ballerup, DK
(72) DIDRIKSEN, Erik, DK
HØY, Gert, DK
- (74) Samuels, Lucy Alice, et al, Gill Jennings & Every LLP, The Broadgate Tower, 20 Primrose Street, London EC2A 2ES, GB
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV
- (54) **NEŪDENS FARMACEITISKA KOMPOZĪCIJA LIETOŠANAI UZ ĀDAS PSORIĀZES ĀRSTĒŠANAI, KAS SATUR D VITAMĪNU, KORTIKOSTEROĪDU UN ŠĶĪDINĀTĀJA SASTĀVDAĻU**
NON-AQUEOUS PHARMACEUTICAL COMPOSITION FOR DERMAL USE TO TREAT PSORIASIS COMPRISING A VITAMIN D, A CORTICOSTEROID AND A SOLVENT COMPONENT
- (57) 1. Neūdens farmaceutiska kompozīcija lietošanai uz ādas cilvēku un citu zīdītāju psoriāzes, sebopsoriāzes un seborejiska dermatīta ārstēšanai, pie kam minētā kompozīcija satur pirmo farmakoloģiski aktīvo sastāvdaļu A, kas sastāv no vismaz viena vitamīna D vai vitamīna D analoga, un otru farmakoloģiski aktīvo sastāvdaļu B, kas sastāv no vismaz viena kortikosteroīda, pie kam starpība starp pirmās sastāvdaļas A optimālās stabilitātes pH un otrās sastāvdaļas B optimālās stabilitātes pH ir vismaz 1, un tālāk satur vismaz vienu šķīdinātāja sastāvdaļu C, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no:
- (i) savienojumiem ar vispārējo formulu $R^3(OCH_2C(R^1)H)_xOR^2$ (I), kur x ir diapazonā no 2 līdz 60, R¹ katrā no x vienībām ir CH₃, R² ir taisna vai sazarota C₁₋₂₀alkilķēde vai benzoilgrupa, un R³ ir H atoms;
- (ii) C₄₋₈dikarbonskābju di-(taisniem vai sazarotiem)C₄₋₁₀alkilesteriem;
- (iii) nesazarotiem vai sazarotiem C₁₂₋₁₈alkilbenzoātiem;
- (iv) nesazarotiem vai sazarotiem C₁₀₋₁₈alkānskābju vai alkānskābju nesazarotiem vai sazarotiem C₂₋₄alkilesteriem;
- (v) propilēnglikola un C₈₋₁₄alkānskābju diesteriem, un
- (vi) sazarotiem pirmējiem C₁₈₋₂₄alkanoliem,
- kur minētā pirmā sastāvdaļa A ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no kalcipotriola, kalcitriola, takalcitola, maksakalcitola un 1(S),3(R)-di-hidroksi-20(R)-[[(3-(2-hidroksi-2-propil)-fenil)-metoksi)-metil]-9,10-seko-pregna-5(Z),7(E),10(19)triēna, kā arī to maisījumiem, un kur minētā otrā sastāvdaļa B ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no betametazona, klobetazola, klobetazona, dezoksimetazona, diflukortolona, diflorazona, fluocinonida, flumetazona, fluocinolona, flutikazona, fluprednida, halcinonida, hidrokortizona, mometazona, triamcinolona un farmaceutiski pieņemamiem esteriem un acetoni-diem, kā arī to maisījumiem.
8. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas ir vienfāzes sastāva formā.

9. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar iepriekšējo pretenziju, kas ir ziede.

10. Farmaceutiska kompozīcija izmantošanai saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur ārstēšanas procesā kompozīciju uzliek lokāli vienu vai divas reizes dienā medicīniski pietiekamā daudzumā.

- (51) **A61H 1/00**^(2006.01) (11) **1246595**
A61H 1/02^(2006.01)
- (21) 00981589.5 (22) 14.12.2000
(43) 09.10.2002
(45) 27.06.2012
(31) 479661 (32) 10.01.2000 (33) US
(86) PCT/IL2000/000836 14.12.2000
(87) WO 2001/051000 19.07.2001
(73) Backlife Ltd., 13/86 Sasha Argov Street, 69086 Tel Aviv, IL
(72) ELAN, Ori, IL
(74) Machtalère, Georges, et al, Dennemeyer & Associates S.A., 55, rue des Bruyères, 1274 Howald, LU
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
- (54) **IEKĀRTA MUGURĀS LEJASDAĻAS SĀPJU NOVĒRŠANAI VAI MAZINĀŠANAI**
DEVICE FOR PREVENTING OR RELIEVING PAIN IN THE LOWER BACK
- (57) 1. Iekārta (10) sāpju novēršanai vai mazināšanai cilvēka muguras lejasdaļā, kura ir konfigurēta lietošanai, kad cilvēks atrodas guļus stāvoklī uz pamata virsmas (Fig. 1a-1c), pie kam iekārta satur:
- (i) elementu saskarei ar cilvēka ķermeni (12), kas ir konfigurēts abu kāju saistīšanai zemāk par cilvēka jostas vietu, kuram ir vismaz viena virsma (16), kas ir konfigurēta cilvēka kāju mugurpusē atbalstīšanai zem ceļiem, un
- (ii) piedziņas mehānismu, kas ir mehāniski saistīts pie minētā elementa saskarei ar cilvēka ķermeni, pie kam minētais piedziņas mehānisms (14) ir konfigurēts tā, lai minēto elementu ķermeņa sasaistīšanai (12) pārvietotu tā, ka visi minētās virsmas (16) punkti iziet cauri atkārtotai cikliskai kustībai, kura satur:
- (a) operatīvu kustību pa vienu trajektoriju, kas satur galvenokārt vertikālu pacelšanas kustību (Fig. 1a), kurai seko galvenokārt horizontāla izstiepšanas kustība (Fig. 1b un 1c), lai izstieptu cilvēka muguras lejasdaļu, un
- (b) atpakaļgaitas kustību pa otru trajektoriju, kas satur galvenokārt vertikālu nolaišanas kustību, kurai seko galvenokārt horizontāla atpakaļgaitas kustība.

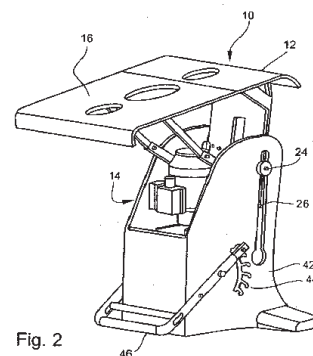


Fig. 2

- (51) **A61K 31/403**^(2006.01) (11) **1437131**
A61P 3/10^(2006.01)
- (21) 04006330.7 (22) 25.08.2000
(43) 14.07.2004
(45) 25.04.2012
(31) 9903028 (32) 27.08.1999 (33) SE
(62) 00965898.0 / 1 212 081
(73) Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, Brüningstraße 50, 65929 Frankfurt am Main, DE

- (72) SCHOELKENS, Bernward, Prof. Dr., DE
BENDER, Norbert, Dr., DE
RANGOONWALA, Badrudin, Dr., DE
DAGENAIS, Gilles, CA
GERSTEIN, Hertzal, CA
LJUNGGREN, Anders, SE
YUSUF, Salim, CA
- (74) Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
- (54) **RAMIPRILA IZMANTOŠANA DIABĒTA PROFILAKSEI PACIENTAM, KAM NAV BIJUSI KONGESTĪVA SIRDŠ MAZSPĒJA**
USE OF RAMIPRIL FOR THE PREVENTION OF DIABETES IN A PATIENT WITH NO PREEXISTING CONGESTIVE HEART FAILURE
- (57) 1. Ramiprila vai tā farmaceitiski pieņemama sāls izmantošana medikamenta ražošanā diabēta sākuma profilaksei vai samazināšanai pacientam, kam iepriekš nav bijusi kongestīva sirds mazspēja (CHF), un kur pacientam ir augsts kardiovaskulāras slimības risks dēļ agrāk bijušas išēmiskas sirds slimības, triekas vai perifēras arteriālas slimības.
2. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, kur pacientam ir normāls vai zems asinsspiediens.

- (51) **C12N 15/11**^(2006.01) (11) **1456380**
(21) 02790321.0 (22) 31.10.2002
(43) 15.09.2004
(45) 18.04.2012
(31) 01126140 (32) 02.11.2001 (33) EP
(86) PCT/EP2002/012221 31.10.2002
(87) WO 2003/037368 08.05.2003
(73) Giuliani International Limited, 33 Sir John Rogerson's Quay, Dublin 2, IE
- (72) STEINBRECHER, Andreas, DE
GIEGERICH, Gerhard, DE
KLEITER, Ingo, DE
HORN, Markus, DE
APFEL, Rainer, DE
KREUTZER, Roland, DE
LIMMER, Stefan, DE
VORNLOCHER, Hans-Peter, DE
- (74) Hollywood, Jane Constance, et al, Kilburn & Strode LLP, 20 Red Lion Street, London WC1R 4PJ, GB
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
- (54) **SMAD7 INHIBITORI CNS SLIMĪBU ĀRSTĒŠANAI**
SMAD7 INHIBITORS FOR THE TREATMENT OF CNS DISEASES

(57) 1. Smad7 specifiska inhibitora ekspresijas vai darbības izmantošana multiplās sklerozes vai smadzeņu išēmijas profilaksei, stāvokļa uzlabošanai vai ārstēšanai, kur minētais specifiskais inhibitors ir izvēlēts no virknes, kas sastāv no intracelulārajām antivielām vai antivielu fragmentiem, aptamēriem, intramēriem, RNSi un anti-Smad7 antiinformācijas molekulām.

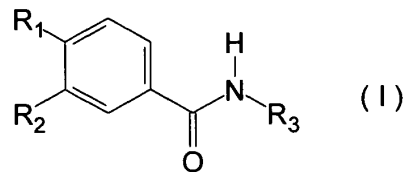
2. Smad7 specifiska inhibitora ekspresijas vai darbības izmantošana farmaceitiskas kompozīcijas ražošanai multiplās sklerozes vai smadzeņu išēmijas profilaksei, stāvokļa uzlabošanai vai ārstēšanai, kur minētais specifiskais inhibitors ir izvēlēts no virknes, kas sastāv no intracelulārajām antivielām vai antivielu fragmentiem, aptamēriem, intramēriem, RNSi un anti-Smad7 antiinformācijas molekulām.

3. Inhibitors izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju vai izmantošana saskaņā ar 2. pretenziju, kur minētā anti-Smad7 antiinformācijas molekula satur nukleīnskābes molekulu, kas ir komplementāri saistīta ar pretējo komplementāri saistīto Smad7 kodējošo reģionu.

- (51) **A61K 45/06**^(2006.01) (11) **1478399**
A61K 9/20^(2006.01)
A61K 31/166^(2006.01)
A61K 31/44^(2006.01)
A61P 11/06^(2006.01)

- (21) 03704652.1 (22) 19.02.2003
(43) 24.11.2004
(45) 21.03.2012
(31) 02003811 (32) 20.02.2002 (33) EP
10207160 20.02.2002 DE
(86) PCT/EP2003/001650 19.02.2003
(87) WO 2003/070279 28.08.2003
(73) Nycomed GmbH, Byk-Gulden-Strasse 2, 78467 Konstanz, DE
- (72) DIETRICH, Rango, DE
EISTETTER, Klaus, DE
NEY, Hartmut, DE
- (74) HOFFMANN EITL, Patent- und Rechtsanwälte, Arabellastraße 4, 81925 München, DE
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV
- (54) **PERORĀLA ZĀĻU FORMA, KAS SATUR PDE 4 INHIBITORU KĀ AKTĪVO VIELU UN POLIVINILPIROLIDONU KĀ PALĪGVIELU**
ORAL DOSAGE FORM CONTAINING A PDE 4 INHIBITOR AS AN ACTIVE INGREDIENT AND POLYVINYLPIRROLIDON AS EXCIPIENT

(57) 1. Zāļu forma tabletes vai peletes formā PDE 4 inhibitora perorālai ievadīšanai, kas satur PDE 4 inhibitoru kopā ar polivinilpirolidonu un vienu vai vairākas citas piemērotas farmaceitiskas palīgvielas, pie kam PDE 4 inhibitors ir savienojums, kas izvēlēts no savienojumu grupas ar formulu (I)



kurā

R1 ir difluormetoksigrupa,

R2 ir ciklopropilmetoksigrupa un

R3 ir 3,5-dihlorpirid-4-ilgrupa,

šī savienojuma sāļi un piridīna N-oksīds un tā sāļi, un pie kam zāļu forma nesatur PDE 4 inhibitoru, kas būtu būtībā vienmērīgi disperģēts vai izšķīdināts palīgvielu matricē, kas sastāv no vienas vai vairākām palīgvielām, kas izvēlētas no taukspirta, triglicerīda, daļēja glicerīda un taukskābes estera grupas.

2. Zāļu forma saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam PDE 4 inhibitors ir N-(3,5-dihlorpirid-4-il)-3-ciklopropilmetoksi-4-difluormetoksibenzamīds (roflumilasts).

8. Zāļu forma saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam polivinilpirolidons ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no kolidona 25 ar molekulāro masu 28000 - 34000, kolidona 30 ar molekulāro masu 44000 - 54000 un kolidona 90 F ar molekulāro masu 100000 - 1500000.

9. Zāļu forma saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam farmaceitiskās palīgvielas ir palīgvielas no pildvielām, saistvielām, tablešu iridnātājiem, slīdvielām vai pretsalīpes līdzekļiem, garšu uzlabojošu vielu, bufervielu, konservantu, krāsvielu un emulgatoru grupas.

15. Zāļu forma saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir tablete.

20. Zāļu forma saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur PDE 4 inhibitora cietu šķīdumu PVP kā nesējā.

22. Paņēmiens zāļu formas saskaņā ar 1. pretenziju ražošanai, kas ietver šādus soļus: (a) PDE 4 inhibitora ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju un farmaceitisko palīgvielu maisījuma pagatavošanu un (b) a) solī iegūtā maisījuma granulēšanu ar polivinilpirolidona ūdens šķīdumu.

29. Paņēmiens saskaņā ar 22. pretenziju, kas ietver (a) PDE 4 inhibitora ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju vai pulverī saberztā PDE 4 inhibitora ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju kopā ar kukurūzas cieti, (b) kukurūzas cietes un (c) laktozes monohidrāta maisījuma granulēšanu ar polivinilpirolidona ūdens šķīdumu, granulu žāvēšanu, granulu samaisīšanu ar pretsalīpes līdzekli un presēšanu tablešu presē.

37. Paņēmiens zāļu formas saskaņā ar 1. pretenziju ražošanai, kas ietver šādus soļus: (a) aktīvās vielas preparāta pagatavošanu PDE 4 inhibitora ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju cietā šķīduma formā polivinilpirolidonā, (b) aktīvās vielas preparāta un farmaceitisko

palīgvielu maisījuma pagatavošanu un (c) (b) solī iegūtā maisījuma granulēšanu ar polivinilpirolidona ūdens šķīdumu.

42. Savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju izmantošana zāļu formas saskaņā ar 1. pretenziju ražošanā slimības, kas tiek uzskatīta par ārstējamu vai novēršamu ar PDE 4 inhibitoriem, ārstēšanai vai profilaksei.

43. Izmantošana saskaņā ar 42. pretenziju, pie kam slimība ir izvēlēta no astmas un elpceļu obstrukciju grupas.

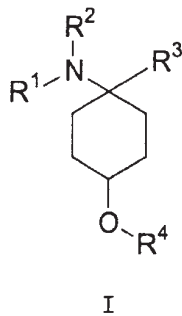
44. Izmantošana saskaņā ar 43. pretenziju, pie kam slimība ir HOPS (hroniska obstruktīva plaušu slimība).

45. Izmantošana saskaņā ar 42. pretenziju, pie kam slimība ir izvēlēta no akūtu un hronisku elpceļu traucējumu grupas.

46. Izmantošana saskaņā ar 45. pretenziju, pie kam slimība ir izvēlēta no bronhīta un alerģiskā bronhīta.

47. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 43. līdz 46. pretenzijai, pie kam PDE 4 inhibitori ir N-(3,5-dihlorpirid-4-il)-3-ciklopropilmetoksi-4-difluorometoksibenzamīds (roflumilasts).

- (51) **C07C 211/35**^(2006.01) (11) **1487778**
C07C 211/37^(2006.01)
C07D 209/04^(2006.01)
C07D 333/46^(2006.01)
A61P 25/24^(2006.01)
A61P 25/28^(2006.01)
- (21) 03708253.4 (22) 18.03.2003
(43) 22.12.2004
(45) 11.07.2012
(31) 10213051 (32) 23.03.2002 (33) DE
(86) PCT/EP2003/002812 18.03.2003
(87) WO 2003/080557 02.10.2003
(73) Grünenthal GmbH, Zieglerstrasse 6, 52078 Aachen, DE
(72) SUNDERMANN, Bernd, DE
HENNIES, Hagen-Heinrich, DE
ENGLBERGER, Werner, DE
KÖGEL, Babette-Yvonne, DE
(74) Bülle, Jan, Kutzenberger & Wolff Patentanwaltssozietät, Theodor-Heuss-Ring 23, 50668 Köln, DE
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
(54) **AIZVIETOTI 4-AMINOCIKLOHEKSANOLI**
SUBSTITUTED 4-AMINOCYCLOHEXANOLS
(57) 1. Aizvietoti 4-aminocikloheksanoli ar vispārīgo formulu (I)



kurā

R¹ ir izvēlēts no šādas virknes: H; C₁₋₄alkilgrupa, kas ir piesātināta vai nepiesātināta, ar sazarotu vai taisnu ķēdi, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, kur R¹ un R² abi nevar būt H;

R² ir izvēlēts no šādas virknes: H; C₁₋₄alkilgrupa, kas ir piesātināta vai nepiesātināta, ar sazarotu vai taisnu ķēdi, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota,

R³ ir izvēlēts no šādas virknes: C₁₋₈alkilgrupa, kas ir piesātināta vai nepiesātināta, ar sazarotu vai taisnu ķēdi, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, C₃₋₈cikloalkilgrupa, kas ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, arilgrupa, kas ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, heterociklilgrupa, kas ir piesātināta vai nepiesātināta, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, arilgrupa vai C₃₋₈cikloalkilgrupa, kas ir saistīta ar C₁₋₃alkilgrupas tiltiņu, katrā gadījumā ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota vai heterociklilgrupa, kas ir saistīta ar C₁₋₃alkilgrupas tiltiņu, ir piesātināta vai nepiesātināta, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota;

R⁴ ir izvēlēts no šādas virknes: C₃₋₈cikloalkilgrupa, kas ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, arilgrupa, kas ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, heterociklilgrupa, kas ir piesātināta vai nepiesātināta, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, -CHR⁶R⁷, -CHR⁶-CH₂R⁷, -CHR⁶-CH₂-CH₂R⁷, -CHR⁶-CH₂-CH₂-CH₂R⁷, vai R⁸-L-R⁹, kurā

R⁶ ir izvēlēts no šādas virknes: H; C₁₋₈alkilgrupa, kas ir piesātināta vai nepiesātināta, ar sazarotu vai taisnu ķēdi, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, C₃₋₈cikloalkilgrupa, kas ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, arilgrupa, kas ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, heterociklilgrupa, kas ir piesātināta vai nepiesātināta, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, vai -C(O)O-R¹⁰, kurā

R¹⁰ ir izvēlēts no šādas virknes: C₁₋₇alkilgrupa, kas ir piesātināta vai nepiesātināta, ar sazarotu vai taisnu ķēdi, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, C₃₋₈cikloalkilgrupa, kas ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, arilgrupa, kas ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, heterociklilgrupa, kas ir piesātināta vai nepiesātināta, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, kurā

R⁷ ir izvēlēts no šādas virknes:

H; C₃₋₈cikloalkilgrupa, kas ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, arilgrupa, kas ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, heterociklilgrupa, kas ir piesātināta vai nepiesātināta, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, kurā R⁹ ir izvēlēts no šādas virknes:

C₃₋₈cikloalkilgrupa, kas ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, arilgrupa, kas ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, heterociklilgrupa, kas ir piesātināta vai nepiesātināta, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, kurā L ir izvēlēts no šādas virknes:

-C(O)-NH-, -NH-C(O)-, -C(O)-O-, -O-C(O)-, -O-, -S- vai -S(O)₂-, kurā

R⁹ ir izvēlēts no šādas virknes:

H; C₁₋₈alkilgrupa, kas ir piesātināta vai nepiesātināta, ar sazarotu vai taisnu ķēdi, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, C₃₋₈cikloalkilgrupa, kas ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, arilgrupa, kas ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, heterociklilgrupa, kas ir piesātināta vai nepiesātināta, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota;

kurā apzīmējums "aizvietota" saistībā ar alkilgrupu un cikloalkilgrupu nozīmē ūdeņraža atoma aizvietošanu ar F, Cl, Br, I, NH₂, SH vai OH, kur "poliaizvietotas" grupas ir jāsaprot tā, ka aizvietošana notiek vairākas reizes ar tiem pašiem vai atšķirīgiem aizvietotājiem, gan ar atšķirīgiem, gan tiem pašiem atomiem;

kurā "aizvietota" saistībā ar arilgrupu un heteroarilgrupu nozīmē arilgrupas vai heteroarilgrupas aizvietošanu ar R²³, OR²³, halogēna atomu, CF₃, CN, NO₂, NR²⁴R²⁵, C₁₋₆alkilgrupu (piesātinātu), C₁₋₆alkoksigrupu, C₃₋₈cikloalkoksigrupu, C₃₋₈cikloalkilgrupu vai C₂₋₆alkilēngrupu, kurā

grupa R²³ ir H, C₁₋₁₀alkilgrupa, arilgrupa vai heteroarilgrupa, vai arilgrupa vai heteroarilgrupa, kas saistīta ar C₁₋₃alkilēngrupu, kur šīs arilgrupas un heteroarilgrupas pašas nevar būt aizvietotas ar arilgrupu vai heteroarilgrupu,

grupas R²⁴ un R²⁵, kas ir vienādas vai atšķirīgas, ir H, C₁₋₁₀alkilgrupa, arilgrupa, heteroarilgrupa vai arilgrupa, vai heteroarilgrupa, kas saistīta ar C₁₋₃alkilēngrupu, kur šīs arilgrupas un heteroarilgrupas pašas nevar būt aizvietotas ar arilgrupu vai heteroarilgrupu,

vai grupas R²⁴ un R²⁵ kopā ir CH₂CH₂OCH₂CH₂, CH₂CH₂NR²⁶CH₂CH₂ vai (CH₂)₃₋₆, un

grupa R²⁶ ir H, C₁₋₁₀alkilgrupa, arilgrupa vai heteroarilgrupa, vai arilgrupa vai heteroarilgrupa, kas saistīta ar C₁₋₃alkilēngrupu, kur šīs arilgrupas un heteroarilgrupas pašas nevar būt aizvietotas ar arilgrupu vai heteroarilgrupu;

to racemātu, tīru enantiomēru vai diastereoizomēru formā, enantiomēru vai diastereoizomēru maisījumu formā jebkurā maisījumu attiecībā, pagatavotajā formā vai to fizioloģiski pieņemamu sāļu formā, vai to solvātu formā.

10. Medikaments, kas satur vismaz vienu aizvietotu 4-aminocikloheksanolu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai to racemātu, tīru enantiomēru vai diastereoizomēru formā, enantiomēru vai diastereoizomēru maisījumu formā jebkurā maisījumu attiecībā, pagatavotajā formā vai to fizioloģiski pieņemamu sāļu formā, vai to solvātu formā.

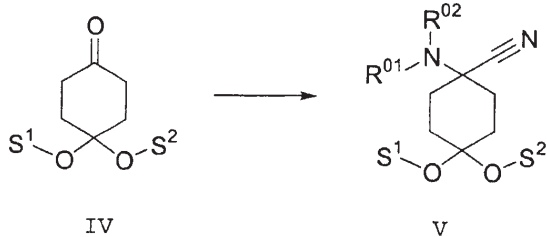
12. Aizvietota 4-aminocikloheksanola saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai tā racemātu, tīru enantiomēru vai diastereoizomēru

formā, enantiomēru vai diastereoizomēru maisījumu formā jebkurā maisījumu attiecībā, pagatavotajā formā vai tā fizioloģiski pieņemamu sāļu formā, vai tā solvātu formā izmantošana medikamenta iegūšanai sāļu ārstēšanai.

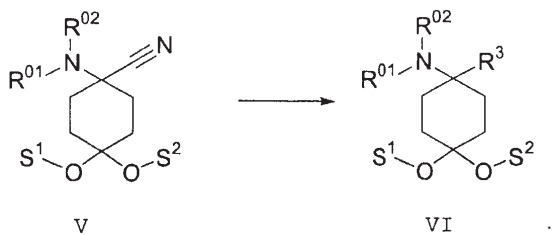
13. Aizvietota 4-aminocikloheksanola saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai tā racemātu, tā tīru enantiomēru vai diastereoizomēru formā, enantiomēru vai diastereoizomēru maisījumu formā jebkurā maisījumu attiecībā, pagatavotajā formā vai tā fizioloģiski pieņemamu sāļu formā, vai tā solvātu formā izmantošana medikamenta iegūšanā, kas paredzēts trauksmes, stresa sindromu, kas saistīti ar stresu, depresijas, epilepsijas, Alcheimera slimības, vecuma plānprātības, vispārēju kognitīvu traucējumu, mācīšanās un atmiņas traucējumu (kā nootropa līdzekļa), autismu, simptomu, alkohola un/vai narkotiku, un/vai medikamentu pārmērīgas lietošanas un/vai atkarības, seksuālu traucējumu, sirds un asinsvadu slimību, hipotensijas, hipertensijas, trokšņa ausīs, niezes, migrēnas, dzirdes traucējumu, nepietiekamas zarnu trakta motorikas, barības uzņemšanas traucējumu, anoreksijas, aptaukošanās, kustību traucējumu, caurejas, kaheksijas, urīna nesaturēšanas ārstēšanai vai kā muskuļu relaksantu, pretkrampju vai anestezējošu līdzekli, vai, ievadot kopā ar opioīdiem, analgētiķiem vai anestezējošiem līdzekļiem diurēzes vai nātrija sāļu pārmērīgas izvadīšanas novēršanai un/vai patoloģisku baiļu ārstēšanai.

14. Paņēmiens aizvietota 4-aminocikloheksanola saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas satur šādus soļus:

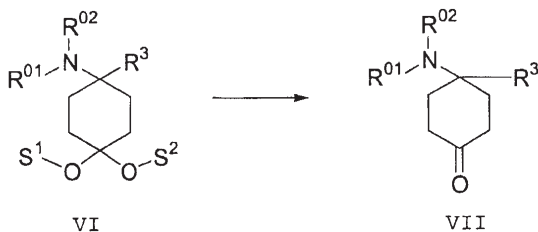
a. cikloheksān-1,4-dions, kas ir aizsargāts ar S^1 un S^2 grupām saskaņā ar formulu (IV), reaģē savienojuma ar formulu $HNR^{01}R^{02}$ klātbūtnē ar cianīdu, lai iegūtu aizsargātu N-aizvietotu 1-amino-4-oksocikloheksānkarbonitrila atvasinājumu saskaņā ar formulu (V)



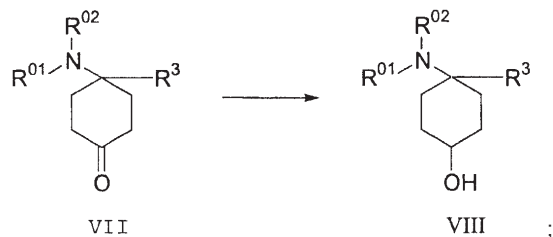
b. aminonitrils saskaņā ar formulu (V) reaģē ar metālorganiskiem reaģentiem, labāk ar Grinjāra vai litijorganiskiem reaģentiem ar formulu metāls- R^3 , lai iegūtu savienojumu saskaņā ar formulu (VI)



c. savienojumā saskaņā ar formulu (VI) tiek atšķeltas S^1 un S^2 aizsarggrupas, lai iegūtu 4-aizvietotu 4-aminocikloheksanona atvasinājumu saskaņā ar formulu (VII)



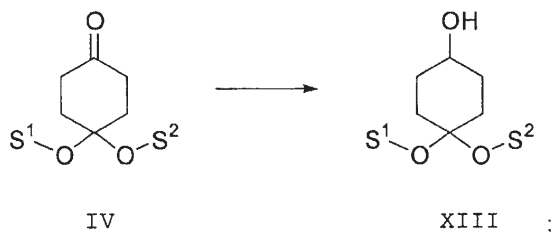
d. 4-aizvietotais 4-aminocikloheksanona atvasinājums saskaņā ar formulu (VII) reaģē ar reducētāju, tādu kā, piemēram, nātrija borhidrīds, nātrija ciānborhidrīds, nātrija triacetoksiborhidrīds, litijalumīnija hidrīds, diizobutilalumīnija hidrīds, ar šo savienojumu komplekso analoģu temperatūrās no -70°C līdz $+110^\circ\text{C}$, vai ar ūdeņradi cēlmetālu katalizatora klātbūtnē, lai iegūtu 4-aminocikloheksanola atvasinājumu saskaņā ar formulu (VIII)



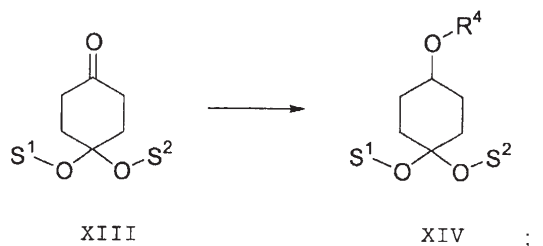
e. pēc tam 4-aizvietotais 4-aminocikloheksanola atvasinājums saskaņā ar formulu (VIII) neorganiskas, metālorganiskas vai organiskas bāzes klātbūtnē reaģē ar alkil-, acil- vai aril-bromīdu, -hlorīdu, -jodīdu vai -triflātu, vai ar alkānu, alkilkarbonskābi vai R^4X aromātisku savienojumu, kas aizsargāts ar atšķirīgu aizejošo X grupu, lai iegūtu savienojumu saskaņā ar formulu (I), kurā R^1 , R^2 , R^3 un R^4 ir, kā noteikts 1. pretenzijā, un R^{01} un R^{02} neatkarīgi viens no otra ir izvēlēti no šādas virknes: H, ar aizsarggrupu aizsargāts H, C_{1-8} alkilgrupa vai C_{3-8} cikloalkilgrupa, kas katrā gadījumā ir piesātināta vai nepiesātināta, ar sazarotu vai taisnu ķēdi, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, arilgrupa vai heteroarilgrupa, kas ir katrā gadījumā mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, vai arilgrupa, C_{3-8} cikloalkilgrupa vai heteroarilgrupa, kas piesaistīta caur C_{1-3} alkilēngrupu, kas katrā gadījumā ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota.

15. Alternatīvs paņēmiens aizvietota 4-aminocikloheksanola saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas satur šādus soļus:

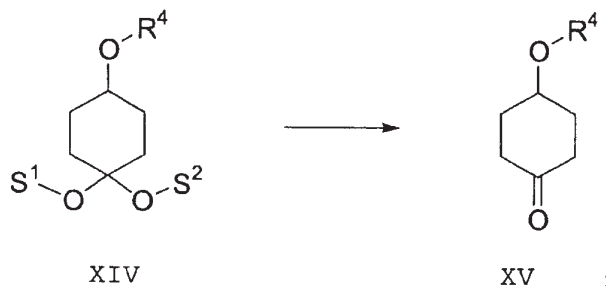
a. cikloheksān-1,4-dions, kas aizsargāts ar S^1 un S^2 grupām, saskaņā ar formulu (IV) reaģē ar reducētāju, tādu kā, piemēram, nātrija borhidrīds, nātrija ciānborhidrīds, nātrija triacetoksiborhidrīds, litijalumīnija hidrīds, diizobutilalumīnija hidrīds, ar šo savienojumu komplekso analoģu temperatūrās no -70°C līdz $+110^\circ\text{C}$, vai ar ūdeņradi cēlmetālu katalizatora klātbūtnē, lai iegūtu 4-hidroksicikloheksāna atvasinājumu saskaņā ar formulu (XIII)



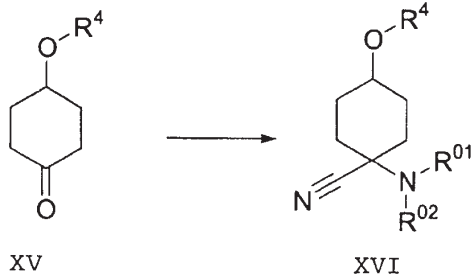
b. kurš tad neorganiskas, metālorganiskas vai organiskas bāzes klātbūtnē reaģē ar alkil- vai aril-bromīdu, -hlorīdu, -jodīdu vai -triflātu, vai ar alkānu, vai ar R^4X aromātisku savienojumu, kas ir aizsargāts ar atšķirīgu aizejošo X grupu, lai iegūtu savienojumu saskaņā ar formulu (XIV)



c. savienojumā saskaņā ar formulu (XIV) tiek atšķeltas S^1 un S^2 aizsarggrupas, lai iegūtu savienojumu saskaņā ar formulu (XV)



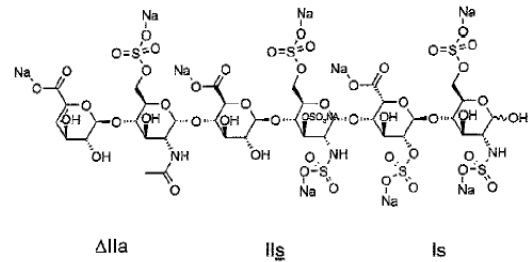
d. savienojums ar formulu (XV) reaģē savienojuma ar formulu $\text{HNR}^{01}\text{R}^{02}$ klātbūtnē ar cianīdu, lai iegūtu α -aminonitrilatvasinājumu ar formulu (XVI)



e. α -aminonitrilatvasinājums ar formulu (XVI) reaģē ar metālorganiskiem reaģentiem ar formulu metāls- R^3 , lai iegūtu savienojumu saskaņā ar formulu (I),

kurā R^1 , R^2 , R^3 un R^4 ir, kā noteikts 1. pretenzijā, un R^{01} un R^{02} neatkarīgi viens no otra ir izvēlēti no šādas virknes: H, ar aizsarggrupu aizsargāts H, C_{1-3} alkilgrupa vai C_{3-8} cikloalkilgrupa, kas katrā gadījumā ir piesātināta vai nepiesātināta, ar sazarotu vai taisnu ķēdi, mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, arilgrupa vai heteroarilgrupa, kas katrā gadījumā ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota, vai caur C_{1-3} alkilēngrupu saistīta arilgrupa, C_{3-8} cikloalkilgrupa vai heteroarilgrupa, kas katrā gadījumā ir mono- vai poliaizvietota, vai neaizvietota.

- (51) **C08B 37/10**^(2006.01) (11) **1556414**
A61K 31/727^(2006.01)
- (21) 03807882.0 (22) 08.10.2003
(43) 27.07.2005
(45) 07.03.2012
- (31) 0212584 (32) 10.10.2002 (33) FR
(86) PCT/FR2003/002960 08.10.2003
(87) WO 2004/033503 22.04.2004
- (73) Aventis Pharma S.A., 20, avenue Raymond Aron, 92160 Antony, FR
(72) BIBEROVIC, Vesna, FR
GRONDARD, Luc, FR
MOURIER, Pierre, FR
VISKOV, Christian, FR
(74) Romanowski, Caroline, et al, Sanofi-Aventis Département Brevets, 174, avenue de France, 75013 Paris, FR
Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
- (54) **HEPARĪNA ATVASINĀTI OLIGOSAHARĪDU MAISĪJUMI, TO IEGŪŠANA UN TOS SATUROŠAS FARMACEITISKAS KOMPOZĪCIJAS**
HEPARIN-DERIVED OLIGOSACCHARIDE MIXTURES, PREPARATION THEREOF AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING THE SAME
- (57) 1. Oligosaharīdu sulfātu maisījumi, kuriem ir heparīnu veidojošo polisaharīdu vispārīgā struktūra un kuriem ir šādas raksturīgas pazīmes:
- tiem ir vidējā molekulmasa no 2000 līdz 3000 daltoniem,
 - tiem ir anti-Xa aktivitāte > 150 IU/mg un < 200 IU/mg,
 - tiem ir anti-IIa aktivitāte mazāka par 10 IU/mg,
 - tiem anti-Xa aktivitātes/anti-IIa aktivitātes savstarpējā attiecība ir lielāka par 30,
 - maisījumus veidojošie oligosaharīdi:
 - satur 2 līdz 26 saharīda daļas,
 - tiem ir 4,5-nepiesātinātas uronskābes 2-O-sulfāta daļa vienā no galiem,
 - satur heksasaharīda frakciju, kas sastāda no 15 līdz 25 % no oligosaharīdu maisījumiem,
 - satur no 8 līdz 15 % heksasaharīda Δ IIa-IIs-Is heksasaharīda frakcijā



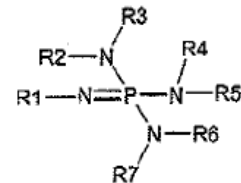
un tie ir sārmu vai sārmzemju metāla sāls veidā.

7. Paņēmiens oligosaharīdu maisījumu, kā definēts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, iegūšanai, kura laikā heparīna benzilestera četrizvietotais amonija sāls tiek depolimerizēts organiskā vidē stipras organiskas bāzes ar pKa lielāku par 20 klātbūtnē, kas raksturīgs ar to, ka izmantotā organiskā bāze sastāv no fosfazēnu grupas, kas satur ūdens procentuālo attiecību mazāku par 0,3 %.

8. Paņēmiens saskaņā ar 7. pretenziju oligosaharīdu maisījumu saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas raksturīgs ar to, ka ūdens saturs ir mazāks par 0,2 %.

9. Iegūšanas paņēmiens saskaņā ar 7. un 8. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka heparīna benzilestera četrizvietotais amonija sāls ir benzetonija, cetilpiridīnija vai cetiltrimetilamonija sāls.

10. Iegūšanas paņēmiens saskaņā ar 7. un 8. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka fosfazēnu grupas bāzes ir bāzes ar formulu:



kurā aizvietotāji R1 līdz R7 ir vienādi vai atšķirīgi un attēlo lineāras vai sazarotas alkilgrupas, kas satur no 1 līdz 6 oglekļa atomiem.

24. Medikaments, kas satur oligosaharīdu maisījumus saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai.

25. Medikaments saskaņā ar 24. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tas uzrāda antitrombotisku aktivitāti.

26. Medikamenti saskaņā ar 24. un 25. pretenziju venozo un arteriālo trombožu, dziļo vēnu trombozes, plaušu embolijas, nepastāvīgas stenokardijas, miokarda infarkta, sirds išēmijas, perifēro artēriju okluzīvo slimību un sirds priekškambara fibrilācijas, gludo muskuļu šūnu proliferācijas, aterosklerozes un arteriosklerozes, vēža, ko modulē angiogēnēze un augšanas faktori, un diabēta traucējumu profilaksei vai ārstēšanai.

27. Farmaceutiskas kompozīcijas, kas satur vismaz vienu medikamentu, kā definēts 24. pretenzijā, un vienu vai vairākas farmaceutiski inertas palīgvielas vai saistvielas, vai piedevas.

28. Farmaceutiskas kompozīcijas saskaņā ar 27. pretenziju, kas raksturīgas ar to, ka tās sastāv no injekcijas šķīdumiem, kas paredzētas subkutānai vai intravenozai ievadīšanai.

29. Farmaceutiskas kompozīcijas saskaņā ar 27. pretenziju, kas raksturīgas ar to, ka tās sastāv no tāda sastāva inhalācijām, kas paredzētas ievadīšanai caur plaušām.

30. Farmaceutiskas kompozīcijas saskaņā ar 27. pretenziju, kas raksturīgas ar to, ka tās sastāv no tāda sastāva, kas paredzēts ievadīšanai perorāli.

31. Oligosaharīdu sulfātu maisījumi saskaņā ar 1. pretenziju, kurus var iegūt ar paņēmienu, kā definēts 13. pretenzijā.

- (51) **C07C 229/00**^(2006.01) (11) **1569892**
A61K 31/21^(2006.01)
A61K 31/185^(2006.01)
A61P 19/08^(2006.01)
A61P 19/00^(2006.01)
C07C 217/32^(2006.01)
- (21) 03783752.3 (22) 25.11.2003
(43) 07.09.2005
(45) 13.06.2012

- (31) 429105 P (32) 26.11.2002 (33) US
 (86) PCT/US2003/037461 25.11.2003
 (87) WO 2004/047751 10.06.2004
 (73) GlaxoSmithKline LLC, One Franklin Plaza, 200 North 16th Street, Philadelphia, PA 19102, US
 (72) MARQUIS, Robert, W., US
 CASILLAS, Linda, N., US
 RAMANJULU, Joshi, M., US
 CALLAHAN, James, Francis, US
 (74) Connell, Anthony Christopher, et al, GlaxoSmithKline Corporate Intellectual Property (CN9.25.19) 980 Great West Road, Brentford, Middlesex TW8 9GS, GB
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV

(54) **KALCINĒTI SAVIENOJUMI**
CALCILYTTIC COMPOUNDS

(57) 1. 3-{3,4-difluor-5-[(R)-2-hidroksi-3-(2-indan-2-il-1,1-dimetilamino)-propoksij-fenil]propionskābe vai tās farmaceitiski pieņemams sāls.

4. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai un farmaceitiski pieņemamu šķīdinātāju vai palīgvielu.

5. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai izmantošanai par medikamentu.

6. Savienojums saskaņā ar 5. pretenziju izmantošanai slimības vai traucējumu, kas saistīti ar kaulu vai minerālvielu patoloģisku homeostāzi, ārstēšanā.

7. Savienojums saskaņā ar 6. pretenziju, kur slimība vai traucējumi ir izvēlēti no rindas, kas sastāv no: hipoparatiroidisma, osteosarkomas, periodontālās slimības, kaulu lūzuma saaugšanas, osteoartrīta, reimatoīdā artrīta, Pedžeta slimības, humorālās hiperkalcēmijas, kas saistīta ar ļaundabīgu audzēju, humorālās hiperkalcēmijas, kas saistīta ar kaulu lūzuma saaugšanu un osteoporozi.

8. Savienojuma saskaņā ar 5. pretenziju izmantošana paratireoīdā hormonu līmeņa paaugstināšanai serumā zīdītājiem.

9. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai izmantošana medikamenta iegūšanai slimības vai traucējumu, kas saistīti ar kaulu vai minerālvielu patoloģisku homeostāzi, ārstēšanai.

10. Savienojuma saskaņā ar 9. pretenziju izmantošana, kur slimība vai traucējumi ir izvēlēti no rindas, kas sastāv no: hipoparatiroidisma, osteosarkomas, periodontālās slimības, kaulu lūzuma saaugšanas, osteoartrīta, reimatoīdā artrīta, Pedžeta slimības, humorālās hiperkalcēmijas, kas saistīta ar ļaundabīgu audzēju, humorālās hiperkalcēmijas, kas saistīta ar kaulu lūzuma saaugšanu un osteoporozi.

11. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai izmantošana medikamenta iegūšanai, kas paredzēts paratireoīdo hormonu līmeņa paaugstināšanai serumā zīdītājiem.

(51) **C07D 207/12**^(2006.01) (11) **1572641**

C07D 409/12^(2006.01)

A61K 31/381^(2006.01)

A61K 31/40^(2006.01)

A61K 31/402^(2006.01)

A61P 1/06^(2006.01)

A61P 13/06^(2006.01)

C07D 409/12^(2006.01)

C07D 333/00^(2006.01)

C07D207/00^(2006.01)

(21) 03782435.6 (22) 18.12.2003

(43) 14.09.2005

(45) 07.03.2012

(31) 18962002 (32) 18.12.2002 (33) AT

(86) PCT/EP2003/014432 18.12.2003

(87) WO 2004/054971 01.07.2004

(73) MEDA Pharma GmbH & Co. KG, Benzstrasse 1, 61352 Bad Homburg, DE

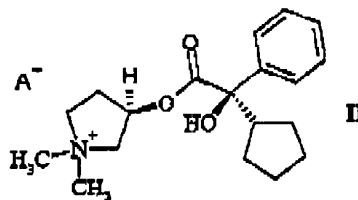
(72) NOE, Christian, R., AT
 WALTER, Martin, R., DE

(74) Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra INTELS, a/k 30, Rīga LV-1083, LV

(54) **R,R (VAI S,S) KONFIGURĀCIJAS GLIKOPIRONIJA STEREOIZOMĒRA IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS**
METHOD FOR PRODUCTION OF THE R,R (OR S,S) CONFIGURATION OF GLYCOPYRRONIUM STEREOISOMERS

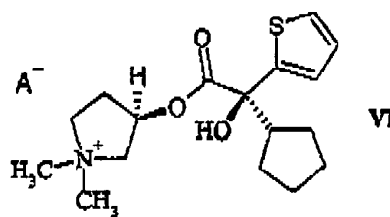
(57) 1. Paņēmiens, lai iegūtu:

a) glikopironija bromīda vai glikopironija jodīda 3R,2'R-stereoizomēru (formula (II): A ir Br vai I)



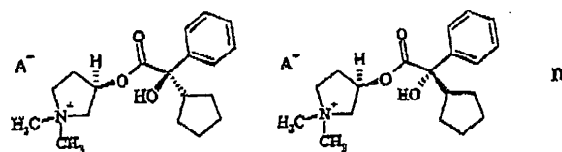
vai

b) glikopironija tienilanaloga 3R,2'S-stereoizomēru, kas ir identisks attiecībā uz tā abu hirālo centru relatīvo konfigurāciju (formula (VI): A ir Br vai I)



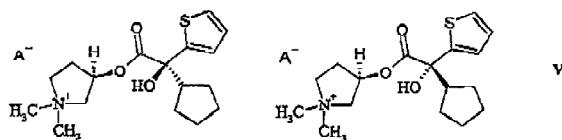
raksturīgs ar to, ka tiek izmantots

a) diastereomēru maisījums, kas sastāv no 3R,2'R- un 3R,2'S-izomēra ar formulu (III), kurā ir savienoti enantiomēri tīra spirta daļa un racēmiskas skābes daļa



vai

b) diastereomēru maisījums, kas sastāv no 3R,2'S- un 3R,2'R-izomēra ar formulu (VII), kurā ir savienoti enantiomēri tīra spirta daļa un racēmiskas skābes daļa



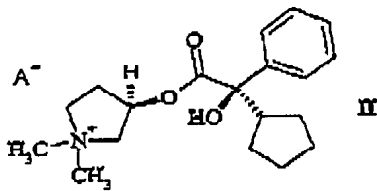
un, ka iepriekš minētie četrizvietoto diastereomēru maisījumi (formula III un VII) tiek iegūti, kvaternizējot atbilstošos trešajos bāziskos diastereomēru maisījumus, un ka kvaternizācijas laikā stereoizomērs ar formulu (II) vai ar formulu (VI), kas katrā atsevišķā gadījumā ir izolējams un īpaši viegli kristalizējas, pēc reakcijas tiek iegūts augsti bagātinātā formā kā nogulsnes, turklāt tiek izmantoti šķīdinātāji vai šķīdinātāju maisījumi, no kuriem vēlams, lai vismaz viens būtu izvēlēts no grupas, kas sastāv no mazmolekulāriem sazarotiem un nesazarotiem spirtiem, tādiem kā metanols, etanols, izopropanols, 1-propanols, *tert*-butanols, izobutanols, n-butanols, kā arī acetons, butanons, acetonitrils,

un/vai

iepriekš minētie četrizvietoto diastereomēru maisījumi (neobligāti jau bagātinātā formā) tiek pārkristalizēti, un stereoizomērs ar formulu (II) vai ar formulu (VI), kas katrā atsevišķā gadījumā ir izolējams un īpaši viegli kristalizējas, pēc reakcijas tiek iegūts augsti bagātinātā formā kā nogulsnes, turklāt šķīdināšanai tiek izmantots metanols un/vai etanols un kristalizācija tiek veikta, izmantojot etilacetātu un/vai *tert*-butilmetilēteri.

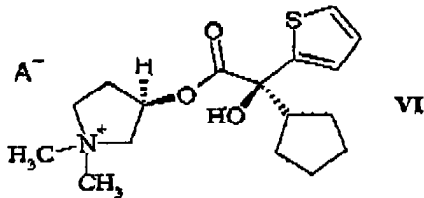
2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, lai iegūtu:

a) glikopironija bromīda vai glikopironija jodīda 3R,2'R stereoizomēru (formula (II): A ir Br vai I)

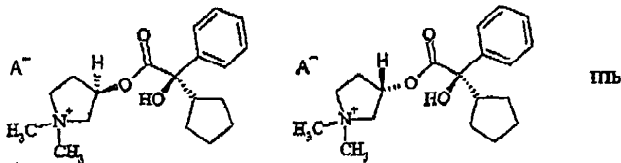


vai

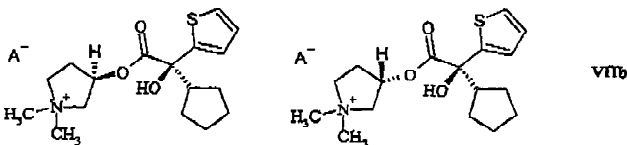
b) glikopironija bromīda vai glikopironija jodīda tienilanaloga 3R,2'S stereoizomēru, kas ir identisks attiecībā uz tā abu hirālo centru relatīvo konfigurāciju (formula (VI): A ir Br vai I)



raksturīgs ar to, ka tiek izmantots diastereomēru maisījums, kas sastāv no 3R,2'R- un 3S,2'R izomēra (formula IIIb), kurā ir savienota racēmiska spirta daļa un enantiomēri tīra skābes daļa



vai diastereomēru maisījums, kas sastāv no 3S,2'S- un 3R,2'S izomēra (formula VIIb), kurā ir savienota racēmiska spirta daļa un enantiomēri tīra skābes daļa

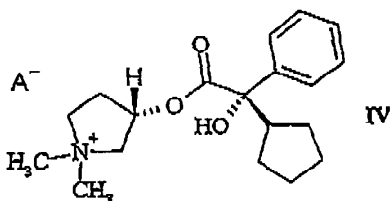


un ka iepriekš minētie čtraizvietoto diastereomēru maisījumi (formula IIIb un VIIb) tiek iegūti, kvaternizējot atbilstošos trešajos bāziskos diastereomēru maisījumus, un ka kvaternizācijas laikā stereoizomērs ar formulu (II) vai ar formulu (VI), kas katrā atsevišķā gadījumā ir izolējams un īpaši viegli kristalizējas, pēc reakcijas tiek iegūts augsti bagātinātā formā kā nogulsnes, turklāt tiek izmantoti šķīdinātāji vai šķīdinātāju maisījumi, no kuriem vēlams, ka vismaz viens ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no mazmolekulāriem sazarotiem un nesazarotiem spirtiem, tādiem kā metanols, etanols, izopropanols, 1-propanols, *tert*-butanols, izobutanols, n-butanols, kā arī acetons, butanons, acetonitrils, un/vai

iepriekš minētie čtraizvietoto diastereomēru maisījumi (neobligāti jau bagātinātā formā) tiek pārkristalizēti, un stereoizomērs ar formulu (II) vai ar formulu (VI), kas katrā atsevišķā gadījumā ir izolējams un īpaši viegli kristalizējas, pēc reakcijas tiek iegūts augsti bagātinātā formā kā nogulsnes, turklāt šķīdināšanai tiek izmantots metanols un/vai etanols un kristalizācija tiek veikta, izmantojot etilacetātu un/vai *tert*-butilmetilēteri.

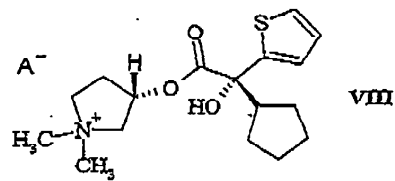
3. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, lai iegūtu antiņpodus, proti,

a) 3S,2'R izomēra antiņpodu (formula (IV) A ir Br vai I)

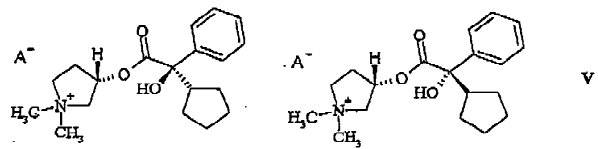


vai

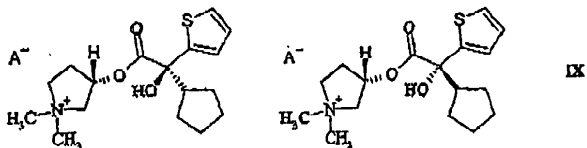
b) 3S,2'R izomēra antiņpodu (formula (VIII) A ir Br vai I)



raksturīgs ar to, ka tiek izmantots diastereomēru maisījums, kas sastāv no 3S,2'R un 3S,2'S izomēra (formula V)



vai diastereomēru maisījums, kas sastāv no 3S,2'S un 3S,2'R izomēra (formula IX)

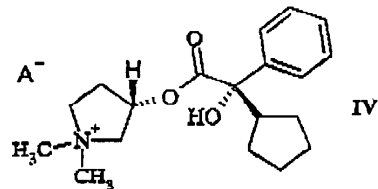


kur katrā atsevišķā gadījumā spirta daļai ir 3S konfigurācija, un ka iepriekš minētie čtraizvietoto diastereomēru maisījumi (formula V un IX) tiek iegūti, kvaternizējot atbilstošos trešajos bāziskos diastereomēru maisījumus, un ka kvaternizācijas laikā stereoizomērs ar formulu (IV) vai ar formulu (VIII), kas katrā atsevišķā gadījumā ir izolējams un īpaši viegli kristalizējas, pēc reakcijas tiek iegūts augsti bagātinātā formā kā nogulsnes, turklāt tiek izmantoti šķīdinātāji vai šķīdinātāju maisījumi, no kuriem vēlams, ka vismaz viens ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no mazmolekulāriem sazarotiem un nesazarotiem spirtiem, tādiem kā metanols, etanols, izopropanols, 1-propanols, *tert*-butanols, izobutanols, n-butanols, kā arī acetons, butanons, acetonitrils, un/vai

iepriekš minētie čtraizvietoto diastereomēru maisījumi (neobligāti jau bagātinātā formā) tiek pārkristalizēti, un stereoizomērs ar formulu (IV) vai ar formulu (VIII), kas katrā atsevišķā gadījumā ir izolējams un īpaši viegli kristalizējas, pēc reakcijas tiek iegūts augsti bagātinātā formā kā nogulsnes, turklāt šķīdināšanai tiek izmantots metanols un/vai etanols un kristalizācija tiek veikta, izmantojot etilacetātu un/vai *tert*-butilmetilēteri.

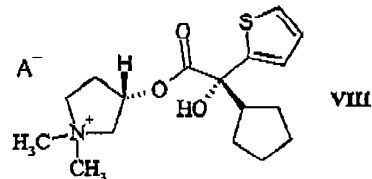
4. Paņēmiens saskaņā ar 1. un 2. pretenziju, lai iegūtu antiņpodus, proti,

a) 3S,2'S izomēra antiņpodu (formula (IV), A ir Br vai I)

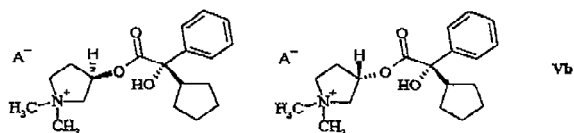


vai

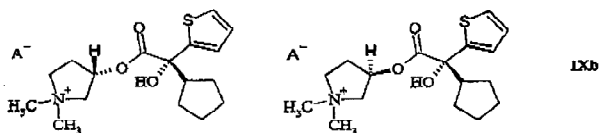
b) 3S,2'R izomēra antiņpodu (formula (VIII), A ir Br vai I)



raksturīgs ar to, ka tiek izmantots diastereomēru maisījums, kas sastāv no 3R,2'S- un 3S,2'S izomēra (formula Vb)



vai
diastereomēru maisījums, kas sastāv no 3R,2'R un 3S,2'R izomēra (formula IXb)



kur skābes sastāvdaļai (Vb) gadījumā ir 2'S konfigurācija, resp., (IXb) gadījumā 2'R konfigurācija ir atbilstošā telpiskā izkārtojumā, un ka iepriekš minētie četrāzvietoto diastereomēru maisījumi (saskaņā ar formulu (Vb) un (IXb)) tiek iegūti, kvaternizējot atbilstošos trešajos bāziskos diastereomēru maisījumus, un ka kvaternizācijas laikā stereoizomērs ar formulu (IV), resp., ar formulu (VIII), kas katrā atsevišķā gadījumā ir izolējams un īpaši viegli kristalizējas, pēc reakcijas tiek iegūts augsti bagātinātā formā kā nogulsnes, turklāt tiek izmantoti šķīdinātāji vai šķīdinātāju maisījumi, no kuriem vēlams, ka vismaz viens ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no mazmolekulāriem sazarotiem un nesazarotiem spirtiem, tādiem kā metanols, etanols, izopropanols, 1-propanols, *tert*-butanols, izobutanols, n-butanols, kā arī acetons, butanons, acetonitrils, un/vai

iepriekš minētie četrāzvietoto diastereomēru maisījumi (neobligāti jau bagātinātā formā) tiek pārkristalizēti, un stereoizomērs ar formulu (IV) vai ar formulu (VIII), kas katrā atsevišķā gadījumā ir izolējams un īpaši viegli kristalizējas, pēc reakcijas tiek iegūts augsti bagātinātā formā kā nogulsnes, turklāt šķīdināšanai tiek izmantots metanols un/vai etanols, un kristalizācija tiek veikta, izmantojot etilacetātu un/vai *tert*-butilmetilēteri.

- (51) **C07C 253/34**^(2006.01) (11) **1581483**
C07D 307/87^(2006.01)
- (21) 03767476.9 (22) 18.12.2003
(43) 05.10.2005
(45) 06.06.2012
(31) 200202004 (32) 23.12.2002 (33) DK
436117 P 23.12.2002 US
(86) PCT/DK2003/000907 18.12.2003
(87) WO 2004/056754 08.07.2004
(73) H. Lundbeck A/S, Ottiliavej 7-9, 2500 Kobenhavn-Valby, DK
(72) PETERSEN, Hans, DK
DANCER, Robert, DK
CHRISTIANSEN, Brian, DK
HUMBLE, Rikke, Eva, DK
(74) Kjerrumgaard, Lars Bo, et al, H. Lundbeck A/S, Ottiliavej 9, 2500 Valby-Copenhagen, DK
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV
(54) **RACĒMISKA CITALOPRAMA DIOLA UN/VAI S- VAI R-CITALOPRAMA DIOLU IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS UN ŠĀDU DIOLU IZMANTOŠANA RACĒMISKA CITALOPRAMA, R-CITALOPRAMA UN/VAI S-CITALOPRAMA PAGATAVOŠANAI**
A PROCESS FOR THE PREPARATION OF RACEMIC CITALOPRAM DIOL AND/OR S- OR R-CITALOPRAM DIOLS AND THE USE OF SUCH DIOLS FOR THE PREPARATION OF RACEMIC CITALOPRAM, R-CITALOPRAM AND/OR S-CITALOPRAM

(57) 1. Racēmiska 4-[4-(dimetilamino)-1-(4-fluorfenil)-1-hidroksibutil]-3-(hidroksimetil)benzo-nitrila (diola) brīvās bāzes un/vai pievienotās skābes sāls, un/vai *R*- vai *S*-diola brīvās bāzes, un/vai pievienotās skābes sāls pagatavošanas process, kas satur sākotnējā neracēmiskā *R*- vai *S*-diola brīvās bāzes un/vai pievienotās

skābes sāls maisījuma sadalīšanu par frakciju ar vairāk kā 50 % viena no enantiomēriem, kas bagātināta ar *R*- vai *S*-diola brīvo bāzi un/vai pievienotās skābes sāli un frakciju, kas satur *RS*-diola brīvo bāzi un/vai pievienotās skābes sāli, kur attiecība *R*-diols:*S*-diols ir 1:1, vai tuvāk proporcijai 1:1 nekā sākotnējā *R*- vai *S*-diola maisījumā, kas raksturīgs ar to, ka

i) *RS*-diola brīvā bāze un/vai pievienotās skābes sāls tiek izgulsnēts no *R*- un *S*-diola brīvās bāzes un/vai pievienotās skābes sāls sākotnējā neracēmiskā maisījuma šķīduma; vai *R*- vai *S*-diola brīvā bāze un/vai pievienotās skābes sāls tiek izšķīdināts šķīdinātājā no sākotnējā neracēmiskā *R*- vai *S*-diola brīvās bāzes un/vai pievienotās skābes sāls maisījuma minētajā šķīdinātājā, atstājot nogulsnes, kas satur *RS*-diola brīvo bāzi un/vai pievienotās skābes sāli;

ii) izveidojušās nogulsnes tiek atdalītas no beigu šķīduma fāzes;

ii) ja nogulsnes ir kristāliskas, tās neobligāti tiek vienu vai vairākas reizes pārkristalizētas, lai veidotos racēmisks diols;

ii) ja nogulsnes nav kristāliskas, stadijas i) un ii) tiek neobligāti atkārtotas, līdz tiek iegūtas kristāliskas nogulsnes, un kristāliskās nogulsnes neobligāti tiek vienu vai vairākas reizes pārkristalizētas, lai veidotos racēmisks diols;

iii) beigu šķīduma fāze tiek neobligāti pakļauta tālākai attīrīšanai, un *S*-diola un *R*-diola brīvā bāze un/vai pievienotās skābes sāls tiek izolēts no beigu šķīduma fāzes;

iv) iegūtās diolu brīvās bāzes neobligāti tiek pārveidotas par to pievienoto skābju sāļiem, vai iegūtie diolu pievienoto skābju sāļi neobligāti tiek pārveidoti par citiem pievienoto skābju sāļiem, vai iegūtie diolu pievienoto skābju sāļi neobligāti tiek pārveidoti par attiecīgajām brīvajām bāzēm.

2. *R*-diola vai *S*-diola brīvās bāzes, un/vai pievienotās skābes sāls pagatavošanas process saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka

i) *RS*-diola brīvā bāze un/vai pievienotās skābes sāls ir izgulsnēts no *R*- un *S*-diola brīvās bāzes un/vai pievienotās skābes sāls sākotnējā neracēmiskā maisījuma šķīduma; vai *R*- vai *S*-diola brīvā bāze un/vai pievienotās skābes sāls ir izšķīdināts šķīdinātājā no sākotnējā neracēmiskā *R*- vai *S*-diola brīvās bāzes un/vai pievienotās skābes sāls maisījuma minētajā šķīdinātājā, atstājot nogulsnes, kas satur *RS*-diola brīvo bāzi un/vai pievienotās skābes sāli;

ii) izveidojušās nogulsnes tiek atdalītas no beigu šķīduma fāzes;

iii) beigu šķīduma fāze tiek neobligāti pakļauta tālākai attīrīšanai, un *S*-diola un *R*-diola brīvā bāze un/vai pievienotās skābes sāls tiek izolēts no beigu šķīduma fāzes.

3. Process saskaņā ar 2. pretenziju, kur pagatavotais diols ir *S*-diola brīvā bāze un/vai pievienotās skābes sāls.

4. Process saskaņā ar 2. pretenziju, kur pagatavotais diols ir *R*-diola brīvā bāze un/vai pievienotās skābes sāls.

11. Process saskaņā ar 10. pretenziju, kur skābe var būt:

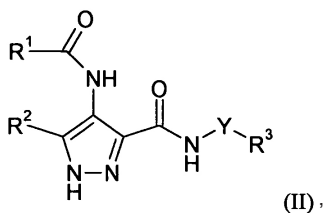
- pievienota pēc tam, kad *R*- un *S*-diola brīvās bāzes un/vai pievienotās skābes sāls sākotnējais neracēmiskais maisījums ir iegūts vai izšķīdināts piemērotā šķīdinātājā; un/vai
- klātesoša šķīdinātājā pirms un/vai *R*- un *S*-diola brīvās bāzes un/vai pievienotās skābes sāls sākotnējā neracēmiskā maisījuma šķīdināšanas laikā; un/vai
- klātesoša *R*- un *S*-diola brīvās bāzes un/vai pievienotās skābes sāls sākotnējā neracēmiskā maisījumā pirms izšķīdināšanas šķīdinātājā vai tās laikā.

26. Citaloprāma brīvās bāzes un/vai kā pievienotās skābes sāls, un/vai *S*-citaloprāma brīvās bāzes un/vai kā pievienotās skābes sāls, un/vai *R*-citaloprāma brīvās bāzes un/vai kā pievienotās skābes sāls, kas ietver *RS*-diola brīvās bāzes un/vai kā pievienotās skābes sāls, un/vai *S*-diola brīvās bāzes un/vai kā pievienotās skābes sāls, un/vai *R*-diola brīvās bāzes un/vai kā pievienotās skābes sāls iegūšanu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 25. pretenzijai, kam seko gredzena noslēgšana, iegūšanas paņēmieni.

- (51) **C07D 231/38**^(2006.01) (11) **1651612**
C07D 231/42^(2006.01)
C07D 403/12^(2006.01)

C07D 401/12^(2006.01)C07D 405/12^(2006.01)C07D 409/12^(2006.01)C07D 413/12^(2006.01)C07D 401/14^(2006.01)A61K 31/415^(2006.01)A61P 35/00^(2006.01)A61P 31/10^(2006.01)A61P 31/12^(2006.01)A61P 37/00^(2006.01)A61P 25/28^(2006.01)

- (21) 04743512.8 (22) 22.07.2004
 (43) 03.05.2006
 (45) 11.04.2012
 (31) 0317127 (32) 22.07.2003 (33) GB
 489046 P 22.07.2003 US
 569763 P 10.05.2004 US
 (86) PCT/GB2004/003179 22.07.2004
 (87) WO 2005/012256 10.02.2005
 (73) Astex Therapeutics Limited, 436 Cambridge Science Park, Milton Road, Cambridge CB4 0QA, GB
 (72) BERDINI, Valerio, 436 Cambridge Science Park, GB
 O'BRIEN, Michael, Alistair, GB
 CARR, Maria, Grazia, 436 Cambridge Science Park, GB
 EARLY, Theresa, Rachel, 436 Cambridge Science Park, GB
 GILL, Adrian. L., 436 Cambridge Science Park, GB
 TREWARTHA, Gary, 436 Cambridge Science Park, GB
 WOOLFORD, Alison, Jo-Anne, GB
 WOODHEAD, Andrew, James, GB
 WYATT, Paul, Graham, 436 Cambridge Science Park, GB
 (74) Hutchins, Michael Richard, et al, Elkington and Fife LLP, Prospect House, 8 Pembroke Road, Sevenoaks, Kent TN13 1XR, GB
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
 (54) **3,4-DIVAIZVĪTOTI 1H-PIRAZOLA SAVIENOJUMI UN TO PIELIETOJUMS PAR CIKLĪNATKARĪGU KINĀŽU (CDK) UN GLIKOGĒNA SINTĀZES KINĀZES-3 (GKS-3) MODULATORIEM**
3,4-DISUBSTITUTED 1H-PYRAZOLE COMPOUNDS AND THEIR USE AS CYCLIN DEPENDENT KINASES (CDK) AND GLYCOGEN SYNTHASE KINASE-3 (GSK-3) MODULATORS
 (57) 1. Savienojums, kas ir savienojums ar formulu (II)



vai tā sāļi, tautomēri, N-oksīdi vai solvāti;
 kur

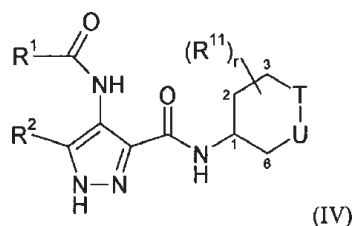
Y ir saite vai 1, 2 vai 3 oglekļa atomu gara alkilēnķēde; R¹ ir 3 līdz 12 locekļu karbocikliska vai heterocikliska grupa, kur karbocikliskā vai heterocikliskā grupa ir neaizvietota vai aizvietota ar vienu vai vairākām aizvietojošām grupām R¹⁰; vai C₁₋₈hidrokarbilgrupa, iespējami aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietojošajiem, kas atlasīti no fluora atoma, hidroksilgrupas, C₁₋₄hidrokarbiloksigrupas, aminogrupas, mono- vai di-C₁₋₄hidrokarbilaminogrupas un 3 līdz 12 locekļu karbocikliskām vai heterocikliskām grupām, kur karbocikliskā vai heterocikliskā grupa ir neaizvietota vai aizvietota ar vienu vai vairākām aizvietojošām grupām R¹⁰; R² ir ūdeņraža atoms vai metilgrupa; R³ ir atlasīts no nearomātiskām 3 līdz 12 locekļu karbocikliskām un heterocikliskām grupām, kur karbocikliskās vai heterocikliskās grupas ir neaizvietotas vai aizvietotas ar vienu vai vairākām aizvietojošām grupām R¹⁰; un R¹⁰ ir atlasīts no halogēna atoma, hidroksilgrupas, trifluormetilgrupas, ciāngrupas, nitrogrupas, karboksilgrupas, aminogrupas, mono- vai di-C₁₋₄hidrokarbilaminogrupas, 3 līdz 12 locekļu karbocikliskām un heterocikliskām grupām; grupas R^a-R^b, kur R^a ir saite, O, CO, X¹C(X²), C(X²)X¹, X¹C(X²)X¹, S, SO, SO₂, NR^c, SO₂NR^c vai NR^cSO₂,

un R^b ir atlasīts no ūdeņraža atoma, 3 līdz 12 locekļu karbocikliskām un heterocikliskām grupām, un C₁₋₈hidrokarbilgrupas, iespējami aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietojošajiem, kas atlasīti no hidroksilgrupas, oksogrupas, halogēna atoma, ciāngrupas, nitrogrupas, karboksilgrupas, aminogrupas, mono- vai di-C₁₋₄hidrokarbilaminogrupas, 3 līdz 12 locekļu karbocikliskām un heterocikliskām grupām; R^c ir atlasīts no ūdeņraža atoma un C₁₋₄hidrokarbilgrupas; un X¹ ir O, S vai NR^c un X² ir =O, =S vai =NR^c; ar noteikumu, ka tad, kad aizvietojošā grupa R¹⁰ ir vai ietver karbociklisku vai heterociklisku grupu, minētā karbocikliskā vai heterocikliskā grupa var savukārt būt neaizvietota vai aizvietota ar vienu vai vairākām grupām R¹⁰, un kur

(a) šādas papildu aizvietojošās grupas R¹⁰ iekļauj karbocikliskas vai heterocikliskas grupas, kas nav papildus aizvietotas, vai

(b) minētie papildu aizvietojošie neiekļauj karbocikliskas vai heterocikliskas grupas, bet citādi ir atlasīti no grupām, kas uzskaitītas augstāk, definējot R¹⁰.

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



vai sāļi, tautomēri, N-oksīdi vai solvāti;

kur R¹ un R² ir tādi, kā definēti jebkurā no iepriekšējām pretenzijām; ar iespējamu otru saiti starp oglekļa atomiem, kas numurēti ar 1 un 2;

viens no U un T ir atlasīts no CH₂, CHR¹³, CR¹¹R¹³, NR¹⁴, N(O)R¹⁵, O un S(O)_r; otrs no U un T ir atlasīts no NR¹⁴, O, CH₂, CHR¹¹, C(R¹¹)₂ un C=O; r ir 0, 1, 2, 3 vai 4; t ir 0, 1 vai 2; R¹¹ ir atlasīts no ūdeņraža atoma, halogēna atoma, C₁₋₃alkilgrupas un C₁₋₃alkoksigrupas; R¹³ ir atlasīts no ūdeņraža atoma, NHR¹⁴, NOH, NOR¹⁴ un R^a-R^b;

R¹⁴ ir atlasīts no ūdeņraža atoma un R^d-R^b;

R^d ir atlasīts no saites, CO, C(X²)X¹, SO₂ un SO₂NR^c;

R^a, R^b un R^c ir tādi, kā definēti jebkurā no iepriekšējām pretenzijām; un R¹⁵ ir atlasīts no piesātinātas C₁₋₄hidrokarbilgrupas, kas iespējami aizvietota ar hidroksilgrupu, C₁₋₂alkoksigrupu, halogēna atomu vai monociklisku 5 vai 6 locekļu karbociklisku vai heterociklisku grupu, ar noteikumu, ka U un T vienlaikus nevar būt O.

27. Savienojums pielietojumam medicīnā, kur šis savienojums ir tāds, kāds definēts jebkurā no 1. līdz 26. pretenzijai.

28. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu, kāds definēts jebkurā no 1. līdz 26. pretenzijai, un farmaceitiski pieņemamu nesēju.

29. Farmaceutiskā kompozīcijā saskaņā ar 28. pretenziju, kas ir intravenozai ievadīšanai piemērotā formā.

30. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 29. pretenziju, kas ir piemērota ievadīšanai ar injekciju vai infūziju.

31. Savienojums, kā tas definēts jebkurā no 1. līdz 26. pretenzijai, pielietojumam tādas slimības vai stāvokļa profilaksei vai ārstēšanai, kas tiek mediēta ar ciklīnkarīgu kināzi.

32. Savienojuma, kas definēts jebkurā no 1. līdz 26. pretenzijai, pielietojums tādas slimības vai stāvokļa profilaksei vai ārstēšanai, kas tiek mediēta ar ciklīnkarīgu kināzi.

33. Savienojuma, kas definēts jebkurā no 1. līdz 26. pretenzijai, pielietojums tādas slimības vai stāvokļa profilaksei vai ārstēšanai, kas atlasīta no proliferatīviem traucējumiem, vīrusu infekcijām, autoimūnām slimībām un neirodeģeneratīvām slimībām.

34. Savienojums pielietojumam saskaņā ar 33. pretenziju, kur slimība vai stāvoklis ir proliferatīvs traucējums.

35. Savienojums pielietojumam saskaņā ar 34. pretenziju, kur proliferatīvais traucējums ir vēzis.

36. Savienojums pielietojumam saskaņā ar 35. pretenziju, kur vēzis ir atlasīts no urīnpūšļa karcinomas, krūts dziedzera, resnās zarnas, nieru, epidermas, aknu, plaušu, barības vada, žultspūšļa, olnīcu, aizkuņģa dziedzera, kuņģa, dzemdes kakliņa, vairogdziedzera, prostatas vai ādas vēža; asinsrades sistēmas audzēja ar limfotūdu izcelsmi; asinsrades sistēmas audzēja ar mielotūdu izcelsmi; vairogdziedzera folikulārā vēža; mezenhimālas izcelsmes

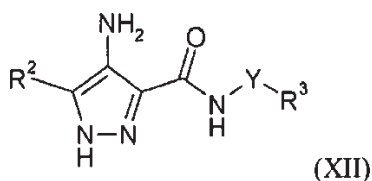
audzēja, centrālās vai perifērās nervu sistēmas audzēja; melanomas; seminomas; teratokarcinomas; osteosarkomas; *kseroderma pigmentosum*; keratoakantomas; vairogdziedzera folikulārā vēža un Kapoši sarkomas.

39. Savienojuma, kas definēts jebkurā no 1. līdz 26. pretenzijai, pielietojums medikamenta ražošanai, kas paredzēts pielietojumam saskaņā ar jebkuru no 33. līdz 38. pretenzijai.

40. Savienojuma, kas definēts jebkurā no 1. līdz 26. pretenzijai, pielietojums medikamenta ražošanai, kas paredzēts slimības vai stāvokļa ārstēšanai vai profilaksei pacientam, kurš ir izmeklēts un kuram konstatēta tāda slimība vai stāvoklis, vai tādas slimības vai stāvokļa risks, kas pakļaujas ārstēšanai ar savienojumu, kuram piemīt aktivitāte pret ciklīnkarīgu kināzi.

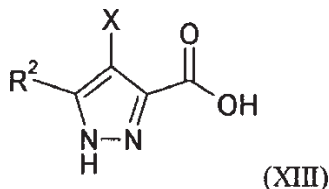
41. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 26. pretenzijai iegūšanas process, kas ietver:

(i) karbonskābes ar formulu R^1-CO_2H vai tās aktivēta atvasinājuma reakciju ar 4-aminopirazolu ar formulu (XII):



kur Y, R¹, R² un R³ ir tādi, kā definēti jebkurā no 1. līdz 26. pretenzijai; vai

(ii) savienojuma ar formulu (XIII):



reakciju ar savienojumu ar formulu R^3-Y-NH_2 , kur R² un R³ ir tādi, kā definēti jebkurā no 1. līdz 26. pretenzijai, un kur X ir R¹-C(O)-NH-.

(51) **C07D 241/04**^(2006.01) (11) **1658277**
C07C 17/16^(2006.01)
C12P 7/22^(2006.01)
C07C 25/22^(2006.01)
C07C 35/32^(2006.01)
C12P 41/00^(2006.01)
A61K 31/495^(2006.01)
A61P 25/18^(2006.01)
C07C 29/143^(2006.01)

(21) 04762772.4 (22) 18.08.2004

(43) 24.05.2006

(45) 04.04.2012

(31) 200301180 (32) 18.08.2003 (33) DK
 496058 P 18.08.2003 US
 200301305 11.09.2003 DK
 520246 P 14.11.2003 US

(86) PCT/DK2004/000545 18.08.2004

(87) WO 2005/016900 24.02.2005

(73) H. Lundbeck A/S, Ottiliavej 9, 2500 Valby-Copenhagen, DK

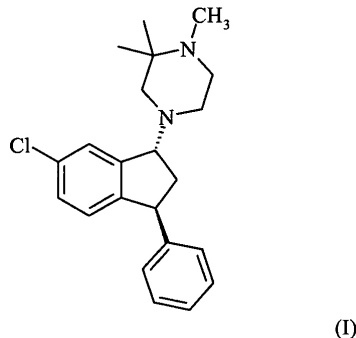
(72) LOPEZ DE DIEGO, Heidi, DK
 NIELSEN, Ole, DK
 RINGGARD, Lone, Munch, DK
 SVANE, Henrik, DK
 DAHL, Allan, Carsten, DK
 HOWELLS, Mark, DK
 BANG-ANDERSEN, Benny, DK
 LYNGSO, Lars Ole, DK

(74) Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV

(54) **TRANS-4-((1R,3S)-6-ĦLOR-3-FENILINDAN-1-IL)-1,2,2-TRIMETILPIPERAZĪNA SUKCIŅĀTI UN MALONĀTI UN TO IZMANTOŠANA PAR MEDIKAMENTIEM**

SUCCINATE AND MALONATE SALT OF TRANS-4-((1R,3S)-6-CHLORO-3-PHENYLINDAN-1-YL)-1,2,2-TRIMETHYLPIPERAZINE AND THE USE AS A MEDICAMENT

(57) 1. Savienojuma ar formulu (I):



[*trans*-4-((1*R*,3*S*)-6-Ħlor-3-fenilindan-1-il)-1,2,2-trimetilpiperazīns] sukcināts vai malonāts.

2. Sukcināts saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir savienojuma ar formulu (I) hidrogēnsukcināts.

3. Savienojuma (I), kā definēts 1. pretenzijā, kristālisks hidrogēnsukcināts.

6. Malonāts saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir savienojuma ar formulu (I) hidrogēnmalonāts.

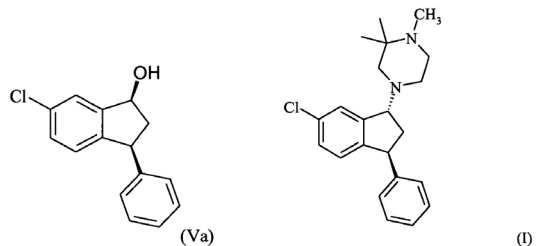
7. Savienojuma (I), kā definēts 1. pretenzijā, kristālisks hidrogēnmalonāts.

9. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai kopā ar vismaz vienu farmaceutiski pieņemamu nesēju, pildvielu vai šķīdinātāju.

10. Sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai izmantošanai medicīnā.

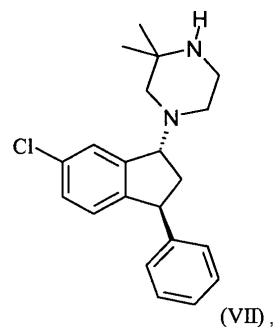
11. Sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai izmantošana medikamentā slimības, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no slimībām, kas ietver psihotiskus simptomus, trauksmes stāvokļus, afektīvus stāvokļus, ieskaitot depresiju, miega traucējumus, migrēnas, neiroleptiskas izcelsmes parkinsonismu, vai atkarības, piemēram, kokaīna atkarību, nikotīna atkarību vai alkohola atkarību, ārstēšanai.

15. 4-((1*R*,3*S*)-6-Ħlor-3-fenilindan-1-il)-1,2,2-trimetilpiperazīna (formula I) vai tā sāls iegūšanas paņēmieni, kas ietver savienojuma ar formulu (Va) *cis*-konfigurācijā pārvēršanu par savienojumu ar formulu (I), kur formulas (I) un (Va) ir sekojošas:



20. Savienojuma ar formulu (I) brīvās bāzes iegūšanas paņēmieni saskaņā ar jebkuru no 16. līdz 19. pretenzijai, kur

a. savienojums (VI) reaģē ar 2,2-dimetilpiperazīnu, lai iegūtu savienojumu ar formulu (VII)

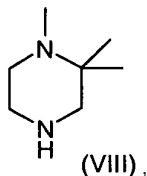


b. savienojumu (VII) metilē pie otrējā amīna, lai iegūtu savienojuma ar formulu (I) brīvo bāzi.

21. Paņēmiens saskaņā ar 20. pretenziju, kur savienojums ar formulu (VII) ir izgulsnēts kā piemērots sāls, piem., organiskas skābes, tādas kā organiskas divbāziskas skābes, sāls.

22. Paņēmiens saskaņā ar 21. pretenziju, kur iegūtais sāls ir savienojuma (VII) hidrogēnfumarāts vai hidrogēnmaleāts.

23. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 17. līdz 21. pretenzijai, kur savienojums (VI) ir reaģējis ar 1,2,2-trimetilpiperazīnu (formula VIII)



(VIII),

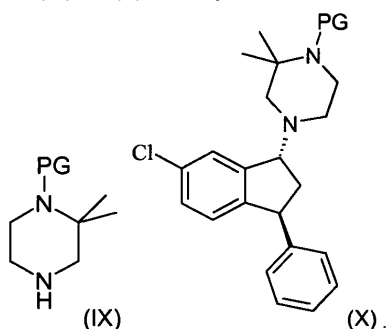
lai iegūtu savienojuma ar formulu (I) brīvo bāzi.

24. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 17. līdz 20. pretenzijai, kas ietver:

- savienojuma (VI) reakciju ar 1-aizsargātu 2,2-dimetilpiperazīnu (IX), kur PG ir aizsarggrupa, tādējādi iegūstot savienojumu ar formulu (X); un

- aizsarggrupas noņemšanu savienojumam (X), lai iegūtu savienojumu (VII), vai savienojuma (X) tiešu pārvēršanu savienojumā (I),

kur savienojumi (IX) un (X) ir sekojoši:

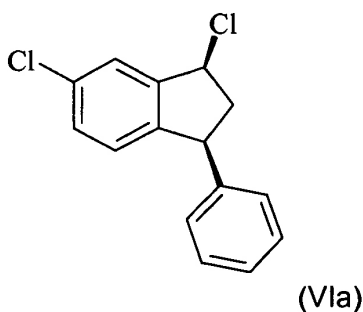


(IX)

(X)

26. Paņēmiens savienojuma ar formulu (I) vai tā sāls iegūšanai, kas ietver savienojuma ar formulu (VIa) (t.i. savienojuma VI, kurā LG ir Cl) reakciju ar 2,2-dimetilpiperazīnu, tādējādi iegūstot savienojumu ar formulu (VII), un sekojošu tā metilēšanu pie otrējā amīna.

27. Paņēmiens savienojuma ar formulu (I) vai tā sāls iegūšanai, kas ietver savienojuma ar formulu (VIa) (t.i. savienojuma VI, kurā LG ir Cl)



(VIa)

reakciju ar 2,2-dimetilpiperazīnu bāzes klātbūtnē, un sekojošu tā reducējošu aminēšanu ar piemērotiem reaģentiem, tādējiem kā formaldehīds, paraformaldehīds, trioksāns vai dietoksimetāns, un sekojošu savienojuma ar formulu (I) izdalīšanu kā brīvu bāzi vai tā sāls veidā.

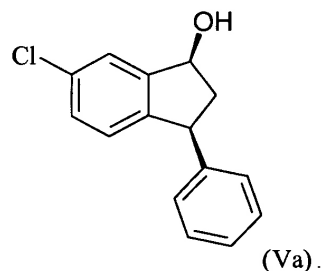
28. Paņēmiens 4-((1*R*,3*S*)-6-hlor-3-fenilindan-1-il)-1,2,2-trimetilpiperazīna (formula I) vai tā sāls pagatavošanai, kas ietver savienojuma ar formulu (VII) pārvēršanu par savienojumu ar formulu (I), kur formula (VII) ir saskaņā ar 20. pretenziju.

29. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 15. līdz 25. pretenzijai, kur savienojums ar formulu (I) ir izgulsnēts kā piemērots sāls, piem., organiskās skābes sāls, tāds kā organiskās divbāziskas skābes sāls, ar mērķi aizvākt nevēlamo *cis* diastereoizomēru.

35. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 15. līdz 34. pretenzijai, kas ietver savienojuma ar formulu (I) brīvās bāzes konversiju par

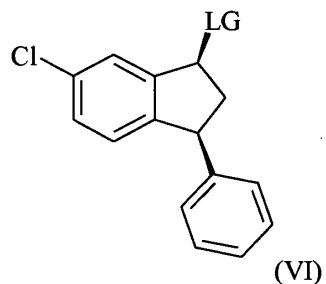
sāli, kā definēts jebkurā no 1. līdz 10. pretenzijai.

38. Savienojums (Va) ar struktūru:



(Va).

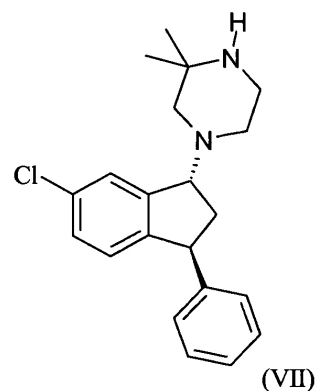
39. Savienojums (VI) ar struktūru:



(VI),

kur LG ir potenciālā atšķejamā grupa, piem., izvēlēta no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, piem., Br vai Cl, vislabāk Cl, vai sulfonāta.

40. Savienojums (VII) ar sekojošu struktūru:



(VII)

vai tā sāls.

- | | | |
|---|---------------------|---------|
| (51) C07D 213/61 ^(2006.01) | (11) 1701941 | |
| (21) 04813958.8 | (22) 13.12.2004 | |
| (43) 20.09.2006 | | |
| (45) 30.05.2012 | | |
| (31) 528877 P | (32) 11.12.2003 | (33) US |
| (86) PCT/US2004/041712 | 13.12.2004 | |
| (87) WO 2005/058829 | 30.06.2005 | |
| (73) Board of Regents, The University of Texas System, 201 West 7th Street, Austin, Texas 78701, US | | |
| (72) PRIEBE, Waldemar, US
DONATO, Nicholas, US
TALPAZ, Moshe, US
SZYMANSKI, Slawomir, US
FOKT, Izabela, US
LEVITZKI, Alexander, IL | | |
| (74) Vossius & Partner, Siebertstrasse 4, 81675 München, DE
Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV | | |
| (54) SAVIENOJUMI ŠŪNU PROLIFERATĪVU SLIMĪBU ĀRSTĒŠANAI
COMPOUNDS FOR TREATMENT OF CELL PROLIFERATIVE DISEASES | | |
| (57) 1. Savienojums, kas ietver ķīmisku formulu: | | |

L2 neatkarīgi cita no citas ir izvēlētas no virknes: fluora atoms, hlora atoms, broma atoms, joda atoms, C₁₋₃alkilgrupa, difluormetilgrupa, trifluormetilgrupa, C₁₋₃alkoksigrupa, difluormetoksigrupa, trifluormetoksigrupa un ciāngrupa, un

R⁶ ir ūdeņraža atoms, (C₁₋₆alkil)oksikarbonilgrupa vai C₁₋₆alkilkarbonilgrupa,

R^{7a}, R^{7b}, R^{7c} ir ūdeņraža atoms,

kur minēto grupu definīcijā arilgrupas nozīmē fenilgrupu vai naftilgrupu, kas neatkarīgi viena no otras var būt mono- vai diaizvietota ar vienādu vai atšķirīgu L2 grupu, un minēto grupu definīcijā heteroarilgrupas nozīmē pirolilgrupu, furanilgrupu, tienilgrupu, piridilgrupu, indolilgrupu, benzofuranilgrupu, benzotiofenilgrupu, hinolilgrupu, izohinolilgrupu vai tetrazolilgrupu, vai nozīmē pirolilgrupu, furanilgrupu, tienilgrupu vai piridilgrupu, kur viena vai divas metilgrupas ir aizvietotas ar slāpekļa atomu, vai nozīmē indolilgrupu, benzofuranilgrupu, benzotiofenilgrupu, hinolilgrupu vai izohinolilgrupu, kur viena līdz trīs metilgrupas ir aizvietotas ar slāpekļa atomu,

kur minētās heteroarilgrupas neatkarīgi cita no citas var būt mono- vai diaizvietotas ar vienādu vai atšķirīgu L2 grupu;

kur, ja nav noteikts citādi, minētās alkilgrupas var būt ar sazarotu ķēdi,

to tautomēri, stereoizomēri, to maisījumi un to sāļi.

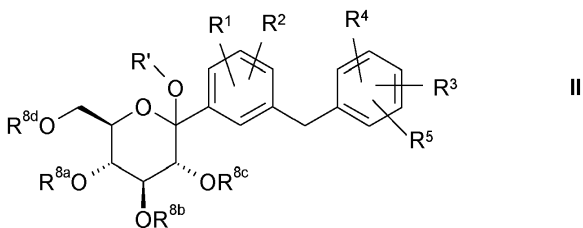
22. Savienojuma saskaņā vismaz ar vienu no 1. līdz 21. pretenzijai fizioloģiski pieņemams sāls ar neorganisko vai organisko skābi.

23. Medikaments, kas satur savienojumu saskaņā vismaz ar vienu no 1. līdz 21. pretenzijai vai fizioloģiski pieņemamu sāli saskaņā ar 22. pretenziju, neobligāti kopā ar vienu vai vairākiem inertiem nesējiem un/vai šķīdinātājiem.

24. Vismaz viena savienojuma saskaņā vismaz ar vienu no 1. līdz 21. pretenzijai vai fizioloģiski pieņemama sāls saskaņā ar 22. pretenziju izmantošana medikamenta ražošanai, kas paredzēts metabolisma slimību, kas izvēlētas no 1. un 2. tipa cukura diabēta, diabēta komplikācijām, metabolās acidozes vai ketozes, reaktīvās hipoglikēmijas, hiperinsulinēmijas, glikozes metabolisma slimības, insulīnrezistences, metabolisma sindroma, dažādas izcelsmes dislipidēmijas, aterosklerozes un ar to saistīto slimību, aptaukošanās, augsta asinsspiediena, hroniskas sirds mazspējas, tūskas un hiperurikēmijas ārstēšanai vai profilaksei.

27. Vismaz viena savienojuma saskaņā vismaz ar vienu no 1. līdz 21. pretenzijai vai fizioloģiski pieņemama sāls saskaņā ar 22. pretenziju izmantošana medikamenta ražošanai aizkuņģa dziedzera beta šūnu deģenerācijas novēršanai un/vai aizkuņģa dziedzera beta šūnu funkciju uzlabošanai un/vai atjaunošanai.

29. Paņēmiens savienojuma ar vispārīgo formulu (I) saskaņā ar no 1. līdz 21. pretenzijai ražošanai, kas raksturīgs ar to, ka savienojums ar vispārīgo formulu (II)



kur

R¹ ir H, C₁₋₄alkilgrupa, (C₁₋₁₈alkil)karbonilgrupa, (C₁₋₁₈alkil)oksikarbonilgrupa, arilkarbonilgrupa un aril-(C₁₋₃alkil)-karbonilgrupa, kur alkilgrupa vai arilgrupa var būt mono- vai poliaizvietota ar halogēna atomu;

R^{8a}, R^{8b}, R^{8c}, R^{8d} neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no virknes: ūdeņraža atoms, (C₁₋₁₈alkil)karbonilgrupa, (C₁₋₁₈alkil)oksikarbonilgrupa, arilkarbonilgrupa un aril-(C₁₋₃alkil)-karbonilgrupa vai ir benzilgrupa, vai R^aR^bR^cSi grupa, vai ketālgrupa, vai acetālgrupa, kur katrā gadījumā divas blakus esošas grupas R^{8a}, R^{8b}, R^{8c}, R^{8d} var veidot ciklisku ketālgrupu vai acetālgrupu, vai 1,2-di(C₁₋₃alkoksi)-1,2-di(C₁₋₃alkil)-etilēna tiltiņu, kur minētais etilēna tiltiņš kopā ar diviem skābekļa atomiem un diviem saistītiem oglekļa atomiem veido piranozes gredzenu, aizvietota dioksāngrupa un alkilgrupa, arilgrupa un/vai benzilgrupa var būt mono- vai poliaizvietota ar halogēna atomu, vai C₁₋₃alkoksigrupa un benzilgrupa arī var būt aizvietota ar di-(C₁₋₃alkil)aminogrupu, un

R^a, R^b, R^c neatkarīgi cits no cita ir C₁₋₄alkilgrupa, arilgrupa vai aril-C₁₋₃alkilgrupa, kur arilgrupa vai alkilgrupa var būt mono- vai poliaizvietota ar halogēna atomu;

kur minētajā definīcijā arilgrupas nozīmē fenilgrupas vai naftilgrupas, labāk fenilgrupas;

un R¹ līdz R⁵ ir nozīmes, kas definētas no 1. līdz 21. pretenzijai, reaģē ar reducējošo līdzekli Lūisa vai Brensteda skābes klātbūtnē, kur jebkura šī aizsarggrupa vienlaicīgi vai secīgi tiek sašķelta;

ja vajadzīgs, tādā veidā iegūto savienojumu ar vispārīgo formulu (I), kur R⁶ ir ūdeņraža atoms, ar acilēšanu pārveido atbilstošā acilgrupas savienojumā ar vispārīgo formulu (I) un/vai,

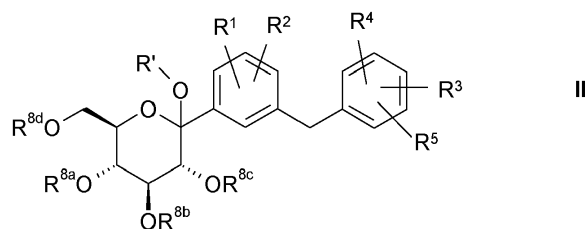
ja vajadzīgs, jebkura reakcijā izmantotā iepriekš aprakstītā aizsarggrupa tiek sašķelta, un/vai,

ja ir vajadzīgs, tādā veidā iegūto savienojumu ar vispārīgo formulu (I) sadala tā stereoizomēros,

un/vai,

ja ir vajadzīgs, tādā veidā iegūto savienojumu ar vispārīgo formulu (I) pārveido tā fizioloģiski pieņemamos sāļos.

31. Savienojuma ar vispārīgo formulu (II)



iegūšanas paņēmiens, kur

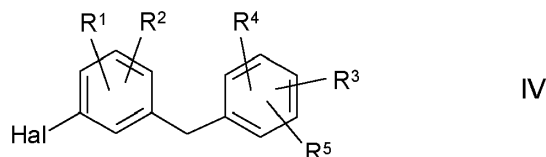
R¹ ir H, C₁₋₄alkilgrupa, (C₁₋₁₈alkil)karbonilgrupa, (C₁₋₁₈alkil)oksikarbonilgrupa, arilkarbonilgrupa vai aril-(C₁₋₃alkil)karbonilgrupa, kur alkilgrupa vai arilgrupa var būt mono- vai poliaizvietota ar halogēna atomu;

R^{8a}, R^{8b}, R^{8c}, R^{8d} neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no virknes: ūdeņraža atoms, (C₁₋₁₈alkil)karbonilgrupa, (C₁₋₁₈alkil)oksikarbonilgrupa, arilkarbonilgrupa un aril-(C₁₋₃alkil)karbonilgrupa, vai ir benzilgrupa vai R^aR^bR^cSi grupa, vai ketālgrupa, vai acetālgrupa, kur katrā gadījumā divas blakus esošas R^{8a}, R^{8b}, R^{8c}, R^{8d} grupas var veidot ciklisku ketālgrupu vai acetālgrupu, vai 1,2-di(C₁₋₃alkoksi)-1,2-di(C₁₋₃alkil)etilēna tiltiņu, kur minētais etilēna tiltiņš kopā ar diviem skābekļa atomiem un diviem saistītiem oglekļa atomiem veido aizvietotā dioksāna gredzenu piranozes gredzenu, un kur alkilgrupa, arilgrupa un/vai benzilgrupa var būt mono- vai poliaizvietota ar halogēna atomu vai C₁₋₃alkoksigrupa, un benzilgrupa arī var būt aizvietota ar di-(C₁₋₃alkil)aminogrupu un

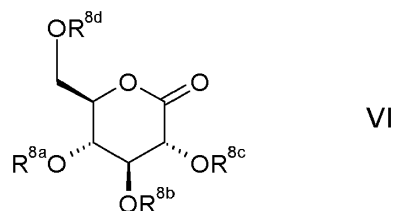
R^a, R^b, R^c neatkarīgi cits no cita ir C₁₋₄alkilgrupa, arilgrupa vai aril-C₁₋₃alkilgrupa, kur arilgrupa vai alkilgrupa var būt mono- vai poliaizvietota ar halogēna atomu;

kur minētajā definīcijā arilgrupas nozīmē fenilgrupu vai naftilgrupu, labāk fenilgrupu;

un R¹ līdz R⁵ ir nozīmes, kas definētas no 1. līdz 21. pretenzijai, kur metālorganiskais savienojums (V), kurš var būt iegūts ar halogēnu-metālu apmaiņu vai ar metāla ievadīšanu oglekļa-halogēna saitē halogēna-benzilbenzola savienojumā ar vispārīgo formulu (IV)

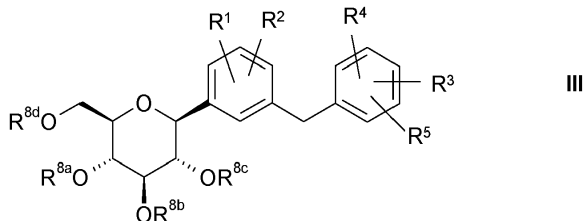


kur Hal ir Cl, Br un I un R¹ līdz R⁵ ir, kā iepriekš definēts, un neobligāti ar metālu apmaiņas reakciju ir pievienots glikonolaktomam ar vispārīgo formulu (VI)



kur R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} ir, kā iepriekš definēts, un tad iegūtais adukts reaģē ar ūdeni vai spirtu $R'-OH$, kur R' ir skābes klātbūtnē neobligāti aizvietota C_{1-4} alkilgrupa un neobligāti reakcijā ar ūdeni iegūtais savienojums, kur R' ir H, kas reakcijā ar acilējošo līdzekli ir pārveidots savienojumā ar formulu (II), kur R' ir (C_{1-18}) alkilkarbonilgrupa, (C_{1-18}) alkiloksikarbonilgrupa, arilkarbonilgrupa vai arilgrupa (C_{1-3}) alkilkarbonilgrupa, kas var būt aizvietota, kā norādīts.

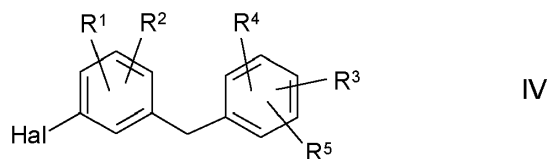
33. Paņēmiens savienojuma ar vispārīgo formulu (I) saskaņā ar 1. līdz 21. pretenziju, kur R^6 ir ūdeņraža atoms, iegūšanai, kas raksturīgs ar to, ka savienojums ar vispārīgo formulu (III)



kur R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no virknes: ūdeņraža atoms, (C_{1-18}) alkilkarbonilgrupa, (C_{1-18}) oksikarbonilgrupa, arilkarbonilgrupa un aril- (C_{1-3}) alkilkarbonilgrupa, bet vismaz viena no R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} grupām nav ūdeņraža atoms, vai ir benzilgrupa vai $R^aR^bR^cSi$ grupa, vai ketālgrupa vai acetālgrupa, kur katrā gadījumā divas blakus esošas R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} grupas var veidot ciklisku ketālgrupu vai acetālgrupu, vai 1,2-di- (C_{1-3}) alkoksi)-1,2-di- (C_{1-3}) alkil)etilēna tiltiņu, kur minētais etilēna tiltiņš veido aizvietotu dioksāna gredzenu kopā ar diviem skābekļa atomiem un piranozes gredzēna saistītiem diviem oglekļa atomiem, un kur alkilgrupa, arilgrupa un/vai benzilgrupa var būt mono- vai poliaizvietota ar halogēna atomu, vai C_{1-3} alkoksigrupu un benzilgrupa arī var būt aizvietotas ar di- (C_{1-3}) alkil)aminogrupu, un R^a , R^b , R^c neatkarīgi cits no cita ir C_{1-4} alkilgrupa, arilgrupa vai aril- C_{1-3} alkilgrupa, kur alkilgrupa vai arilgrupa var būt mono- vai poliaizvietota ar halogēna atomu; kur arilgrupas minētā definīcijā nozīmē fenilgrupu vai naftilgrupu, labāk fenilgrupu;

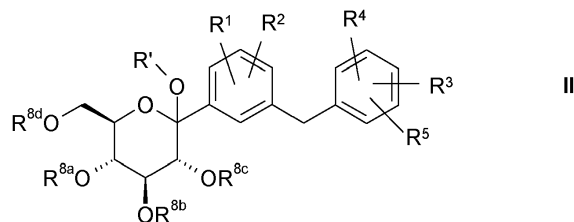
un R^1 līdz R^5 ir nozīmes, kas definētas no 1. līdz 21. pretenzijai, ir hidrolizēts un, ja vajadzīgs, iegūtais savienojums ar vispārīgo formulu (I), kur R^6 ir ūdeņraža atoms, ir pārveidots ar acilējošo līdzekli atbilstošās acilgrupas savienojumā ar vispārīgo formulu (I) un/vai, ja vajadzīgs, jebkura iepriekš aprakstītā reakcijā izmantotā aizsarggrupa, ir izdalīta un/vai, ja vajadzīgs, tādā veidā iegūtais savienojums ar vispārīgo formulu (I) ir sašķelts tā stereozīmes, un/vai, ja vajadzīgs, iegūtais savienojums ar vispārīgo formulu (I) ir pārveidots tā sāļos, it īpaši farmaceitiskai izmantošanai tā fizioloģiski pieņemamos sāļos.

35. Savienojums ar vispārīgo formulu (IV)



kur Hal ir hlora, bromā vai joda atoms un R^1 ir ūdeņraža, fluora, hlora vai bromā atoms, ciāngrupa, metilgrupa, etilgrupa, izopropilgrupa, difluormetilgrupa, trifluormetilgrupa, etinilgrupa, prop-1-in-1-ilgrupa, but-1-in-1-ilgrupa, hidroksilgrupa, metoksigrupa, etoksigrupa, difluormetoksigrupa, ciklopropiloksigrupa, ciklobutiloksigrupa, ciklopentiloksigrupa vai cikloheksiloksigrupa, un R^2 ir ūdeņraža atoms vai metilgrupa, un R^3 ir izvēlēta no virknes: trimetilsililetilgrupa, etinilgrupa, 2-hidroksiprop-2-iletinilgrupa, 2-metoksiprop-2-iletinilgrupa, 3-hidroksi-1-propin-1-ilgrupa, 3-metoksi-1-propin-1-ilgrupa, ciklopropiloksigrupa, ciklobutiloksigrupa, ciklopentiloksigrupa, cikloheksiloksigrupa, tetrahidrofuran-3-iloksigrupa, tetrahidropiran-4-iloksigrupa, piperidin-4-iloksigrupa, N-metilpiperidin-4-iloksigrupa un N-acetilpiperidin-4-iloksigrupa, un R^4 ir ūdeņraža vai fluora atoms, un R^5 ir ūdeņraža vai fluora atoms.

37. Savienojums ar vispārīgo formulu (II)



kur R' ir H, C_{1-4} alkilgrupa, (C_{1-18}) alkilkarbonilgrupa, (C_{1-18}) oksikarbonilgrupa, arilkarbonilgrupa vai aril- (C_{1-3}) alkilkarbonilgrupa, kur alkilgrupa vai arilgrupa var būt mono- vai poliaizvietota ar halogēna atomu; R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} neatkarīgi cits no cita ir izvēlēti no virknes: ūdeņraža atoms, (C_{1-18}) alkilkarbonilgrupa, (C_{1-18}) oksikarbonilgrupa, arilkarbonilgrupa un aril- (C_{1-3}) alkilkarbonilgrupa, vai ir benzilgrupa vai $R^aR^bR^cSi$ grupa vai ketālgrupa vai acetālgrupa, kur katrā gadījumā divas blakus esošas R^{8a} , R^{8b} , R^{8c} , R^{8d} grupas var veidot ciklisku ketālgrupu vai acetālgrupu, vai 1,2-di- (C_{1-3}) alkoksi)-1,2-di- (C_{1-3}) alkil)etilēna tiltiņu, kur minētais etilēna tiltiņš veido aizvietotu dioksāna gredzenu kopā ar diviem skābekļa atomiem, un piranozes gredzēna saistītiem diviem oglekļa atomiem, un alkilgrupa, arilgrupa un/vai benzilgrupa var būt mono- vai poliaizvietota ar halogēna atomu vai C_{1-3} alkoksigrupu un benzilgrupa arī var būt aizvietota ar di- (C_{1-3}) alkil)amingrupu, un R^a , R^b , R^c neatkarīgi cits no cita ir C_{1-4} alkilgrupa, arilgrupa vai aril- C_{1-3} alkilgrupa, kur alkilgrupa vai arilgrupa var būt mono- vai poliaizvietotas ar halogēna atomu; kur arilgrupas minētajā definīcijā nozīmē fenilgrupu vai naftilgrupu, labāk fenilgrupu; un R^1 līdz R^5 ir, kā definētas 1. pretenzijā un jebkurā no 4. līdz 14. pretenzijai.

41. Medikaments, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 21. pretenzijai vai šā savienojuma fizioloģiski pieņemamu sāli un vismaz vienu aktīvu vielu, kas izvēlēta no pret diabēta līdzekļiem, neobligāti kopā ar vienu vai vairākiem inertiem nesējiem un/vai šķīdinātājiem.

42. Medikaments, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 21. pretenzijai vai šā savienojuma fizioloģiski pieņemamu sāli un vismaz vienu aktīvu vielu, kas izvēlēta no tirozīnfosfatāzes 1 proteīna inhibitoriem, vielām, kas ietekmē neregulētas glikozes veidošanos aknās, tādām kā, piemēram, glikozes-6-fosfatāzes vai fruktozes-1,6-bisfosfatāzes inhibitori, glikogēnfosforilāzes, glikagona receptoru antagonisti un fosfoenola piruvāta karboksikināzes, glikogēna sintāzes kināzes vai piruvāta dehidrokināzes inhibitori, lipīdu līmeni pazeminoši līdzekļi, tādi kā, piemēram, HMG-CoA-reduktāzes inhibitori, fibrāti, nikotīnskābe un tās atvasinājumi, PPAR-alfa agonisti, PPAR-delta agonisti, ACAT inhibitori vai holesterīna absorbcijas inhibitori, žultsskābi saistošas vielas, ileala žultsskābes transporta inhibitori, augsta blīvuma lipoproteīnu (ABL) veidojoši savienojumi, tādi kā holesterīnesterāzes pārnese proteīna (CETP) inhibitori vai ABC1 regulatori vai aktīvās vielas aptaukošanās ārstēšanai, tādās kā sibutramīns vai tetrahidrolipostatīns, deksfenfluramīns, aksokīns, kanabinoīda1 receptoru antagonisti, MCH-1 receptoru antagonisti, MC4 receptoru agonisti, NPY5 vai NPY2 antagonisti vai $\beta 3$ -agonisti un 5HT_{2c} receptoru agonisti, neobligāti kopā ar vienu vai vairākiem inertiem nesējiem un/vai šķīdinātājiem.

- (51) **A61K 9/127**^(2006.01) (11) **1771155**
A61K 9/00^(2006.01)
A61K 31/495^(2006.01)
A61P 37/08^(2006.01)
- (21) 05742190.1 (22) 06.05.2005
(43) 11.04.2007
(45) 21.03.2012
(31) 842433 (32) 11.05.2004 (33) US
(86) PCT/GB2005/001758 06.05.2005
(87) WO 2005/107711 17.11.2005
(73) Biolipox AB, P.O. Box 303, 751 05 Uppsala, SE
(72) PERESWETOFF-MORATH, Lena, SE
CARLSSON, Anders, SE

(74) McNeeney, Stephen Phillip, et al, Potter Clarkson LLP, Park View House, 58 The Ropewalk, Nottingham NG1 5DD, GB
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV

(54) **METODE UN KOMPOZĪCIJA RINIŅĀ ĀRSTĒŠANAI**
METHOD AND COMPOSITION FOR TREATING RHINITIS

(57) 1. Homogēna farmaceitiska kompozīcija, kas piemērota rinīta ārstēšanai, izmantojot nazālu vai okulāru ievadīšanu, kas satur ceterjonu cetirizīnu, polāra lipīda liposomu un farmaceitiski pieņemamu ūdeni saturošu nesēju, kur cetirizīna koncentrācija mainās ne vairāk kā par $\pm 50\%$, ja salīdzina koncentrācijas liposomālo struktūru iekšpusē un ārpusē.

3. Kompozīcija, kā pieteikts 1. vai 2. pretenzijā, kas papildus satur farmaceitiski pieņemamu bufervielu, kas spēj nodrošināt pH no pH 4 ($\pm 10\%$) līdz pH 8 ($\pm 10\%$).

5. Kompozīcija, kā pieteikts 3. vai 4. pretenzijā, kur buferviela ir fosfāta, citrāta vai acetāta buferviela.

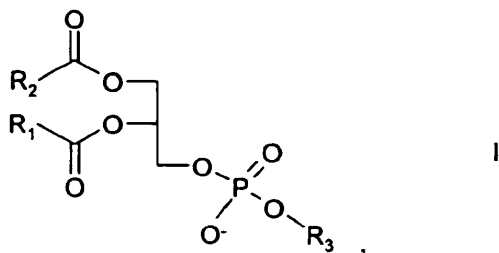
8. Kompozīcija, kā pieteikts jebkurā no iepriekšējām pretenzijām, kur cetirizīns ir sāls veidā.

9. Kompozīcija, kā pieteikts 8. pretenzijā, kur sāls ir hlorīda sāls, hidrohlorīda sāls vai nitrāta sāls.

14. Kompozīcija, kā pieteikts jebkurā no iepriekšējām pretenzijām, kur polārajam lipīdam ir dabīga izcelsme, sintētiska/pussintētiska izcelsme vai to maisījums.

15. Kompozīcija, kā pieteikts jebkurā no iepriekšējām pretenzijām, kur polārais lipīds satur vai sastāv no fosfolipīda vai fosfolipīdu maisījuma.

17. Kompozīcija, kā pieteikts 15. vai 16. pretenzijā, kur fosfolipīds ietver tādu fosfolipīdu, kas atbilst vispārējai formulai (I):



kur R_1 un R_2 neatkarīgi apzīmē piesātinātu vai nepiesātinātu, sazarotu vai taisnu alkilgrupu ar 7 līdz 23 oglekļa atomiem un R_3 apzīmē amīdu vai esteri saistošu grupu.

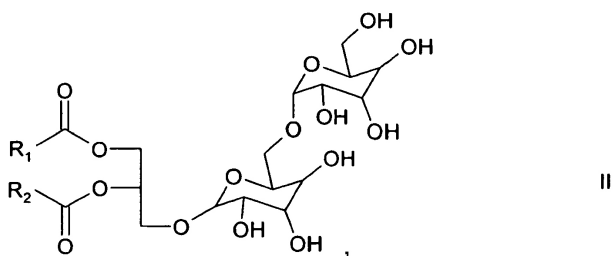
18. Kompozīcija, kā pieteikts 17. pretenzijā, kur amīdu vai esteri saistoša grupa ir $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{OH})-\text{CH}_2\text{OH}$ -grupa, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)_3$ -grupa, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}_2$ -grupa, ūdeņraža atoms vai $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{NH}_2)-\text{COOH}$ -grupa.

19. Kompozīcija, kā pieteikts jebkurā no 15. līdz 18. pretenzijai, kur fosfolipīds ietver membrānas lipīdu, kas iegūts no sojas pupas.

21. Kompozīcija, kā pieteikts jebkurā no 1. līdz 14. pretenzijai, kur polārais lipīds satur vai sastāv no glikolipīda vai glikolipīdu maisījuma.

22. Kompozīcija, kā pieteikts 21. pretenzijā, kur glikolipīds ietver glikoglicerolipīdu.

24. Kompozīcija, kā pieteikts 22. pretenzijā, kur glikoglicerolipīds ietver digalaktozilidiacilglicerīnu ar vispārējo formulu (II):



kur R_1 un R_2 ir tādas, kā definēts 17. pretenzijā.

33. Kompozīcija, kā pieteikts jebkurā no iepriekšējām pretenzijām, kas papildus satur antioksidantu, helātus veidojošu līdzekli, konservantu vai viskozitāti palielinošu līdzekli.

34. Kompozīcija, kā pieteikts 33. pretenzijā, kur antioksidants ir *alfa*-tokoferols, askorbīnskābe, butilēts hidroksianizols, butilēts

hidroksitoluols, citronskābe, fumārskābe, ābolskābe, monotioglicerīns, propionskābe, propilgalāts, nātrija askorbāts, nātrija bisulfīts, nātrija metabisulfīts, kālija metabisulfīts, nātrija sulfīts, vīnskābe un/vai vitamīns E.

35. Kompozīcija, kā pieteikts 33. pretenzijā, kur helātus veidojošais līdzeklis ir etilēndiamīntetraetiķskābe, etilēndiamīntrietīķskābe un/vai dietilēntriampentaeiķskābe.

36. Kompozīcija, kā pieteikts 33. pretenzijā, kur konservants ir benzalkonija hlorīds, benzoskābe, butilēts hidroksianizols, butilparabēns, hlorbutanols, etilparabēns, metilparabēns, propilparabēns, fenoksietanols un/vai feniletilspirts.

37. Kompozīcija, kā pieteikts 33. pretenzijā, kur viskozitāti palielinošais līdzeklis ir polietilēnglikols, šķērssašūts polivinilpirolidons un/vai hidroksipropilmetilceluloze.

38. Kompozīcija, kā pieteikts jebkurā no iepriekšējām pretenzijām, kur liposomu diametrs ir mazāks par 200 ($\pm 10\%$) nm.

39. Kompozīcija, kā pieteikts 38. pretenzijā, kur diametrs ir starp 40 ($\pm 10\%$) nm un 100 ($\pm 10\%$) nm.

40. Kompozīcijas, kā pieteikts jebkurā no iepriekšējām pretenzijām, iegūšanas paņēmiens, kurā ietilpst:

(a) polārā lipīda vai polāro lipīdu maisījuma, kas spēj uzbriest ūdens vidē, pievienošana cetirizīna ūdens šķīdumam maisot; un (b) sastāva homogenizācija.

41. Paņēmiens, kā pieteikts 40. pretenzijā, kur pirms homogenizācijas stadijas pH koriģē līdz vēlamai vērtībai, pievienojot skābi vai bāzi.

42. Paņēmiens, kā pieteikts 40. vai 41. pretenzijā, kur pirms homogenizācijas stadijas sastāvam pievieno ūdeni, fizioloģisko šķīdumu vai buferšķīdumu, iegūstot nepieciešamu beigu sērīgas tilpumu.

43. Paņēmiens, kā pieteikts 42. pretenzijā (kā atkarīgs no 41. pretenzijas), kur ūdens, fizioloģiskā šķīduma vai buferšķīduma pievienošanu veic pēc pH koriģēšanas stadijas.

44. Paņēmiens, kā pieteikts jebkurā no 40. līdz 43. pretenzijai, kur vismaz vienu šķīdumu/šķīdumu caurpūš ar slāpekli un/vai argonu.

45. Paņēmiens, kā pieteikts jebkurā no 40. līdz 44. pretenzijai, kur cetirizīna ūdens šķīdums ir iegūts, pievienojot bufervielu cetirizīna vai tā sāls ūdens šķīdumam vai pievienojot cetirizīnu vai tā sāli ūdens buferšķīdumam pirms lipīda pievienošanas.

46. Paņēmiens, kā pieteikts jebkurā no 40. līdz 45. pretenzijai, kur, ja izmanto polāro lipīdu maisījumu, to iepriekš apstrādā ar organisku šķīdinātāju.

47. Paņēmiens, kā pieteikts jebkurā no 40. līdz 46. pretenzijai, kur homogenizācijas stadija (b) ietver enerģisku mehānisku maisīšanu, liela ātruma homogenizāciju, kratīšanu, purināšanu un/vai rotāciju.

48. Paņēmiens, kā pieteikts jebkurā no 40. līdz 47. pretenzijai, kurā papildus ietilpst liposomas izmēra samazināšanas stadija.

49. Paņēmiens, kā pieteikts 48. pretenzijā, kur izmēra samazināšanas stadija ietver ekstrūziju caur membrānas filtru.

50. Paņēmiens, kā pieteikts jebkurā no 40. līdz 46., 48. vai 49. pretenzijā, kur homogenizācijas stadija un/vai izmēra samazināšanas stadija ietver augstspiediena homogenizāciju.

51. Homogēna farmaceitiska kompozīcija, kas satur ceterjonu cetirizīnu, polārā lipīda liposomu un farmaceitiski pieņemamu ūdeni saturošu nesēju, kur cetirizīns ir sadalīts visā kompozīcijā koncentrācijā ūdens vidē, kas mainās ne vairāk kā par $\pm 50\%$, ja salīdzina koncentrācijas liposomālo struktūru, kas iegūtas ar paņēmienu, kā pieteikts jebkurā no 40. līdz 50. pretenzijai, iekšpusē un ārpusē.

52. Kompozīcija, kā pieteikts jebkurā no 1. līdz 39. vai 51. pretenzijā, kuru izmanto medicīna.

53. Kompozīcijas, kā pieteikts jebkurā no 1. līdz 39. vai 51. pretenzijā, izmantošana medikamenta ražošanai rinīta ārstēšanai, kur ārstēšana ietver šīs kompozīcijas ievadīšanu personai, kas cieš no traucējuma vai ir uzņēmīga pret šo traucējumu.

54. Kompozīcija, kā pieteikts jebkurā no 1. līdz 39. vai 51. pretenzijā, kuru izmanto rinīta ārstēšanā, kur ārstēšana ietver šīs kompozīcijas ievadīšanu personai, kas cieš no traucējuma vai ir uzņēmīga pret šo traucējumu.

55. Izmantošana, kā pieteikts 53. pretenzijā, kur ievadīšana ir intranazāla.

56. Izmantošana, kā pieteikts 53. pretenzijā, kur ievadīšana ir intraokulāra.

57. Izmantošana, kā pieteikts 53. pretenzijā, kur ievadīšanu veic plaušās.

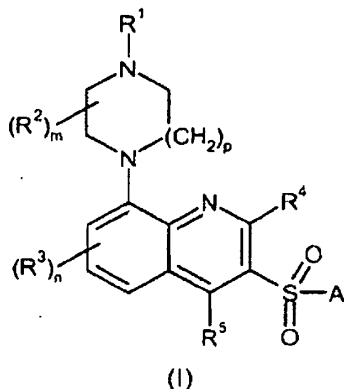
58. Kompozīcija, kā pieteikts jebkurā no 1. līdz 39. vai 51. pretenzijā, kuru izmanto ārstēšanā, kā pieteikts 54. pretenzijā, kur ievadīšana ir intranazāla.

59. Kompozīcija, kā pieteikts jebkurā no 1. līdz 39. vai 51. pretenzijā, kuru izmanto ārstēšanā, kā pieteikts 54. pretenzijā, kur ievadīšana ir intraokulāra.

60. Kompozīcija, kā pieteikts jebkurā no 1. līdz 39. vai 51. pretenzijā, kuru izmanto ārstēšanā, kā pieteikts 54. pretenzijā, kur ievadīšanu veic plaušās.

- (51) **C07D 215/40**^(2006.01) (11) **1956004**
A61K 31/47^(2006.01)
A61P 25/00^(2006.01)
C07D 487/04^(2006.01)
C07D 487/08^(2006.01)
- (21) 08157490.7 (22) 25.03.2003
(43) 13.08.2008
(45) 13.06.2012
(31) 0207289 (32) 27.03.2002 (33) GB
0225678 04.11.2002 GB
- (62) 03714889.7 / 1 497 266
(73) Glaxo Group Limited, Glaxo Wellcome House, Berkeley Avenue, Greenford, Middlesex UB6 0NN, GB
(72) AHMED, Mahmood, GB
JOHNSON, Christopher, Norbert, GB
JONES, Martin, C, GB
MACDONALD, Gregor, James, GB
MOSS, Stephen, Frederick, GB
THOMPSON, Mervyn, GB
WADE, Charles, Edward, GB
WITTY, David, GB
(74) Billson, Siân Catherine, et al, GlaxoSmithKline Corporate Intellectual Property (CN9.25.1) 980 Great West Road, Brentford, Middlesex TW8 9GS, GB
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Tīpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
(54) **HINOLĪNA ATVASINĀJUMI UN TO IZMANTOŠANA PAR 5-HT6 LIGANDIEM**
QUINOLINE DERIVATIVES AND THEIR USE AS 5-HT6 LIGANDS

(57) 1. Savienojums ar formulu (I) vai tā farmaceutiski pieņemams sāls:



kurā:

R¹ un R² neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai C₁₋₆ alkilgrupa, vai R¹ ir saistīts ar R², lai veidotu (CH₂)₂, (CH₂)₃ vai (CH₂)₄ grupu, R³, R⁴ un R⁵ neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms, ciāngrupa, -CF₃, -CF₂O, C₁₋₆ alkilgrupa, C₁₋₆ alkoksigrupa, C₁₋₆ alkanoilgrupa vai -CONR⁶R⁷,

R⁶ un R⁷ neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai C₁₋₆ alkilgrupa vai abas kopā var būt kondensētas, lai veidotu 5 līdz 7 locekļu aromātisku vai nearomātisku heterociklisku gredzenu, kas neobligāti ir pārtraukts ar O vai S atomu,

m ir vesels skaitlis no 1 līdz 4, tā, ka tad, kad m ir vesels skaitlis, kas lielāks par 1, tā vietā divas R² grupas var būt saistītas, lai veidotu CH₂, (CH₂)₂ vai (CH₂)₃ grupu,

n ir vesels skaitlis no 1 līdz 3;

p ir 1 vai 2;

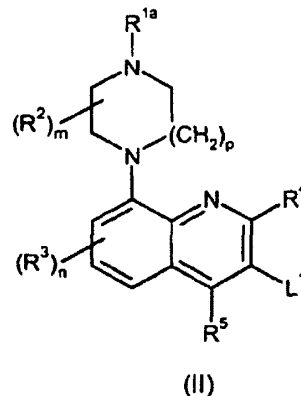
A ir -Ar¹ vai -Ar²Ar³ grupa,

Ar¹, Ar² un Ar³ neatkarīgi ir arilgrupa vai heteroarilgrupa, no kurām abas var būt neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas var būt vienādi vai atšķirīgi un kas ir izvēlētas no grupas: halogēna atoms, hidroksilgrupa, ciāngrupa, nitrogrupa, trifluometilgrupa, trifluometoksigrupa, C₁₋₆ alkilgrupa, trifluometan-sulfoniloksigrupa, pentafluoretilgrupa, C₁₋₆ alkoksigrupa, arilC₁₋₆ alkoksigrupa, C₁₋₆ alkiltiogrupa, C₁₋₆ alkoksīC₁₋₆ alkilgrupa, C₃₋₇ ciklo-alkilC₁₋₆ alkoksigrupa, C₁₋₆ alkanoilgrupa, C₁₋₆ alkoksikarbonilgrupa, C₁₋₆ alkilsulfonilgrupa, C₁₋₆ alkilsulfonilgrupa, C₁₋₆ alkilsulfoniloksigrupa, C₁₋₆ alkilsulfonilC₁₋₆ alkilgrupa, arilsulfonilgrupa, arilsulfoniloksigrupa, arilsulfonilC₁₋₆ alkilgrupa, C₁₋₆ alkilsulfonamīdgrupa, C₁₋₆ alkilamīdgrupa, C₁₋₆ alkilsulfonamīdC₁₋₆ alkilgrupa, C₁₋₆ alkilamīdC₁₋₆ alkilgrupa, arilsulfonamīdgrupa, arilkarboksamīdgrupa, arilsulfonamīdC₁₋₆ alkilgrupa, arilkarboksamīdC₁₋₆ alkilgrupa, aroilgrupa, aroilC₁₋₆ alkilgrupa, arilC₁₋₆ alkanoilgrupa vai CONR⁸R⁹ grupa, vai SO₂NR⁸R⁹ grupa, kurā R⁸ un R⁹ neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai C₁₋₆ alkilgrupa vai kopā var būt kondensētas, lai veidotu 5 līdz 7 locekļu aromātisku vai nearomātisku heterociklisku gredzenu, kas neobligāti ir pārtraukts ar O vai S atomu,

vai tā solvāts.

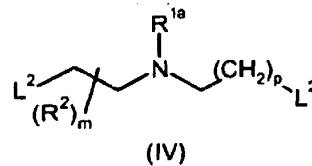
16. Savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemama sāls iegūšanas paņēmieni, kas satur:

(a) savienojuma ar formulu (II)

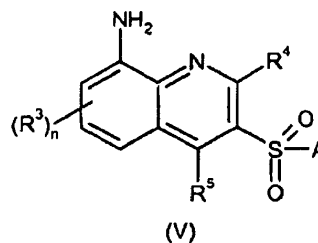


kur R^{1a} ir R¹, kā noteikts 1. pretenzijā, vai ir N-aizsarggrupa, R², R³, R⁴, R⁵, m, n un p ir, kā noteikts 1. pretenzijā, un L¹ ir aizejošā grupa, reakciju ar savienojumu ar formulu A-SO₂H, (vai A-SH, kas seko aiz nākamā oksidēšanās soļā), kur A ir, kā noteikts 1. pretenzijā, un pēc tam neobligāti R^{1a}-N-aizsarggrupas aizvākšanu, vai

(b) savienojuma ar formulu (IV)

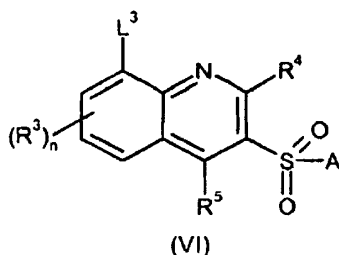


reakciju ar savienojumu ar formulu (V)

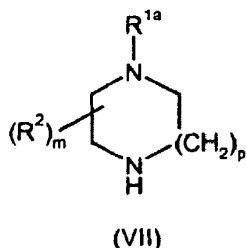


kur R², R³, R⁴, R⁵, A, m, n un p ir, kā noteikts 1. pretenzijā, un R^{1a} ir R¹, kā noteikts 1. pretenzijā, vai ir N-aizsarggrupa, un L² ir piemērota aizejošā grupa, un pēc tam neobligāti R^{1a}-N-aizsarggrupas aizvākšanu, vai

(c) savienojuma ar formulu (VI)



reakciju ar savienojumu ar formulu (VII)



kur R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , m , n , p un A ir, kā noteikts 1. pretenzijā, un R^{1a} ir R^1 , kā noteikts 1. pretenzijā, vai ir N-aizsarggrupa, un L^3 ir piemērota aizejošā grupa, un pēc tam neobligāti R^{1a} -N-aizsarggrupas aizvākšanu, vai

(d) aizsarggrupas aizvākšanu no savienojuma ar formulu (I), kas ir aizsargāta, un pēc tam neobligāti

(e) pārveidošanu par citu savienojumu ar formulu (I), un/vai farmaceitiski pieņemama sāls un/vai solvāta veidošanu.

17. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai un farmaceitiski pieņemamu nesēju vai pildvielu.

18. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai izmantošanai terapijā.

19. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai izmantošanai baiļu, depresijas, epilepsijas, uzmācīgas apsēstības traucējumu, migrēnas, kognitīvo atmiņas traucējumu, Parkinsona slimības, ADHD (uzmanības deficīta un hiperaktivitātes sindroma), miega traucējumu, ēšanas traucējumu, panikas lēkmju, ar narkotiku lietošanu saistīta autisma, šizofrēnijas, insulta, ar muguras traumu un/vai galvas ievainojumu saistītu traucējumu, kairinātu zarnu sindroma vai aptaukošanās ārstēšanai.

20. Savienojums saskaņā ar 19. pretenziju, kur kognitīvie atmiņas traucējumi ir izvēlēti no Alzheimer slimības, ar vecumu saistītas kognitīvo spēju samazināšanās un no vieglas kognitīvās funkcijas pasliktināšanās.

21. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai izmantošana depresijas, baiļu, Alzheimer slimības, ar vecumu saistītas kognitīvās disfunkcijas un uzmanības deficīta un hiperaktivitātes sindroma, aptaukošanās, vieglas kognitīvās pasliktināšanās, šizofrēnijas, ar šizofrēniju saistītas kognitīvās funkcijas pavājināšanās un insulta ārstēšanai.

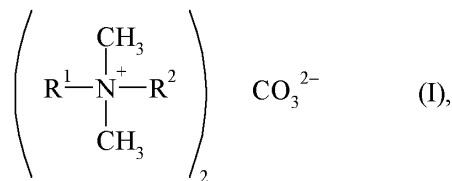
23. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemama sāls izmantošana medikamenta ražošanā, kas paredzēts baiļu, depresijas, epilepsijas, uzmācīgas apsēstības, migrēnas, kognitīvo atmiņas traucējumu, Parkinsona slimības, ADHD (uzmanības deficīta hiperaktivitātes problēmas), miega traucējumu, ēšanas traucējumu, panikas lēkmju, ar narkotiku lietošanu saistīta autisma, šizofrēnijas, insulta, ar muguras traumu un/vai galvas ievainojumu saistītu traucējumu, kairinātu zarnu sindroma vai aptaukošanās, ārstēšanai.

24. Izmantošana saskaņā ar 23. pretenziju, kur kognitīvie atmiņas traucējumi ir izvēlēti no Alzheimer slimības, ar vecumu saistītas kognitīvo spēju samazināšanās un vieglas kognitīvās funkcijas pavājināšanās.

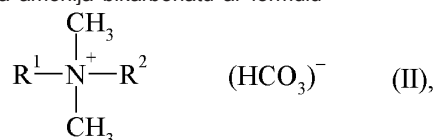
25. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemama sāls izmantošana medikamenta ražošanā, kas paredzēts depresijas, baiļu, Alzheimer slimības, ar vecumu saistītas kognitīvo spēju samazināšanās, ADHD (uzmanības deficīta un hiperaktivitātes sindroma), vieglas kognitīvās funkcijas pasliktināšanās, šizofrēnijas, ar šizofrēniju saistītas kognitīvās funkcijas pavājināšanās un insulta ārstēšanai vai profilaksei.

27. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 15. pretenzijai izmantošana medikamenta ražošanā zīdītāja centrālās nervu sistēmas neironu augšanas veicināšanai.

- (51) **C23G 5/06**^(2006.01) (11) **2039804**
C23F 11/14^(2006.01)
C09D 5/08^(2006.01)
E21B 41/02^(2006.01)
C23G 1/14^(2006.01)
- (21) 08021521.3 (22) 27.05.2004
(43) 25.03.2009
(45) 02.05.2012
(31) 474081 P (32) 28.05.2003 (33) US
(62) 04739384.8 / 1 649 079
(73) LONZA, INC., 90 Boroline Road, Allendale, NJ 07401-1613, US
(72) CHIANG, Michael Y., US
HALL, Larry K., US
KIMLER, Joseph, US
SCHEBLEIN, Joseph W., US
(74) Riegler, Norbert Hermann, et al, Lonza AG, Patentabteilung, Postfach, 4002 Basel, CH
Artis KROMANIS, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV
- (54) **CETURTĒJĀ AMONIJA KARBONĀTU UN BIKARBONĀTU IZMANTOŠANA METĀLA PAMATŅU PRETKOROZIJAS PĀRKLĀJUMOS**
USE OF QUATERNARY AMMONIUM CARBONATES AND BICARBONATES IN ANTICORROSIVE COATINGS OF METAL SUBSTRATES
- (57) 1. Pretkorozijas pārklājums metāla pamatnei, kas satur:
(a) vismaz vienu ceturrtējā amīna karbonātu ar formulu



kurā R^1 ir eventuāli arilaizvietota C_{1-20} alkilgrupa un R^2 ir eventuāli arilaizvietota C_{1-20} alkilgrupa, vai ceturrtējā amonija bikarbonātu ar formulu



kurā R^1 ir eventuāli arilaizvietota C_{1-20} alkilgrupa un R^2 ir eventuāli arilaizvietota C_{1-20} alkilgrupa, vai to maisījumu un

(b) pārklājuma materiālu, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no epoksīdsveķiem, uretāna sveķiem, vinilsveķiem, butīralsveķiem, ftalskābes sveķiem, izocianāta sveķiem, butadiēna sveķiem, lakām, pārklājumiem ar zemu gaistošo organisko savienojumu šķīdinātāju saturu uz poliuretānu bāzes un pārklājumiem uz ūdens bāzes, tādiem kā kolofonija-taukskābju-vinila emulsijas.

11. Metāla pamatne ar pretkorozijas pārklājumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai uz vismaz vienas tās virsmas.

- (51) **A61K 9/14**^(2006.01) (11) **2179724**
A61P 25/04^(2006.01)
A61K 31/485^(2006.01)
A61K 45/06^(2006.01)
- (21) 10001414.1 (22) 19.04.2004
(43) 28.04.2010
(45) 18.04.2012
(31) 464323 P (32) 21.04.2003 (33) US
(62) 04759980.8 / 1 615 615

- (73) EURO-CELTIQUE S.A., 2, avenue Charles de Gaulle, 1653 Luxembourg, LU
- (72) OSHLACK, Benjamin, US
Van BUSKIRK, Glenn, US
CHASIN, Mark, US
HUANG, Hua-Pin, US
VASHI, Vijay, US
- (74) Maiwald Patentanwalts GmbH, Elisenhof, Elisenstrasse 3, 80335 München, DE
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV
- (54) **PRET NEPAREIZU LIETOŠANU DROŠI PRODUKTI OPIOĪDU UN CITU POTENCIĀLI NEPAREIZI LIETOJAMU ZĀĻU IEVADĪŠANAI**
TAMPER-RESISTANT PRODUCTS FOR DELIVERY OF OPIOIDS AND OTHER DRUGS APT TO BE ABUSED
- (57) 1. Farmaceutiskais produkts, kas satur:
a) pirmo daudzu ekstrudētu daļiņu kopumu, kas satur matricē disperģētu nelabvēlīgas iedarbības līdzekli, un slāni, kas pārklāj vismaz daļu ekstrudēto daļiņu, pie kam matricē satur pirmo hidrofobo materiālu un slānis satur otro hidrofobo materiālu, un
b) otru daudzu farmaceutiski pieņemamu daļiņu kopumu, kas satur matricē disperģētu aktīvo vielu, pie kam matricē satur trešo hidrofobo materiālu,
pie kam neobjātā zāļu formā matricē un pirmā daudzo ekstrudēto daļiņu kopuma slānis izolē nelabvēlīgās iedarbības līdzekli.
2. Farmaceutiskais produkts saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam nelabvēlīgās iedarbības līdzekļi ir
(i) aktīvās vielas antagonists vai
(ii) citāds nelabvēlīgas iedarbības līdzeklis kā antagonists, pie kam nelabvēlīgās iedarbības līdzeklis var radīt nepatīkamu efektu, ja tas ievadīts neizolētā formā, un pie kam labāk, ja nelabvēlīgās iedarbības līdzeklis ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no vemšanu izraisošiem līdzekļiem, kairinošiem līdzekļiem un rūgtvielām.
3. Farmaceutiskais produkts saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam aktīvās vielas daļiņas un nelabvēlīgās iedarbības līdzekļa daļiņas ir līdzīgas vai praktiski neatšķiramas pēc īpašībām, kas ir izvēlētas no grupas, kas sastāv no izskata, tekstūras, smaržas, garšas, cieftības, formas, izmēra vai to kombinācijas.
4. Farmaceutiskais produkts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas ir perorāla zāļu forma.
5. Farmaceutiskais produkts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, pie kam pirmais, otrais un trešais hidrofobais materiāls ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no celulozes polimēra, akrilpolimēra un kopolimēra, metakrilskābes polimēra un kopolimēriem, šellakas, zeīna, hidroģenētas rīcinelljas, hidroģenētas augu eļļas un jebkuru iepriekš minēto materiālu maisījumiem, pie kam labāk, ja pirmais hidrofobais materiāls un otrais hidrofobais materiāls ir viens un tas pats, vai labāk, ja pirmais hidrofobais materiāls, otrais hidrofobais materiāls un trešais hidrofobais materiāls ir viens un tas pats, vai labāk, ja pirmais hidrofobais materiāls un trešais hidrofobais materiāls ir viens un tas pats, vai labāk, ja pirmais hidrofobais materiāls ir viens un tas pats, vai labāk, ja otrais hidrofobais materiāls un trešais hidrofobais materiāls ir viens un tas pats.
6. Farmaceutiskais produkts saskaņā ar 5. pretenziju, pie kam slānis satur:
(i) amonija metakrilāta kopolimēru un/vai
(ii) alkilcelulozes polimēru, labāk etilcelulozi, un/vai
(iii) akrilpolimēru un celulozes polimēru dubultslāņa sakārtojumā.
7. Farmaceutiskais produkts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, pie kam aktīvā viela ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no opioīdu agonistiem, benzodiazepīniem, barbiturātiem un centrālās nervu sistēmas stimulatoriem.
11. Farmaceutiskais produkts saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam nelabvēlīgās iedarbības līdzeklis ir aktīvās vielas antagonists un
(i) antagonista vidējās C_{max} , kas tiek nodrošināta pēc vienas devas sabojātas zāļu formas ievadīšanas pacientu populācijai, attiecība pret antagonista vidējo C_{max} , kas tiek nodrošināta pēc vienas devas neobjātās zāļu formas ievadīšanas pacientu populācijai, ir apmēram 20:1 vai lielāka, apmēram 100:1 vai lielāka, apmēram 125:1 vai lielāka, apmēram 150:1 vai lielāka vai apmēram 1000:1 vai lielāka, un/vai

(ii) antagonista vidējā AUC (laukums zem līknes „koncentrācija-laiks”), kas tiek nodrošināts pēc vienas devas sabojātas zāļu formas ievadīšanas pacientu populācijai, attiecība pret antagonista vidējo AUC, kas tiek nodrošināts pēc vienas devas neobjātās zāļu formas ievadīšanas pacientu populācijai, ir apmēram 5:1 vai lielāka, apmēram 25:1 vai lielāka, apmēram 75:1 vai lielāka, apmēram 100:1 vai lielāka, apmēram 150:1 vai lielāka, apmēram 200:1 vai lielāka vai apmēram 250:1 vai lielāka, un/vai

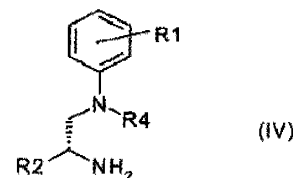
(iii) antagonista daudzuma, kas tiek atbrīvots no zāļu formas pēc tās sabojāšanas, attiecība pret antagonista daudzumu, kas tiek atbrīvots no neobjātās zāļu formas, ir apmēram 20:1 vai lielāka, apmēram 50:1 vai lielāka, apmēram 100:1 vai lielāka, apmēram 150:1 vai lielāka vai apmēram 1000:1 vai lielāka, par pamatu ņemot zāļu formas izšķīšanu pēc 1, 2, 4, 12, 24 vai 36 stundām 700 ml mākslīgās kuņģa sulas (SGF), izmantojot ASV Farmakopejas (USP) II tipa aparātu (ar lāpstiņu maisītāju) ar 50 apgr./min. 37°C grādos ar pārslēģšanos pēc 1 stundas uz 900 ml mākslīgā intestinālā šķidrums (SIF).

12. Farmaceutiskais produkts saskaņā ar 11. pretenziju, pie kam minētā sabojāšana ir saberzšana pulverī, labāk ar stampu un piestu, vislabāk ar 24 stampas grūdieniem piestā.

13. Farmaceutiskais produkts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai izmantošanai atturēšanā no aktīvās vielas ļaunprātīgas izmantošanas.

14. Farmaceutiskais produkts saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai, pie kam aktīvā viela ir opioīda agonists un farmaceutiskais produkts ir perorāla zāļu forma, izmantošanai sāpju ārstēšanā.

- (51) **C07D 401/14**^(2006.01) (11) **2233483**
C07D 403/12^(2006.01)
C07D 239/42^(2006.01)
- (21) 10163200.8 (22) 05.08.2003
(43) 29.09.2010
(45) 09.05.2012
(31) 10237722 (32) 17.08.2002 (33) DE
(62) 03793685.3 / 1 530 568
(73) Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, Brüningstrasse 50, 65926 Frankfurt am Main, DE
(72) RITZELER, Olaf, DE
JAEHNE, Gerhard, DE
(74) Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
- (54) **INDOLA VAI BENZIMIDAZOLA ATVASINĀJUMI KĀ IKBKINĀZES MODULATORI UN STARPPRODUKTI TO IEĢŪŠANĀ**
INDOLE OR BENZIMIDAZOLE DERIVATIVES AS IKBKINASE MODULATORS AND INTERMEDIATES IN THEIR PREPARATION
- (57) 1. Savienojums ar formulu (IV)



kur

R1 ir

1. ūdeņraža atoms,

2. F, Cl, J vai Br,

3. -C₁₋₄alkilgrupa,

4. -CN,

5. -CF₃,

6. -OR⁵, kur R⁵ ir ūdeņraža atoms vai -C₁₋₄alkilgrupa,

7. -N(R⁵)-R⁶, kur R⁵ un R⁶ neatkarīgi viens no otra ir ūdeņraža atoms vai -C₁₋₄alkilgrupa,

8. -C(O)-R⁵, kur R⁵ ir ūdeņraža atoms vai -C₁₋₄alkilgrupa vai

9. -S(O)_x-R⁵, kur x ir vesels skaitlis nulle, 1 vai 2 un R⁵ ir ūdeņraža atoms vai -C₁₋₄alkilgrupa,

R2 ir

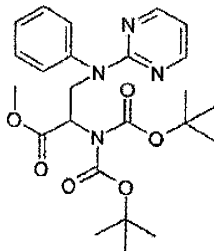
1. heteroarilgrupa no rindas: 3-hidroksipiro-2,4-diongrupa, imidazolgrupa, imidazolidīngrupa, imidazolīngrupa, indazolgrupa, izotiazolgrupa, izotiazolidīngrupa, izoksazolgrupa, 2-izoksazolidīngrupa, izoksazolidīngrupa, izoksazolongrupa, morfolīngrupa, oksazolgrupa, 1,3,4-oksadiazolgrupa, oksadiazolidīndiongrupa, oksadiazolongrupa, 1,2,3,5-oksatiadiazol-2-oksīdgrupa, 5-okso-4,5-dihidro[1,3,4]-oksadiazolgrupa, 5-okso-1,2,4-tiadiazolgrupa, piperazīngrupa, pirazīngrupa, pirazolgrupa, pirazolīngrupa, pirazolidīngrupa, piridazīngrupa, pirimidīngrupa, tetrazolgrupa, tiadiazolgrupa, tiazolgrupa, tiomorfolīngrupa, triazolgrupa vai triazolongrupa un heteroarilgrupa ir neaizvietota vai ir aizvietota vienu, divas vai trīs reizes neatkarīgi viena no otras ar

- 1.1 -C(O)-R⁵, kur R⁵ ir ūdeņraža atoms vai -C₁₋₄alkilgrupa,
- 1.2 -C₁₋₄alkilgrupu,
- 1.3 -O-R⁵, kur R⁵ ir ūdeņraža atoms vai -C₁₋₄alkilgrupa,
- 1.4 -N(R⁵)-R⁶, kur R⁵ un R⁶ neatkarīgi viens no otra ir ūdeņraža atoms vai -C₁₋₄alkilgrupa,
- 1.5 halogēna atomu vai
- 1.6 ketogrupu,
2. -C(O)-R⁵, kur R⁵ ir ūdeņraža atoms vai -C₁₋₄alkilgrupa,
3. -C(O)-OR⁵, kur R⁵ ir ūdeņraža atoms vai -C₁₋₄alkilgrupa vai
4. -C(O)-N(R⁷)-R⁸, kur R⁷ un R⁸ neatkarīgi viens no otra ir ūdeņraža atoms, -C₁₋₄alkil-OH, -O-C₁₋₄alkilgrupa vai -C₁₋₄alkilgrupa, R⁴ ir

1. heteroarilgrupa no rindas: pirolgrupa, furāngrupa, tiofēngrupa, imidazolgrupa, pirazolgrupa, oksazolgrupa, izoksazolgrupa, tiazolgrupa, izotiazolgrupa, tetrazolgrupa, 1,2,3,5-oksatiadiazol-2-oksīdgrupa, triazolongrupa, oksadiazolongrupa, izoksazolongrupa, oksadiazolidīndiongrupa, triazolgrupa, 3-hidroksipiro-2,4-diongrupa, 5-okso-1,2,4-tiadiazolgrupas, piridīngrupa, pirazīngrupa, pirimidīngrupa, indolgrupa, izoindolgrupa, indazolgrupa, ftalazīngrupa, hinolīngrupa, izohinolīngrupa, hinoksalīngrupa, hinazolīngrupa, cinnolīngrupa, β-karbolīngrupa un benzokondensēta grupa, šīs heteroarilgrupas ciklopentagrupas atvasinājumi vai cikloheksagrupas atvasinājumi, kur heteroarilgrupa ir neaizvietota vai ir aizvietota vienu, divas vai trīs reizes neatkarīgi viena no otras ar -C₁₋₅alkilgrupu, -C₁₋₅alkoksigrupu, halogēna atomu, nitrogrupu, aminogrupu, trifluometilgrupu, hidroksilgrupu, hidroksi-C₁₋₄alkilgrupu, metilēndioksigrupu, etilēndioksigrupu, formilgrupu, acetilgrupu, ciāngrupu, hidroksikarbonilgrupu, aminokarbonilgrupu vai -C₁₋₄alkoksikarbonilgrupu, vai

2. arilgrupa no rindas: fenilgrupa, naftilgrupa, 1-naftilgrupa, 2-naftilgrupa, bifenililgrupa, 2-bifenililgrupa, 3-bifenililgrupa un 4-bifenililgrupa, antrilgrupa vai fluoenilgrupa, un arilgrupa ir neaizvietota vai ir aizvietota vienu, divas vai trīs reizes neatkarīgi viena no otras ar -C₁₋₅alkilgrupu, -C₁₋₅alkoksigrupu, halogēna atomu, nitrogrupu, aminogrupu, trifluometilgrupu, hidroksilgrupu, hidroksi-C₁₋₄alkilgrupu, metilēndioksigrupu, etilēndioksigrupu, formilgrupu, acetilgrupu, ciāngrupu, hidroksikarbonilgrupu, aminokarbonilgrupu vai -C₁₋₄alkoksikarbonilgrupu.

4. Savienojums ar formulu



- | | | |
|--|---------------------|---------|
| (51) C07D 209/30 ^(2006.01) | (11) 2281815 | |
| (21) 10180348.4 | (22) 25.05.2004 | |
| (43) 09.02.2011 | | |
| (45) 04.04.2012 | | |
| (31) 0301569 | (32) 27.05.2003 | (33) SE |
| 0302305 | 27.08.2003 | SE |
| (62) 08165755.3 / 1 025 670 | | |
| 04734774.5 / 1 656 346 | | |
| (73) AstraZeneca AB, 151 85 Södertälje, SE | | |

- (72) MOHAMMED, Rukhsana, Tasneem, GB
BONNERT, Roger, Victor, GB
- (74) Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV
- (54) **4-(ACETILAMINO)-3-[(4-HLORFENIL)TIO]-2-METIL-1H-INDOL-1-ETIŅSKĀBES ETILESTERA STARPPRODUKTA SAVIENOJUMS**
4-(ACETYLAMINO)-3-[(4-CHLOROPHENYL)THIO]-2-METHYL-1H-INDOLE-1-ACETIC ACID ETHYL ESTER INTERMEDIATE COMPOUND
- (57) 1. 4-(acetilamino)-3-[(4-hlorfenil)tio]-2-metil-1H-indoletiķskābes etilestera savienojums.

- | | | |
|---|---------------------|---------|
| (51) A61F 13/00 ^(2006.01) | (11) 2305194 | |
| A61K 31/485 ^(2006.01) | | |
| A61K 9/70 ^(2006.01) | | |
| A61P 25/04 ^(2006.01) | | |
| (21) 10185240.8 | (22) 24.02.1998 | |
| (43) 06.04.2011 | | |
| (45) 09.05.2012 | | |
| (31) 38919 P | (32) 24.02.1997 | (33) US |
| 939068 | 29.09.1997 | US |
| (62) 05011213.5 / 1 570 823 | | |
| 98906678.2 / 0 964 677 | | |
| (73) EURO-CELTIQUE S.A., 2, avenue Charles de Gaulle, 1653 Luxembourg, LU | | |
| (72) REDER, Robert, F., US | | |
| GOLDENHEIM, Paul, D., US | | |
| KAIKO, Robert, F., US | | |
| (74) Hansen, Norbert, Maiwald Patentanwalts GmbH, Elisenhof, Elisenstraße 3, 80335 München, DE | | |
| Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV | | |
| (54) BUPRENORFĪNA TRANSDERMĀLS PLĀKSTERIS IZMANTOŠANAI SĀPJU ĀRSTĒŠANĀ VISMĀZ 7 DIENU ILGAM DOZĒŠANAS INTERVĀLAM
A BUPRENORPHINE TRANSDERMAL PATCH FOR USE IN THE TREATMENT OF PAIN FOR A DOSING INTERVAL OF AT LEAST 7 DAYS | | |

(57) 1. Buprenorfīna transdermālas ievadīšanas ierīce, kas satur buprenorfīnu vai tā farmaceitiski pieņemamu sāli saturošu polimēra matricē slāni, izmantošanai sāpju ārstēšanā cilvēkiem vismaz 7 dienu ilgām dozēšanas intervālam, pie kam transdermālās ievadīšanas ierīce satur 10 masas % buprenorfīna bāzes, 10 līdz 15 masas % levulīnskābes, apmēram 10 masas % oleiloleāta, 55 līdz 70 masas % poliakrilāta un 0 līdz 10 masas % polivinilpirrolidona.

2. Buprenorfīna transdermālās ievadīšanas ierīce izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam tiek sasniegtas šādas vidējās koncentrācijas plazmā:

vidējā koncentrācija plazmā no 0,3 līdz 113 pg/ml pēc apmēram 6 stundām pēc dozēšanas intervāla sākuma,
vidējā koncentrācija plazmā no 3 līdz 296 pg/ml pēc apmēram 12 stundām pēc dozēšanas intervāla sākuma,
vidējā koncentrācija plazmā no 7 līdz 644 pg/ml pēc apmēram 24 stundām pēc dozēšanas intervāla sākuma,
vidējā koncentrācija plazmā no 13 līdz 753 pg/ml pēc apmēram 36 stundām pēc dozēšanas intervāla sākuma,
vidējā koncentrācija plazmā no 16 līdz 984 pg/ml pēc apmēram 48 stundām pēc dozēšanas intervāla sākuma,
vidējā koncentrācija plazmā no 20 līdz 984 pg/ml pēc apmēram 60 stundām pēc dozēšanas intervāla sākuma,
vidējā koncentrācija plazmā no 20 līdz 1052 pg/ml pēc apmēram 72 stundām pēc dozēšanas intervāla sākuma un pēc tam vidējā koncentrācija plazmā no 19 līdz 1052 pg/ml vismaz nākošo 48 stundu laikā.

4. Buprenorfīna transdermālās ievadīšanas ierīce izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam dozēšanas intervāla laikā sasniegtie vidējie relatīvie izdalīšanās ātrumi ir šādi:

vidējais relatīvais izdalīšanās ātrums no 3 μg/stundā līdz 5 μg/stundā no dozēšanas intervāla sākuma līdz apmēram 72 stundām pēc dozēšanas intervāla sākuma un

vidējais relatīvais izdalīšanās ātrums no 0,3 µg/stundā līdz 0,6 µg/stundā no apmēram 72 stundām pēc dozēšanas intervāla sākuma līdz dozēšanas intervāla beigām.

6. Buprenorfīna transdermālās ievadīšanas ierīce izmantošanai saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam T_{max} parādās no apmēram 3 līdz apmēram 5 dienām pēc minētās transdermālās ievadīšanas ierīces uzlikšanas.

Uz Latviju attiecināto Eiropas patentu publikācijas

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

Pieteikumi sakārtoti Eiropas patentu numuru kārtībā.

- (51) **C12N 15/861⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **0833934**
C12N 5/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 96917735.1 (22) 14.06.1996
 (43) 08.04.1998
 (45) 06.10.2004
 (45) 15.08.2012 (publikācija pēc iebilduma)
- (31) 95201611 (32) 15.06.1995 (33) EP
 95201728 26.06.1995 EP
- (86) PCT/NL1996/000244 14.06.1996
 (87) WO 1997/000326 03.01.1997
- (73) Crucell Holland B.V., Archimedesweg 4, 2333 CN Leiden, NL
- (72) FALLAUX, Frits, Jacobus, NL
 HOEBEN, Robert, Cornelis, NL
 BOUT, Abraham, NL
 VALERIO, Domenico, NL
 VAN DER EB, Alex, Jan, NL
- (74) Verhage, Richard Abraham, Crucell Holland B.V., P.O. Box 2048, 2301 CA Leiden, NL
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
- (54) **Iepakošanas sistēmas cilvēka rekombinantajam adenovīrusam, kuru izmanto gēnu terapijā**
PACKAGING SYSTEMS FOR HUMAN RECOMBINANT ADENOVIRUS TO BE USED IN GENE THERAPY
- (57) 1. Kombinācija, kas satur:
 rekombinantu nukleīnskābes molekulu, kas balstīta uz adenovīrusa vai iegūta no tā, kur šai nukleīnskābes molekulai ir funkcionāls enkapsidēts signāls un vismaz viens funkcionāls invertēts termināļa atkārtojums vai tā funkcionāls fragments vai atvasinājums un iepakošanas šūna, pie tam rekombinantā nukleīnskābe un minētā iepakošanas šūna kopā satur visus elementus, kas ir nepieciešami, lai radītu rekombinantu adenovīrusa daļiņu, kas satur rekombinantu nukleīnskābes molekulu,
 bez tam rekombinantās nukleīnskābes molekulai nav pārklājušos sekvenču, kas ļauj homologai rekombinācijai novest pie kompetentu vīrusu replikācijas iepakošanas šūnā, pie tam minētās iepakošanas šūnas genoms satur adenovīrusa sekvenci, kas satur Ad5 nukleotīdus 459-3510, un kur minētā šūna ir cilvēka embrija retinoblasta (HER) šūna, cilvēka embrija nierēs (HEK) šūna vai cilvēka embrija plaušu (HEL) šūna.
10. Iepakošanas šūna, kura satur adenovīrusa DNS fragmentu, kur fragments sastāv no cilvēka adenovīrusa 5 genoma nukleotīdiem 459-3510, pie kam minētā šūna ir cilvēka embrija retinoblasta (HER) šūna, cilvēka embrija nierēs (HEK) šūna vai cilvēka embrija plaušu (HEL) šūna.
17. Iepakošanas šūna no adenovīrusa iegūto nukleīnskābes molekulu iepakošanai, kas ir nodrošināta ar vienu vai vairākām iepakošanas nukleīnskābes molekulām, kur viena vai vairākas iepakošanas nukleīnskābes molekulas minēto šūnu nodrošina ar spēju izpaust adenovīrusa gēna produktus, kuri iegūti vismaz no abiem E1A un E2A reģioniem, kur iepakošanas nukleīnskābes molekula, kas kodē E2A reģionu, mutēta tādējādi, ka vismaz viens no tās produktiem ir temperatūras jutīgs un kur minētā šūna ir cilvēka embrija retinoblasta (HER) šūna, cilvēka embrija nierēs (HEK) šūna vai cilvēka embrija plaušu (HEL) šūna.
19. Iepakošanas šūna, kas raksturīga ar to, ka tā savā genomā satur adenovīrusa sekvenci, kas satur Ad5/adenovīrusa 5 nukleotīdus 459-3510 un kur minētā šūna ir cilvēka embrija retinoblasta (HER) šūna, cilvēka embrija nierēs (HEK) šūna vai cilvēka embrija plaušu (HEL) šūna.

- (51) **A61K 9/16^(2006.01)** (11) **1399133**
A61K 38/09^(2006.01)
A61P 5/06^(2006.01)
A61P 15/00^(2006.01)
A61K 9/50^(2006.01)
- (21) 02738837.0 (22) 28.06.2002
 (43) 24.03.2004
 (45) 29.04.2009
 (45) 02.05.2012 (publikācija pēc iebilduma)
- (31) 2001199462 (32) 29.06.2001 (33) JP
 2001340980 06.11.2001 JP
- (86) PCT/JP2002/006526 28.06.2002
 (87) WO 2003/002091 09.01.2003
- (73) Takeda Pharmaceutical Company Limited, Osaka, JP
 (72) YAMAMOTO, K., JP
 YAMADA, A., JP
 HATA, Yoshio, JP
- (74) Wright, Robert Gordon McRae, Elkington and Fife LLP, Prospect House, 8 Pembroke Road, Sevenoaks, Kent TN13 1XR, GB
 Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
- (54) **ILGSTOŠAS ATBRĪVOŠANĀS KOMPOZĪCIJA, KAS SATUR PIENSKĀBES - GLIKOLSKĀBES KOPOLIMĒRU, UN PROCESS TĀS RAŽOŠANAI**
SUSTAINED-RELEASE COMPOSITION COMPRISING LACTIC ACID-GLYCOLIC ACID COPOLYMER AND PROCESS FOR PRODUCING THE SAME
- (57) 1. Ilgstošas atbrīvošanas kompozīcija, ko izvēlas no rindas, kas sastāv no mikrosfērām, mikrokapsulām un mikrodaliņām, kuras satur pienskābes un glikolskābes polimēru, ar masas vidējās molekulmasas un skaitliskās molekulmasas attiecību no 1,40 līdz 1,90, vai tās sāls, kur polimēra vidējā molekulmasa ir no 8 000 līdz 15 000, un pienskābes un glikolskābes molekulārā attiecība ir no 70:30 līdz 80:20, polimēru vai tā sāli iegūstot ar paņēmienu, kas satur ūdens pievienošanu organiskajam šķīdinātājam, kas satur pienskābes un glikolskābes polimēru ar vidējo molekulmasu no 5 000 līdz 15 000 proporcijā no 24 līdz 40 (tilpuma proporcija) pret 100 daļām organiskā šķīdinātāja, un kompozīcija satur arī fizioloģiski aktīvu vielu, kas ir peptīds ar formulu:
 $5\text{-oxo-Pro-His-Trp-Ser-Tyr-DLeu-Leu-Arg-Pro-NH-C}_2\text{H}_5$
 vai tās acetāts, un kompozīcija nesatur želatīnu.
2. Ilgstošas atbrīvošanas kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur pienskābes un glikolskābes polimēra mazas molekulmasas frakcijas ir ar molekulmasu 3 000 vai mazāk, attiecība ir 9 % vai mazāk.
5. Ilgstošas atbrīvošanas kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas paredzēta injicēšanai.
6. Ilgstošas atbrīvošanas kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas peptīdu vai tā sāli atbrīvo vismaz divu nedēļu laikā.
7. Process ilgstošas atbrīvošanas kompozīcijas saskaņā ar 1. pretenziju ražošanai, kurā šķīdinātāju atdala no maisījuma, kas satur peptīdu vai tā sāli un pienskābes un glikolskābes polimēru saskaņā ar 1. pretenziju vai tā sāli, minēto polimēru iegūstot ar paņēmienu saskaņā ar 1. pretenziju.
8. Process saskaņā ar 7. pretenziju, kurā peptīdu vai tā sāli iemaisa un disperģē organiskā šķīdinātāja šķīdumā, kas satur pienskābes un glikolskābes polimēru vai tā sāli, un atdala organisko šķīdinātāju.
9. Process saskaņā ar 8. pretenziju, kur peptīdu vai tā sāli izmanto kā tā ūdens šķīdumu.
10. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur ilgstošas atbrīvošanas kompozīciju saskaņā ar 1. pretenziju.
11. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kas ir līdzeklis prostatas vēža, prostatomegālijas, endometriozes, histeromiomas, metrofibromas, agrīnas pubertātes un dismenorejas (mēnešreižu zuduma) profilaksei vai ārstēšanai, vai kontracepcijas līdzeklis.
12. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kas ir līdzeklis krūts vēža recidīva profilaksei pēc pirmsklimaktērija krūts vēža operācijas.
13. Ilgstošas atbrīvošanas kompozīcijas saskaņā ar 1. pretenziju izmantošana, ražojot medikamentu prostatas vēža, prostatomegālijas, endometriozes, histeromiomas, metrofibromas, agrīnas

pubertātes un dismenorejas (mēnešreižu zuduma) profilaksei vai ārstēšanai, vai kā kontracepcijas līdzekli.

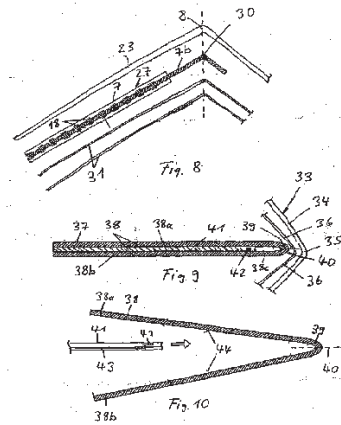
14. Ilgstošas atbrīvošanās kompozīcijas saskaņā ar 1. pretenziju izmantošana, ražojot medikamentu krūts vēža recidīva profilaksei pēc pirmsklīniskās krūts vēža operācijas.

- (51) **B42D 1/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1502765**
B42D 1/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
B42D 15/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 03405643.2 (22) 03.09.2003
(43) 02.02.2005
(45) 28.12.2005
(45) 15.08.2012 (publikācija pēc iebilduma)
(31) 13282003 (32) 30.07.2003 (33) CH
(73) Trüb AG, Hintere Bahnhofstrasse 12, CH-5001 Aarau, CH
(72) EGLI, Stefan, CH
STUTZ, Christof, CH
FANKHAUSER, Oliver, CH
HOFSTETTER, Stephan, CH
CHRISTEN, Paul, CH
(74) Groner, Manfred et al, Isler & Pedrazzini AG, Gotthardstrasse 53, Postfach 1772, 8027 Zürich, CH
Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
(54) **BUKLETS AR IDENTIFIKĀCIJAS DATU LAPU**
BOOKLET HAVING A PAGE OF PERSONALIZED DATA

(57) 1. Paņēmiens bukleta, sevišķi identifikācijas dokumenta, izgatavošanai, kur šim bukletam (1) ir vairākas lapas (31) vākos (23) un katrai lapai ir priekšējā puse un mugurpuse, un ir paredzēta vismaz viena datu lapa (2, 24-27, 37), kas ir stingri pievienota vākam (23), pie tam datu lapai (2, 24-27, 37) ir vismaz viens lokans slānis (3-7, 38) un šis lokanais slānis (3-7, 38), kas ar vienu daļu (3b, 4b, 5b, 6b, 7b) ir izvirzīts no datu nesēja (9, 11, 13, 14, 18, 41) un ar šo daļu (3b, 4b, 5b; 6b, 7b) ir pievienots pie vāka (23) un citām lapām (31), pie kam vismaz vienā daļā (3a, 4a, 5a, 6a, 7a, 38a) lokanais slānis (3-7, 38) ir apgādāts ar perforāciju (15, 17), kas kalpo par papildu savienošanas līdzekli, lai pievienotu datu nesēju (9, 11, 13, 14, 18, 41), pēc būtības nenonemami, pie lokanā slāņa (3-7, 38), un kur lokanais slānis (3-7, 38) ir tekstilmateriāls, kas raksturīgs ar to, ka lokanais slānis (3-7, 38) veido divus ārējos slāņus (38a, 38b) vai vienu iekšējo slāni, un ar to, ka lokanais slānis (3-7, 38) ir pievienots datu nesējam (8, 9, 11, 13, 14, 18, 41) ar laminācijas palīdzību, pie tam pie perforācijas (15, 17) ir izveidoti sametināšanas punkti, kas savieno lokano slāni vai lokanos slāņus, pēc būtības nenonemami, ar datu nesēju, pie tam perforācijas (15, 17) ir tekstilmateriāla tīkla caurumi.

4. Datu lapa bukletam, kas izgatavots ar paņēmienu saskaņā ar 1. pretenziju, ar lokanu slāni un datu nesēju, kur lokanajam slānim (3-7, 38) tālākajā daļā (3a, 4a, 5a, 6a, 7a, 8a) ir perforācija, kas tiek izmantota kā papildu pievienošanas līdzeklis, un kur lokanais slānis (3-7, 38) ir savienots ar datu nesēju (9, 11, 13, 14, 18, 41), pie tam lokanais slānis (3-7, 38) ir tekstilmateriāls, sevišķi, auster materiāls vai adīts materiāls, kas raksturīga ar to, ka lokanais slānis (3-7, 38) ir pievienots datu nesējam (9, 11, 13, 14) ar laminācijas palīdzību, pie tam pie perforācijas (15, 17) ir izveidoti sametināšanas punkti, kas savieno lokano slāni (3-7, 38) ar datu nesēju (9, 11, 13, 14, 18, 41), kur perforācijas (15, 17) ir tekstilmateriāla tīkla caurumi.

9. Buklets, kas izgatavots ar paņēmienu saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tam ir vismaz viena datu lapa (2, 24-27, 38) saskaņā ar 4. pretenziju, kas ir iesieta bukletā, sevišķi iesūta, ar lokano slāni (3 - 7, 38), tieši pievienotu datu nesējam (9, 11, 13, 14, 18, 41) ar laminācijas palīdzību.



Latvijā apstiprināto Eiropas patentu publikācijas

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

Publikācijas sakārtotas Eiropas patentu numuru kārtībā.

- (51) **A61L 9/12**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1645295**
H02G 3/08⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 05021860.1 (22) 05.10.2005
 (43) 12.04.2006
 (45) 18.04.2012
 (31) mi20040454 U (32) 08.10.2004 (33) IT
 (73) OIKOS S.r.l., Via Carlo Ravizza, 20, 20149 Milano, IT
 (72) BADER, Stefano, IT
 VERDERIO, Silvia, IT
 (74) Minoja, Fabrizio, Bianchetti Bracco Minoja S.r.l., Via Plinio 63, 20129 Milano, IT
 Valters GENCS, Zvērinātā advokāta Valtera Genca birojs, Kr. Valdemāra iela 21, Rīga LV-1010, LV

- (54) **KONTROLĒTAS IZLAIDES DIFUZORS TELPU DEZODORANTIEM UN/VAI SMARŽĀM, KAS IZSTRĀDĀTS, LAI UZSTĀDĪTU PIE SIENAS**
CONTROLLED-RELEASE DIFFUSER FOR ROOM DEODORANTS AND/OR PERFUMES, DESIGNED TO BE WALL-MOUNTED

(57) 1. Kontrolētas izlaides difuzors dezodorantiem un/vai smaržām, kurš ir konstruēts telpām, pie kam difuzors ietver patronu (1), kas konstruēta, lai uzņemtu dezodorējošā un/vai smaržojošā produkta pastilas (2), pie kam: iepriekš minētajai patronai (1) ir gaisa ieplūdes sistēma (3) un gaisa izplūdes sistēma (4); difuzors papildus ietver karkasu (5) ar slēgtām sānu sienām, kas ir izveidots, lai tajā ievietotu iepriekš minēto patronu (1), un ar atbalsta pamatni (8) tā apakšā; iepriekš minētā pamatne (8) ir aprīkota ar ventilatoru (9), kas ir konstruēts, lai virzītu gaisu uz patronā esošo produktu un tad telpā,

kas raksturīgs ar to, ka iepriekš minētais karkass (5) papildus ietver atloku (6), kurš ir integrāls ar iepriekš minēto karkasu (5) un ir aprīkots ar sistēmām, kas izveidotas, lai ļautu to piestiprināt pie sienas uzstādāmai standarta elektroinstalācijai.

2. Difuzors saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tas uz sienas saskarē ar telpu ietver centrālo atveri sasmaržotā gaisa emitēšanai telpā un tam ir viena vai vairākas sānu atveres (14) gaisa ievadīšanai sasmaržotā produkta virzienā un tad tālāk telpā.

3. Difuzors saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka iepriekš minētajam atlokam (6) ir sānu atveres (14) gaisa iesūkšanai, lai to virzītu uz sasmaržoto produktu.

4. Difuzors saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka iepriekš minētā karkasa pamatne (8) ir aprīkota ar elektronisko karti, uz kuras ir uzmontētas elektroniskas ierīces, kas konstruētas, lai varētu veikt ierīces vietējo vai attālināto vadību un kontroli.

5. Difuzors saskaņā ar iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka tas ietver ventilatora aktivēšanas pogu (12).

6. Difuzors saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tas ietver apgaismošanas līdzekļus (13), kas izstrādāti, lai parādītu ventilatora darbību.

7. Difuzors saskaņā ar iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka tas ietver līdzekļus pievienošanai pie vadības ierīces, lai ļautu programmēt iekārtas darbību.

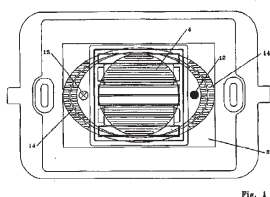


Fig. 1

- (51) **H02G 3/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1675231**
H02G 3/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 05110827.2 (22) 16.11.2005
 (43) 28.06.2006
 (45) 02.05.2012
 (31) 202004019942 U (32) 24.12.2004 (33) DE
 (73) OBO Bettermann GmbH & Co. KG, Hüingser Ring 52, 58710 Menden, DE
 (72) JORDAN, Ernst-Günther, DE
 GUTT, Wolfgang, DE
 SCHAUERTE, Arno, DE
 WESCH, Reiner, DE
 (74) Haverkamp, Jens, Patentanwalt, Stefanstraße 2 Kirchhoffgebäude, 58638 Iserlohn, DE
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
 (54) **KABEĻA BALSTIERĪCE**
CABLE SUPPORT DEVICE

(57) 1. Kabeļa balstierīce (1), kas ir izgatavota no metāla, ar diviem sānu šķēršiem (2, 3; 18, 18'), kuri veido ap kabeļa noturošo daļu (5), un ar pamatelementu (4), kas savieno sānu šķēršus (2, 3), pie kam minētā kabeļa balstierīce (1, 15, 31) tās galos satur savienojošo sekciju (6, 7; 16, 22; 30, 33), lai savienotu kabeļa balstierīci (1, 15, 31) ar nākamo kabeļa balstierīci (1', 15', 31') ar vienu vai vairāku mehānisko savienošanas elementu (11, 12; 19, 20, 21; 36, 37) un vismaz vienas savienotājdaļas (8, 9; 17; 32) palīdzību,

kas raksturīga ar to, ka savienojošā sekcija (6, 7; 16, 22; 30, 33) ir izveidota ar sānu šķēršu (2, 3; 18, 18') un pamatelementa (4) atlocīšanu, pie kam minētais atlocījums pagarina vai saīsinā kabeļa noturošās daļas (5) šķēsgriezuma zonu, un līdz ar to kabeļa balstierīce (1, 15, 31) ar vienu tās pārsedzošos galu bez instrumentiem vai skrūvēm var tikt piestiprināta pie nākošās kabeļa balstierīces (1', 15', 31') savienojošās sekcijas (6, 7; 16, 22; 30, 33) ar papildu mehānisko savienošanas elementu (10, 10'; 23, 24, 25; 37, 38) palīdzību, lai veidotu kabeļa nesošo sistēmu; pie kam kabeļa balstierīces (1, 15, 31) savienojošo sekciju (6, 7; 16, 22; 30, 33) zonā konkrēta tās daļa satur vienu vai vairākas elektriskā spraudņa savienotājdaļas (8, 9; 17; 32), kas var tikt saslēgtas kopā ar kabeļa nākošās balstierīces (1', 15', 31') savienojošās sekcijas (7', 22, 33) papildu spraudkontakta savienotājdaļām (13, 14; 26; 34, 35), lai veidotu vienu vai vairākus spraudkontakta savienotājus, kas elektriski savieno abas kabeļa balstierīces (1, 1'; 15, 15'; 31, 31') ar pastāvīgi noteiktu elektrisku kontaktvirsmu un noteiktu kontaktpiedienu, pie tam elektriskā spraudkontakta savienotājdaļas, lai veidotu elektrisko spraudkontakta savienotāju, ir aprīkotas ar plakānu savienotāju (8, 9; 17; 32) un plakānu savienotājkontaktlīdzdi, tādu kā spraudkontaktsavienojums un, kad divas kabeļa balstierīces (1, 1') tiek savienotas kopā, divas papildu spraudkontakta savienotājdaļas (8, 9; 17; 32) veido elektrisku spraudkontaktsavienojumu.

2. Kabeļa balstierīce saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka kabeļa balstierīces (1, 1'; 15, 15'; 31, 31') abos to galos satur savienojošo sekciju (6, 7; 16, 22; 30, 33) ar papildu mehāniskiem savienošanas elementiem (11, 12; 19, 20, 21, 23, 24, 25; 36, 37, 38, 39) un papildu elektrisku spraudkontakta savienotājdaļām (8, 9, 13, 14; 17, 26; 34, 35).

3. Kabeļa balstierīce saskaņā ar 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka spraudkontakta savienotājdaļas (8, 9, 13, 14; 17; 32), kas ir kabeļa balstierīces daļas, ir izgatavotas no lokšņu metāla.

4. Kabeļa balstierīce saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka plakāna savienotājkontaktlīdzdi ir izveidota ar divām atverēm, kas ir pārveidotas par spraudkontakta savienotājiem (13, 14; 34, 35), kuri ir izvietoti paralēli un atstāts viens no otra, pie kam maksimālais attālums starp abiem spraudkontakta savienotājiem būtībā atbilst plakāna savienotāja (8, 9; 32) platumam.

5. Kabeļa balstierīce saskaņā ar 4. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka kontaktvirsmi (13, 14; 34, 35) ir elastīga materiāla īpašības, kā rezultātā divas saistītas spraudkontaktsavienotājdaļas (8, 9, 13, 14; 32, 34, 35) piekļaujas viena otrai ar noteiktu spiedienu.

6. Kabeļa balstierīce saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka, lai salāgotu divu saistītu spraudkontaktsavienotājdaļu kontaktpiedienu, ir paredzēts skavai līdzīgs

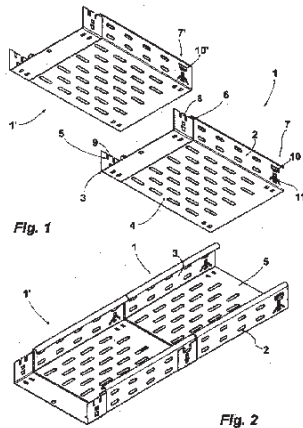
atsperu elements (26), kas atrodas kabeļa balstierīces (15') savienojošā sekcijā (22).

7. Kabeļa balstierīce saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka spraudkontakta savienotāja daļas (8, 9, 13, 14) arī kalpo, lai divas saistītas kabeļa balstierīces (1, 1') mehāniski nostiprinātu virzienā, kas ir perpendikulārs kontaktspiediena pielikšanas virzienam.

8. Kabeļa balstierīce saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka kabeļa balstierīces (1, 1'; 15, 15'; 31, 31') viena savienojošā sekcija (6, 16, 30) ir izveidota ar nelielu sānu šķēršu (2, 3; 18, 18') un pamatelementa (4) atlocīšanu, pie kam minētais atlocījums pagarina iekšējo telpu, kamēr otra savienojošā sekcija (7, 7'; 22; 33) nav atlocīta.

9. Kabeļa balstierīce saskaņā ar 8. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka papildu mehāniskie savienošanas elementi (11, 12; 19, 20, 21, 23, 24; 36, 37, 38, 39) un papildu elektrisko spraudkontakta savienotājdaļas (8, 9, 10, 10'; 17, 26; 32, 34, 35) divās savienojamo kabeļa balstierīču (1, 1'; 15, 15'; 31, 31') savienojošajās sekcijās (6, 7, 7'; 16, 22; 30, 33) ir izvietotas tādā veidā, ka divas kabeļa balstierīces (1, 1'; 15, 15'; 31, 31') var tikt iespiestas viena otrā un var tikt viena ar otru transversāli savienotas to longitudinālā pagarinājuma virzienā.

10. Kabeļa balstierīce saskaņā ar 9. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka kabeļa balstierīču (1, 1'; 15, 15'; 31, 31') mehāniskajiem savienošanas elementiem ir padziļinājumi (12; 19, 20, 21; 36, 37) un atšķirīgi izciļņi, stienīši (11; 23, 24; 38) vai tamlīdzīgi.



- (51) **A61K 9/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1787658**
A61K 38/31⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 47/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 47/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 47/24⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

- (21) 05077559.2 (22) 10.11.2005
(43) 23.05.2007
(45) 14.03.2012

- (73) CHEMI S.p.A., Via dei Lavoratori, 54, 20092 Cinisello Balsamo (Milano), IT
(72) Mascagni, Paolo, IT
(74) Fiammenghi-Domenighetti, Delfina, Fiammenghi-Fiammenghi, Via San Gottardo 15, 6900 Lugano, CH
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV

(54) **AUGŠANAS HORMONA SOMATOSTATĪNA ANALOGU INHIBITORU ILGSTOŠAS ATBRĪVOŠANĀS SASTĀVI SUSTAINED RELEASE FORMULATIONS OF SOMATOSTATIN ANALOGUE INHIBITORS OF GROWTH HORMONE**

(57) 1. Farmaceutiskais sastāvs lipīdu šķīduma veidā, kas būtībā satur vismaz vienu augšanas hormona atbrīvošanās somatostatīna analogu inhibitoru, (C₁-C₈)spirtu, fosfolipīdu un taukskābju (C₁-C₄)alkilesteri.

2. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju atšķiras ar to, ka augšanas hormona atbrīvošanās somatostatīna analogs inhibitors ir daudzums no 0,1 līdz 10 masas %, taukskābju (C₁-C₄)alkilesteris ir daudzums no 10 līdz 80 masas %, (C₁-C₈)spirts ir daudzums no 1 līdz 20 masas % un fosfolipīds ir daudzums no 5 līdz 50 masas %.

(C₁-C₈)spirts ir daudzums no 1 līdz 20 masas % un fosfolipīds ir daudzums no 5 līdz 50 masas %.

3. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām atšķiras ar to, ka augšanas hormona atbrīvošanās somatostatīna analogs inhibitors ir daudzums no 1 līdz 4 masas %, vislabāk no 1 līdz 3 masas %.

4. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām atšķiras ar to, ka taukskābju (C₁-C₄)alkilesteris ir daudzums no 20 līdz 70 masas %, vislabāk no 40 līdz 65 masas %.

5. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām atšķiras ar to, ka (C₁-C₈)spirts ir daudzums no 5 līdz 10 masas %, vislabāk aptuveni 7 masas %.

6. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām atšķiras ar to, ka fosfolipīds ir daudzums no 10 līdz 40 masas %, vislabāk no 20 līdz 30 masas %.

7. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 6. pretenzijai atšķiras ar to, ka augšanas hormona atbrīvošanās somatostatīna analogā inhibitora, taukskābju (C₁-C₄)alkilesterā, (C₁-C₈)spirta un fosfolipīda summa ir līdz 100 %.

8. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām atšķiras ar to, ka augšanas hormona atbrīvošanās somatostatīna analogu inhibitors ir izvēlēts no somatostatīna, oktreotīda, lanreotīda, vaprofīda, pazireotīda, PTR-3173, BIM-23268 un to farmaceutiski pieņemamiem sāļiem, vislabāk acetāta.

9. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām atšķiras ar to, ka (C₁-C₈)spirts ir (C₁-C₄)spirts.

10. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām atšķiras ar to, ka (C₁-C₈)spirts ir etanols.

11. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām atšķiras ar to, ka fosfolipīds ir lecitīns, vislabāk sojas lecitīns.

12. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām atšķiras ar to, ka fosfolipīdu iegūst ar sintētisku vai pussintētisku ķīmisku paņēmieni un taukskābes glicerīna 1. un 2. pozīcijā ir piesātinātas vai nepiesātinātas.

13. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām atšķiras ar to, ka taukskābju (C₁-C₄)alkilesteris ir izvēlēts no izopropilmiristāta, etilmiristāta, etilpalmitāta, etilsteāra, etiloleāta, miglikola, sezameļļas un oleīnskābes, sezameļļas un glicerilmonostearāta, izopropilpalmitāta, *tert*-butilmiristāta.

14. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām atšķiras ar to, ka taukskābju (C₁-C₄)alkilesteris ir (C₁-C₄)alkilmiristāts.

15. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām atšķiras ar to, ka taukskābju (C₁-C₄)alkilesteris ir izopropilmiristāts.

16. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām raksturīgs ar to, ka tas ir caurspīdīgs šķīdums.

17. Komplekts farmaceutiskā sastāva saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām ektemporālai pagatavošanai, kurā ietilpst pirmais flakons, kas satur augšanas hormona atbrīvošanās somatostatīna analogu inhibitoru, un otrais flakons, kas satur lipīdu šķīdumu, kas būtībā sastāv no (C₁-C₈)spirta, fosfolipīda un taukskābju (C₁-C₄)alkilesterā.

18. Komplekts saskaņā ar 17. pretenziju, kas satur no 10 līdz 60 mg augšanas hormona atbrīvošanās somatostatīna analogu inhibitoru, vislabāk no 20 līdz 40 mg.

19. Komplekts saskaņā ar 17. vai 18. pretenziju atšķiras ar to, ka augšanas hormona atbrīvošanās somatostatīna analogs inhibitors ir liofilizētā veidā.

20. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 16. pretenzijai, kuru izmanto terapeitiskā ārstēšanā, kas ietver augšanas hormona somatostatīna analogu inhibitoru ilgstošu atbrīvošanu, izmantojot minētās kompozīcijas vienreizēju ievadīšanu zem ādas vai intramuskulāri vismaz vienu reizi katrās 20 dienās, vislabāk 35 dienās.

21. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar 20. pretenziju atšķiras ar to, ka minētās kompozīcijas vienreizēju ievadīšanu zem ādas vai intramuskulāri veic vismaz vienu reizi katrās 40 dienās, vislabāk 49 dienās.

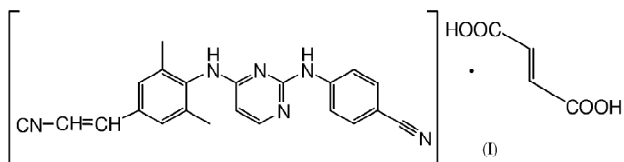
22. Farmaceutiskais sastāvs saskaņā ar 20. vai 21. pretenziju atšķiras ar to, ka ievada no 10 līdz 100 mg/ml augšanas hormona atbrīvošanās somatostatīna analogu inhibitoru.

23. Farmaceitiskais sastāvs saskaņā ar 22. pretenziju atšķiras ar to, ka ievada no 10 līdz 60 mg/ml augšanas hormona atbrīvošanās somatostatīna analogu inhibitoru.

24. Farmaceitiskais sastāvs saskaņā ar 23. pretenziju atšķiras ar to, ka ievada vienu devu, kas satur no 20 līdz 40 mg/ml augšanas hormona atbrīvošanās somatostatīna analogu inhibitoru.

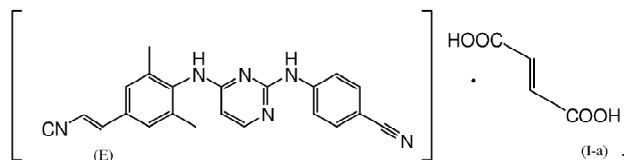
- (51) **A61P 31/18**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1789139**
A61K 31/505⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 9/20⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 05779369.7 (22) 02.09.2005
(43) 30.05.2007
(45) 21.03.2012
(31) 0403578 (32) 02.09.2004 (33) MY
PCT/EP2004/052028 03.09.2004 WO
05101447 25.02.2005 EP
- (86) PCT/EP2005/054341 02.09.2005
(87) WO2006/024667 09.03.2006
(73) Janssen Pharmaceutica NV, Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, BE
(72) STEVENS, Paul Theodoor, Janssen Pharmaceutica N.V., BE
PEETERS, Jozef, Janssen Pharmaceutica N.V., BE
VANDECRUYS, Roger P., Janssen Pharmaceutica N.V., BE
STAPPERS, Alfred E., Janssen Pharmaceutica N.V., BE
COPMANS, Alex Herman, Janssen Pharmaceutica N.V., BE
(74) UEXKÜLL & STOLBERG, Patentanwälte, Beselerstraße 4, 22607 Hamburg, DE
Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV
- (54) **4-[[4-[[4-(2-CIĀNETENIL)-2,6-DIMETILFENIL]AMINO]-2-PIRIMIDINIL]AMINO]BENZONITRILA FUMARĀTS**
FUMARATE OF 4-[[4-[[4-(2-CYANOETHENYL)-2,6-DIMETHYLPHENYL]AMINO]-2-PYRIMIDINYL]AMINO]BENZONITRILE

(57) 1. Cieta farmaceutiska kompozīcija perorālai ievadīšanai, kas satur farmaceutiski pieņemamu nesēju un kā aktīvu ingredientu savienojuma ar formulu (I) terapeitiski efektīvu daudzumu:



tā N-oksīdu vai stereoķīmiski izomēru formu un papildus satur mitrinātāju.

2. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur savienojums ar formulu (I) ir savienojums ar formulu (I-a):



3. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur mitrinātājs ir *Tween*.

4. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas satur ingredientus (pēc masas), rēķinot uz kompozīcijas kopējo masu:

- (a) no 5 līdz 50 % aktīva ingredientā;
- (b) no 0,01 līdz 5 % mitrinātāja;
- (c) no 40 līdz 92 % atšķaidītāja;
- (d) no 0,1 līdz 5 % slīdvielas.

5. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur kompozīcija ir tabletes formā.

6. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, kas ir plīvi apvalkotā formā.

7. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, kas satur sekojošo kompozīciju (pēc masas), rēķinot uz tabletes serdes kopējo masu:

- (a) no 5 līdz 50 % aktīva ingredientā;
- (b) no 0,01 līdz 5 % mitrinātāja;
- (c) no 40 līdz 92 % atšķaidītāja;
- (d) no 0 līdz 10 % polimēra;
- (e) no 2 līdz 10 % dezintegranta;
- (f) no 0,1 līdz 5 % slīdvielas;
- (g) no 0,1 līdz 1,5 % smērvielas.

8. Farmaceutiskas kompozīcijas saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām izmantošana medikamenta ražošanā, kas paredzēts HIV infekcijas ārstēšanai vai novēršanai.

- (51) **H02G 3/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1798828**
H02G 3/18⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 06025062.8 (22) 05.12.2006
(43) 20.06.2007
(45) 25.04.2012
(31) 202005019587 U (32) 15.12.2005 (33) DE
(73) Tehalit GmbH, Seebergstrasse 37, 67716 Heltersberg, DE
(72) ARNOLD, Hans- Joachim, DE
(74) Patentanwälte Bitterich, Dr. Keller, Schwertfeger, Westring 17, 76829 Landau, DE
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
- (54) **BRĪVI STĀVOŠA PASTATNE, KAS PAREDZĒTA ELEKTROENERĢIJAS PIEGĀDEI DARBA VIETĀM**
FREE-STANDING COLUMN FOR FEEDING WORKPLACES

(57) 1. Brīvi stāvoša pastatne, kas ir paredzēta elektroenerģijas un/vai informācijas piegādei darba vietām un kas satur: dobu profilu (1), pamatni (10) un kabeļa pozicionēšanas kanālu (20), kas raksturīga ar to, ka

- gala atbalsta paplāksne (2) ir piestiprināta dobā profila (1) galā, kas vērsts uz pamatnes pusi,
- gala atbalsta paplāksnei (2) ir atvere (3),
- pamatnei (10) ir tapa (11), kas iekļaujas atverē (3),
- tapai (11) ir transversāla atvere (12),
- transversālajā atverē (12) ievietojas ķīlis (15), kas nostiprina dobo profilu (1) un gala atbalsta paplāksni (2) uz pamatnes (10).

2. Pastatne saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka atverei (3) un tapai (11) ir poligonāls šķērsriezums.

3. Pastatne saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tapa (11) ir nedaudz koniska.

4. Pastatne saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tapa (11) ir piestiprināta pie pamatnes (10).

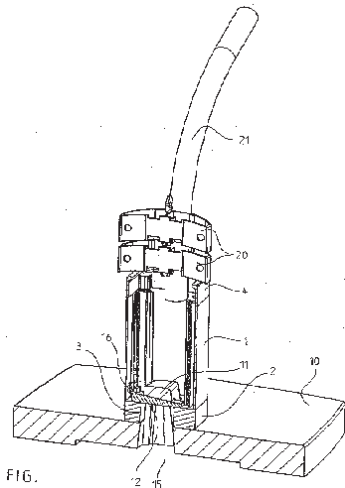
5. Pastatne saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka ķīlim (15) ir galva (16).

6. Pastatne saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka pamatne (10) ir izgatavota no metāllējuma.

7. Pastatne saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka pamatne (10) ir izgatavota no pelēkā čuguna.

8. Paņēmiens elektroenerģijas un/vai informācijas piegādei darba vietām, kas satur pastatnes novietošanu, kurai ir dobs profils (1), pamatne (10) un kabeļa pozicionēšanas kanāls (20) dobā profila (1) galā, kas vērsts uz pamatnes pusi, pie kam: gala atbalsta paplāksnei (2) ir atvere (3); pamatnei (10) ir tapa (11), kas iekļaujas atverē (3); tapai (11) ir transversāla atvere (12); transversālajā atverē (12) ievietojas ķīlis (15), kas dobo profilu (1) un gala atbalsta paplāksni (2) piestiprina pie pamatnes (10).

9. Paņēmiens saskaņā ar 8. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka pastatne satur papildu pazīmes saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 7. pretenzijai.



- (51) **A23G 9/26⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **1806973**
A23G 7/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 05796304.3 (22) 21.10.2005
 (43) 18.07.2007
 (45) 18.04.2012
 (31) 200401611 (32) 21.10.2004 (33) DK
 642802 P 11.01.2005 US
 (86) PCT/DK2005/000682 21.10.2005
 (87) WO2006/042556 27.04.2006
 (73) Gram Equipment A/S, Aage Grams Vej 1, 6500 Vojens, DK
 (72) HAGEMEISTER, Jørgen, Juel, DK
 MØRCH, Ole, Christian, DK
 (74) Nielsen, Leif, Patrade A/S, Fredens Torv 3A, 8000 Aarhus C, DK
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
 (54) **IERĪCE KOCIŅU PADEVEI APARĀTĀ, KAS PAREDZĒTS KOCIŅU IEVIETOŠANAI SALDĒJUMA IZSTRĀDĀJUMOS**
DEVICE FOR CONVEYING STICKS IN AN APPARATUS FOR INSERTING STICKS INTO ICE CREAM BODIES

(57) 1. Ierīce kociņu padevei aparātā, kas paredzēts kociņu ievietošanai saldējuma izstrādājumos, pie kam: minētā ierīce satur vadošas palīgierīces, kurā kociņi tiek ievietoti iegarenas kociņu paketes veidā un no kuras vadošajām palīgierīcēm kociņi pa vienam tiek izņemti; minētā ierīce papildus satur transportiera lenti; minētie kociņi tiek ievietoti formās uz minētās transportiera lentes, kas virzās garām vadošo palīgierīču izejas atverei, kas raksturīga ar to, ka minētā transportiera lente satur lielu skaitu formu un katrai formai ir garena virsma viena kociņa daļas ievietošanai, turklāt katrai formai ir vismaz divas vadošas adatiņas, kas izvirsās uz augšu minētās garenās virsmas katrā pusē, un transportiera lentes virzienā priekšējo vadošo adatiņu augstums ir mazāks nekā aizmugurējo vadošo adatiņu augstums.

2. Ierīce saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam vadošās adatiņas vismaz garenās virsmas vienā pusē ir izvietotas gar katru formas garenās virsmas galu.

3. Ierīce saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam transportiera lentes virzienā aizmugurējo vadošo adatiņu augstums ir vienāds vai augstāks nekā kociņa augstums, kad tas ir ievietots formā.

4. Ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam formas ir piestiprinātas pie lentes ar stiprināšanas līdzekļiem.

5. Ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam formas uz lentes ir izvietotas ar atstarpēm.

6. Ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam virsējā vadošā plāksne ir novietota uz vadošajām palīgierīcēm.

7. Ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam vismaz viena apakšējā vadošā plāksne ir novietota zem vadošajām palīgierīcēm, lai no vadošajām palīgierīcēm uztvertu vienu kociņu, un ir izveidota tādā veidā, lai padotu minēto vienu kociņu uz formu, kas virzās garām vadošo palīgierīču izejai.

8. Ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam transportiera lente ir bezgalu lentes veidā.

9. Transportiera lente kociņu padevei aparātā, kas paredzēta kociņu ievietošanai saldējuma izstrādājumos, pie kam kociņu pakete tiek ievietota vadošajā palīgierīcē, no kuras kociņi pa vienam tiek izņemti un tiek ievietoti formās uz minētās transportiera lentes, kas virzās garām vadošās palīgierīcēs izejas atverei,

kas raksturīga ar to, ka: minētā transportiera lente satur lielu skaitu formu; katrai formai ir garena virsma viena kociņa daļas ievietošanai, pie kam katrai formai ir vismaz divas vadošas adatiņas, kas izvirsās uz augšu minētās garenās virsmas katrā pusē un transportiera lentes virzienā priekšējo vadošo adatiņu augstums ir mazāks nekā aizmugurējo vadošo adatiņu augstums.

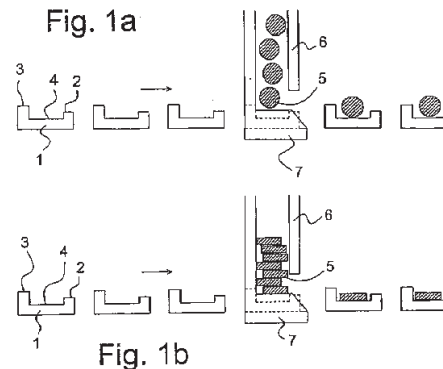
10. Transportiera lente saskaņā ar 9. pretenziju, pie kam vadošās adatiņas vismaz garenās virsmas vienā pusē ir izvietotas gar katru formas garenās virsmas galu.

11. Transportiera lente saskaņā ar 9. vai 10. pretenziju, pie kam transportiera lentes virzienā aizmugurējo vadošo adatiņu augstums ir vienāds ar vai lielāks par kociņa augstumu, kad tas ir ievietots formā.

12. Transportiera lente saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 11. pretenzijai, pie kam formas ir piestiprinātas pie lentes ar stiprināšanas līdzekļiem.

13. Transportiera lente saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 12. pretenzijai, pie kam formas uz lentes ir izvietotas ar atstarpēm.

14. Ierīce saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 13. pretenzijai, pie kam transportiera lente ir bezgalu lentes veidā.



- (51) **C07D 498/22⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **1812448**
 (21) 05803350.7 (22) 03.11.2005
 (43) 01.08.2007
 (45) 23.05.2012
 (31) 625343 P (32) 05.11.2004 (33) US
 642131 P 07.01.2005 US
 (86) PCT/EP2005/011789 03.11.2005
 (87) WO2006/048296 11.05.2006
 (73) Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH
 Novartis Pharma GmbH, Brunner Strasse 59, 1230 Wien, AT
 (72) HOEHN, Pascale, FR
 KOCH, Bernd, FR
 MUTZ, Michael, DE
 (74) Crawley, Patrick Edward, et al, Novartis AG Corporate Intellectual Property, 4002 Basel, CH
 Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
 (54) **ORGANISKIE SAVIENOJUMI**
ORGANIC COMPOUNDS

(57) 1. Savienojums, kas ir N-benzoil-staurosporīna kristāliskā forma II ar rentgenifraktogrammu, kurā, izteicot leņķos 2 θ, ir pieci vai vairāki maksimumi, kurus izvēlas no rindas, kas sastāv no aptuveni 3,4; 6,0; 7,8; 8,7; 9,2; 9,7; 10,1; 10,4; 11,2; 12,6; 14,1; 15,7; 16,8; 18,2; 18,9; 19,3; 19,6; 20,2 un 24,5 ± 0,2 grādi.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar būtiski to pašu rentgenifraktogrammu, kura ir minēta 1. pretenzijā.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas paliek sauss pie 95 % relatīvā mitruma un 25°C.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kuram ir infrasarkanās absorbcijas spektrs ar absorbcijas joslām pie aptuveni 789, 773, 743, 704, 1066, 1026, 1458, 1398, 1383, 1602, 1577, 1497, 1627, 1680, 2934 un 3055 $\text{cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$.
5. Kompozīcija, kas satur N-benzoil-staurosporīnu cietas vielas veidā, kur vismaz 80 masas % no minētā N-benzoil-staurosporīna ir kristāliskā forma II saskaņā ar 1. pretenziju.
6. Kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, kur vismaz 90 masas % no minētā N-benzoil-staurosporīna ir kristāliskā forma II.
7. Kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, kur vismaz 95 masas % no minētā N-benzoil-staurosporīna ir kristāliskā forma II.
8. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur:
 (a) savienojumu saskaņā ar 1. pretenziju; un
 (b) farmaceutiski pieņemamu nesēju vai atšķaidītāju.
9. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 8. pretenziju, kas satur arī vienu vai vairākas farmaceutiski pieņemamas pildvielas.
10. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 8. pretenziju, kas ir tādā gatavā zāļu formā, kura ir piemērota orālai lietošanai.
11. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kur minēto gatavo zāļu formu izvēlas no tabletes, kapsulas vai šķīduma.
12. N-benzoil-staurosporīns saskaņā ar 1. līdz 8. pretenziju, kas izmantojams audzēju slimības ārstēšanai.
13. Process N-benzoil-staurosporīna kristāliskās formas II pagatavošanai, kas satur:
 (a) N-benzoil-staurosporīna šķīduma pagatavošanu šķīdinātājā;
 (b) otrā šķīdinātāja pievienošanu šim šķīdumam, iegūstot nogulsnes; un
 (c) nogulšņu atdalīšanu; kur šķīdinātāju izvēlas no benzilspirta, DMF, DMSO, etiķskābes vai PEG; un kur otro šķīdinātāju izvēlas no etanola, THF vai etanola šķīduma ūdenī.
14. Process saskaņā ar 13. pretenziju, kurā ietilpst arī atdalīto nogulšņu žāvēšana.
15. Savienojums, kas ir N-benzoil-staurosporīna kristāliskā forma II, ko iegūst procesā saskaņā ar 13. pretenziju.
16. Process N-benzoil-staurosporīna kristāliskās formas II saskaņā ar 1. pretenziju iegūšanai, kas satur:
 (a) staurosporīna reakciju ar benzoscābes anhidrīdu, veidojot šķīdumu;
 (b) N-benzoil-staurosporīna kristālisko formu iedīgļus saturošā šķīduma uzsēšanu;
 (c) otrā šķīdinātāja pievienošanu; un
 (d) produkta atdalīšanu; kur otro šķīdinātāju izvēlas no etanola vai etanola šķīduma ūdenī.
17. Savienojums, kas ir N-benzoil-staurosporīna kristāliskā forma II, ko iegūst procesā saskaņā ar 16. pretenziju.

RECIRCULATING VERTICAL WIND TUNNEL SKYDIVING SIMULATOR AND REDUCED DRAG CABLE FOR USE IN WIND TUNNELS AND OTHER LOCATIONS

- (57) 1. Izpletņlēkšanas simulatora (1) vertikāls vēja tunelis, kas satur: recirkulācijas gaisa plūsmas kameru; vertikālu vēja tuneļa lidošanas kameru (10); ventilatoru mezglu (3), kas nodrošina gaisa plūsmu cilvēkam lidojumam vertikālajā lidošanas kamerā, kas raksturīgs ar to, ka:
 - minētās gaisa plūsmas kameras viena daļa papildus satur diverģentas sienas, lai paplašinātu un palēninātu gaisa plūsmu,
 - minētās gaisa plūsmas kamera papildus satur temperatūras regulatoru;
 - minētais temperatūras regulators papildus satur ieklūdes žālūzijas (120), kas ir uzstādītas apmēram pretī izplūdes žālūzījām (260) gaisa plūsmas kameras kopējā segmentā,
 - minētajām izplūdes žālūzījām ir durvis, kas gaisa plūsmas telpas kopējā segmentā vērstas uz iekšpusi un pret straumi, bet minētās ieklūdes žālūzijas gaisa plūsmas telpas kopējā segmentā ir vērstas uz iekšpusi un pa straumi,
 - durvis veido gaisa plūsmas telpas kopējā segmenta iekšēju sašaurinājumu, tādējādi veidojot pazemināta statiskā spiediena zonu, kas gaisu ieviekl ieklūdes žālūzījās.
2. Simulator saskaņā ar 1. pretenziju, kurā ventilatoru mezgls (3) satur divus blakus izvietotus ventilatorus (40, 41).
3. Simulator saskaņā ar 2. pretenziju, kurā ventilatori (40, 41) ir orientēti nedaudz atvērīti viens no otra attiecībā pret centrālo līniju starp tiem un kurā ventilatoru (40, 41) plaknes (P41, P42) ir noliekta pa straumi un ar centrālo līniju veido šauru leņķi (P43).
4. Simulator saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā katrs ventilatoru mezgla (3) ventilators (40, 41) ir ievietots ventilatoru apvalkā (1300), kas darbojas kā difuzors.
5. Simulator saskaņā ar 3. vai 4. pretenziju, kurā ventilatori ir izkārtoti pakāpienveidīgi, lai samazinātu attālumu starp ventilatoru radītajiem gaisa plūsmas stabiem.
6. Simulator saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka lidošanas kamera (10, 1503, 1701, 2202) ir izvietota ventilatoru mezgla (3) gaisa ieklūdes pusē.
7. Simulator saskaņā ar 6. pretenziju, kurā ventilatoru mezgls (3) ir uzstādīts horizontāli parasti taisnstūra formas gaisa plūsmas kameras augšējā elementā (30).
8. Simulator saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka augšējā elementa atpakaļplūsmas kanālam (30), pirmajam vertikālajam sānu elementam un gaisa plūsmas kameras atpakaļplūsmas kanāla (5) otrajam vertikālajam sānu elementam katram ir diverģents sienas segments, lai paplašinātu recirkulējošo gaisu plūsmu, vienlaikus saglabājot viscaur lamināru gaisa plūsmu.
9. Simulator saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kurā gaisa plūsmas kameras apakšējās daļas elementam (7) ir paplašināmas sienas.
10. Simulator saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka katrs mezgla (3) ventilators ar tā izplūdes pusi ir savienots ar lielu skaitu paplašināmos atpakaļplūsmas gaisa vadu (3, 5, 7), kuriem seko ieklūdes kontraktors (9), kurš ir izvietots tieši lidojuma kameras (10, 1503, 1701, 2202) priekšā.

(51)	B64D 23/00 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ A01K 73/02 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ A63G 31/00 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾	(11)	1819592	
(21)	05803928.0	(22)	01.08.2005	
(43)	22.08.2007			
(45)	04.04.2012			
(31)	909088	(32)	30.07.2004	(33) US
	184940		19.07.2005	US
(86)	PCT/US2005/027750		01.08.2005	
(87)	WO2006/012647		02.02.2006	
(73)	Skyventure International Ltd., Suite 13, Caves Professional Center, Nassau, BS			
(72)	METNI, N. Alan, US KITCHEN, William, J., US MORT, Kenneth, W., US EASTLAKE, Charles, N., US PALMER, Michael, J., US			
(74)	Haverkamp, Jens, Patentanwalt, Stefanstraße 2, Kirchhoffgebäude, 58638 Iserlohn, DE Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV			
(54)	IZPLETŅLĒKŠANAS SIMULATORA VERTIKĀLAIS VĒJA TUNELIS UN SAMAZINĀTAS PRETESTĪBAS TROSE, KAS PAREDZĒTA IZMANTOŠANAI VĒJA TUNĒĻOS UN CITUR			

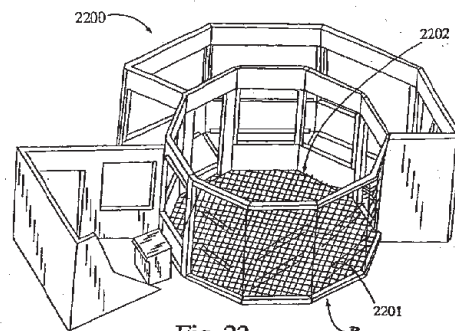
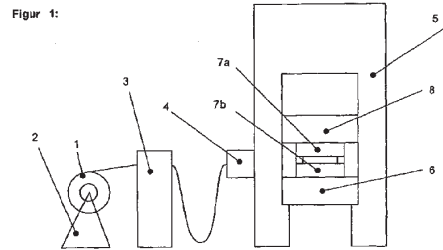


Fig. 22

- (51) **H02K 15/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **1833145**
H02K 1/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 07004626.3 (22) 07.03.2007
 (43) 12.09.2007
 (45) 16.05.2012
 (31) 06075582 (32) 10.03.2006 (33) EP
 (73) Kienle + Spiess GmbH, Bahnhofstrasse 23, 74343 Sachsenheim, DE
 (72) BLOCHER, Daniel, DE
 BAUER, Steffen, DE
 (74) Jackisch-Kohl, Anna-Katharina, Patentanwälte Jackisch-Kohl & Kohl, Stuttgarter Strasse 115, 70469 Stuttgart, DE
 Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV



(54) **PAŅĒMIENS, SPIEDVEIDNE UN IERĪCE LAMEĻU PAKĒTES IZGATAVOŠANAI, UN LAMEĻU PAKĒTE METHOD, TOOL AND DEVICE FOR PRODUCING A STACK OF LAMINATIONS AND STACK OF LAMINATIONS**

(57) 1. Paņēmiens regulējama augstuma lameļu pakešu izgatavošanai spiedveidnē (7a, 7b), ar kuras palīdzību tiek štancētas lameles (24), uz kurām tiek uzklāta saistviela, kuras tiek salīmētas kopā, lai izveidotu lameļu paketi (27), pie kam saistvielu uzklāj daļēji un bezkontakta veidā uz lameļu (24) augšējās un/vai apakšējās puses,

kas raksturīgs ar to, ka: saistvielu uzklāj ar uzklāšanas sistēmu, kas sastāv no uzklāšanas ierīces (12) un uzklāšanas ierīces (12) vadības ierīces (11), pie tam uzklāšanas ierīce (12) sastāv vismaz no vienas uzklāšanas galviņas (14), kas darbojas bezkontakta režīmā, un regulējama vārsta; izmanto vairākas saistvielas uzklāšanas sistēmas uz vairākiem pielipšanas punktiem (16); katrā preses gājienā uzklāšanas sistēmas vadības ierīcei (11) tiek nosūtīts viens vadības signāls; pielipšanas punktu (16) skaits uz viena izstrādājuma daļas tiek mainīts, lai mainītu paketes izturību.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka saistviela tiek uzklāta ar sistēmu, kas balstās uz pjezotehnoloģiju.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka izejmateriāls (1) ir nepārtraukta loksne, ko ievada presē satītā veidā.

4. Paņēmiens saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka izejmateriālu (1) ievada atsevišķu metāla lokšņu veidā.

5. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka paketes (27) radīšanas laikā lameles (24) tiek pagrieztas, lai veidotu spirālveida paketes ar jebkuru izvēlēto slīpuma leņķi.

6. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tiek strādāts ar dažādas kvalitātes, biežuma, īpašību un pārklājuma materiāliem.

7. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka dažādas kvalitātes, biežuma, īpašību un pārklājuma materiāli tiek savienoti kopā tai pašā paketē.

8. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka saistviela tiek uzklāta uz jēlmateriāla, kuru nav paredzēts izmantot lamelēm, lai atvieglotu šāda pārpalikuma aizvākšanu no spiedveidnes.

9. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka spiedveidnē (7a, 7b), detaļu noņēmējā vai matricēs plāksnē (20) tiek izveidoti nelieli padziņinājumi (21), kurus aizpilda uzklātā saistviela.

10. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka lameļu paketes (27) montāžas telpā (30) tiek iemontēts bremsēšanas mehānisms (23).

11. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka saistvielas uzklāšana tiek periodiski pārtraukta, un montāžas telpā (30) kopā tiek savienotas dažāda augstuma paketes (27).

12. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, kas atšķiras ar to, ka saistvielas uzklāšana tiek pārtraukta pēc iekšēja signāla vai signāla, kas nāk no ārpusē.

- (51) **H04W 28/16⁽²⁰⁰⁹⁰¹⁾** (11) **1834499**
H04W 4/00⁽²⁰⁰⁹⁰¹⁾
 (21) 05822023.7 (22) 21.12.2005
 (43) 19.09.2007
 (45) 25.04.2012
 (31) 0403221 (32) 30.12.2004 (33) SE
 (86) PCT/SE2005/001995 21.12.2005
 (87) WO2006/071179 06.07.2006
 (73) TeliaSonera AB, 7751 Kingspointe Parkway, Suite 126, S-106 63 Stockholm, SE
 (72) LJUNG, Rickard, SE
 DAHL N, Anders, SE
 (74) Holmberg, Magnus, Groth & Co KB, Box 6107, 102 32 Stockholm, SE
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
 (54) **PAKALPOJUMA PIEKĻUVES KONTROLES PAŅĒMIENS UN SISTĒMA DALĪTĀ PIEKĻUVES TĪKLĀ METHOD AND SYSTEM FOR SERVICE ACCESS CONTROL IN SHARED NETWORKS**

(57) 1. Radiopiekļuves tīkla (RAN) koplietošanas paņēmiens vienā vai vairākās zonās ar vismaz diviem operatoriem, kurā ar pieejas kontroles algoritmu tiek noteikts, piešķirt vai nepiešķirt lietotājam (UE) piekļuvi RAN, pie kam: radiopiekļuves tīkla kontroleris (RNC) nolasa tīkla resursu identifikatora (NRI) informāciju; minētā nolāsītā NRI informācija tiek izmantota pakalpojuma pieejas vadībai, lai pārbaudītu daudzos pakalpojuma piekļuves parametrus kā pieejas kontroles parametru kompleksa daļu un lai piešķirtu vai atteiktu pieprasīto pakalpojumu atkarībā no tā, vai ar NRI saistītais operators ir vai nav veicis ieguldījumu nepieciešamajā tehnoloģijā; minētā NRI informācija ir ietverta UE nosūtītajā "sākotnējā tiesās pārsūtīšanas" ziņojumā, pieprasot pakalpojumu, un tiek novirzīta datu plūsma, lai, izmantojot apkalpojošā radiopiekļuves tīkla kontroleri (SRNC), koriģētu pamattīklu (CN),

kas raksturīgs ar to, ka pakalpojuma pieejas kontrole tiek veikta ar SRNC, un ar to, ka SRNC lietotāja (UE) pieprasījumu nosūta radiotīkla drifta controllerim (DRNC) vienīgi tad, ja pakalpojuma pieejas kontrole pieņem pieprasījumu, pie kam DRNC ir izveidots, lai informētu SRNC par vēlmi uzstādīt vai modificēt radiodatu nesēju, un tad SRNC īsteno pakalpojuma pieejas kontroli un atļauj pieprasīto uzstādīšanu vai modificēšanu ar DRNC, ja to ir atļāvis pakalpojuma pieejas kontrole.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka minētie daudzie pakalpojuma piekļuves parametri satur darbības un pārvaldības (O&M) parametrus, ko ir noteikusi universālā mobilo telesakaru sistēma (UMTS), zemes radiopiekļuves tīkls (UTRAN), atbalstošais uzņēmums vai ir noteicis tīkla izveidotājs.

3. Paņēmiens saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam minētā tīkla koplietošana tiek īstenota kā trešās paaudzes sadarbības projektā (3GPP) standartizētā 6. versija, kas raksturīgs ar to, ka minētie daudzie pakalpojuma piekļuves parametri satur: ātrdarbīgas lejupejas pakešpiekļuves (HSDPA) A-operatoru = Patiess/Nepatiess, HSDPA B-operatoru = Patiess/Nepatiess; ātrdarbīgas lejupsaites pakešpiekļuves (HSUPA) A-operatoru = Patiess/Nepatiess, HSUPA B-operatoru = Patiess/Nepatiess; multivides apraides/multivides pakalpojumu (MBMS) A-operatoru = Patiess/Nepatiess, MBMS B-operatoru = Patiess/Nepatiess un/vai balss pārraides ar interneta protokolu (VoIP) A-operatoru = Patiess/Nepatiess, VoIP B-operatoru = Patiess/Nepatiess.

4. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka informāciju par operatoru radiopiekluves tīkla kontrolleris (RNC) kartē uz operatora vesela skaitļa identifikācijas numura.

5. Paņēmiens saskaņā ar 4. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka jauna radionesēja resursu pieprasījuma gadījumā operatora informācija tiek piegādāta pieejas kontrolei un tiek īstenota pieprasījuma pakalpojuma kvalitātes (QoS) pieejas kontrole, pie kam, ja pieprasījumu pieņem abi pieejas kontroles dienesti, pakalpojuma pieejas kontrole balstās uz operatora informāciju, kas nosūtīta, atbildot uz katru pieprasījumu par radionesēja maiņu, vai uz operatora informāciju par radionesēju, kas glabājas kopā ar nesēja identifikācijas numuru.

6. Paņēmiens saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka atļauja pieprasītajai radionesēja maiņai tiek pārbaudīta pakalpojuma pieejas kontrolē no pakalpojuma izredžu viedokļa.

7. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka minētā mezgla kontrolējošā radiopiekluves tīkla kontrolleris (CRNC) īsteno piekluves un pārslogojuma kontroli īpaša mezgla elementos.

8. Radiopiekluves tīkls (RAN), kas ir piemērots koplietošanai vienā vai vairākās zonās ar vismaz diviem operatoriem un kas satur: pieejas kontroles līdzekļus, lai noteiktu, vai lietotājam (UE) piešķirt vai nepiešķirt piekļuvi RAN; radiopiekluves tīkla kontrolleri (RNC), kas ir piemērots tīkla resursu identifikatora (NRI) informācijas nolasīšanai un minētās nolasītās NRI informācijas nosūtīšanai uz minētajiem pieejas kontroles līdzekļiem, lai pārbaudītu daudzus pakalpojuma piekluves parametrus kā pieejas kontroles parametru kompleksa daļu un lai piešķirtu vai atteiktu pieprasīto pakalpojumu atkarībā no tā, vai ar NRI saistītais operators ir vai nav veicis ieguldījumu nepieciešamajā tehnoloģijā, pie kam minētā NRI informācija ir ietverta UE nosūtītajā "sākotnējā tiešās pārsūtīšanas" ziņojumā, pieprasot pakalpojumu, un tiek novirzīta datu plūsma, lai, izmantojot apkalpojošā radiopiekluves tīkla kontrolleri (SRNC), koriģētu pamattīklu (CN),

kas raksturīgs ar to, ka SRNC ir izveidots, lai īstenotu pakalpojuma piekluves kontroli, un ar to, ka SRNC ir piemērots, lai UE pieprasījumu nosūtītu radiopiekluves tīkla drifta kontrollerim (DRNC) vienīgi tad, ja pakalpojuma pieejas kontrole pieņem pieprasījumu, kā arī ar to, ka DRNC ir izveidots, lai informētu SRNC par vēlmi uzstādīt vai modificēt radionesēju, un ar to, ka SRNC ir izveidots, lai īstenotu pakalpojuma pieejas kontroli un atļautu pieprasīto uzstādīšanu vai modificēšanu ar DRNC, ja to ir atļāvuši pakalpojuma pieejas kontrole.

9. Tīkls saskaņā ar 8. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka minētie daudzie pakalpojuma piekluves parametri satur darbības un pārvaldības (O&M) parametrus, ko noteikusi universālā mobilo telesakaru sistēma (UMTS), zemes radiopiekluves tīkls (UTRAN), atbalstošais uzņēmums vai noteicis tīkla izveidotājs.

10. Tīkls saskaņā ar 9. pretenziju, pie kam minētā tīkla koplietošana tiek īstenota kā trešās paaudzes sadarbības projektā (3GPP) standartizētā 6. versija, kas raksturīgs ar to, ka minētie daudzie pakalpojuma piekluves parametri satur: ātrdarbīgas lejupsaistes pakešpiekluves (HSDPA) A-operatoru = Patiess/Nepatiess, HSDPA B-operatoru = Patiess/Nepatiess; ātrdarbīgas lejupsaistes pakešpiekluves (HSUPA) A-operatoru = Patiess/Nepatiess, HSUP B-operatoru = Patiess/Nepatiess; multivides apraides/multiraides pakalpojumu (MBMS) A-operatoru = Patiess/Nepatiess, MBMS B-operatoru = Patiess/Nepatiess un/vai balss pārraides ar interneta protokolu (VoIP) A-operatoru = Patiess/Nepatiess, VoIP B-operatoru = Patiess/Nepatiess.

11. Tīkls saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 10. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka radiopiekluves tīkla kontrolleris (RNC) ir izveidots, lai informāciju par operatoru kartētu uz operatora vesela skaitļa identifikācijas numura.

12. Tīkls saskaņā ar 11. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka jauna radionesēja resursu pieprasījuma gadījumā minētie pieejas kontroles līdzekļi ir piemēroti operatora informācijas saņemšanai un pieprasījuma pieejas kontroles un pakalpojuma kvalitātes (QoS) pieejas kontroles īstenošanai, pie kam, ja pieprasījumu pieņem abi pieejas kontroles dienesti, pakalpojuma pieejas kontrole balstās uz operatora informāciju, kas nosūtīta, atbildot uz katru pieprasījumu par radionesēja maiņu, vai uz operatora informāciju par radionesēju, kas glabājas kopā ar nesēja identifikācijas numuru.

13. Tīkls saskaņā ar 12. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka pieejas kontroles līdzekļi ir piemēroti, lai pārbaudītu atļauja pieprasītajai radionesēja maiņai minētajā pakalpojuma pieejas vadībā atkarībā no pakalpojuma izredžu viedokļa.

14. Tīkls saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 13. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka īpaši mezgla kontrolējošā radiopiekluves tīkla kontrolleris (CRNC) ir izveidots, lai šā mezgla elementos kontrolētu minētā mezgla piekļuvi un pārslogojumu.

15. Tīkls saskaņā ar jebkuru no 8. līdz 14. pretenzijai, kurā savienojumā starp UE un pamattīklu (CN) ir iesaistīts vairāk nekā viens RNC, kas raksturīgs ar to, ka katrs RNC ir vai nu apkalpojošā radiopiekluves tīkla kontrolleris (SRNC), vai radiopiekluves tīkla drifta kontrolleris (DRNC).

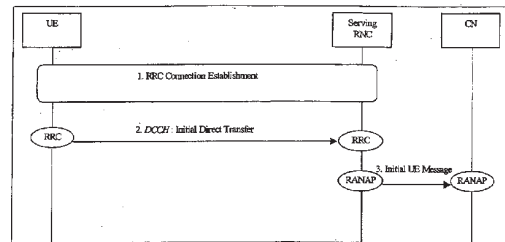


Fig. 1

(51) C07K 16/28 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾	(11) 1851250	
A61P 13/08 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾		
(21) 06735489.4	(22) 17.02.2006	
(43) 07.11.2007		
(45) 06.06.2012		
(31) 654125 P	(32) 18.02.2005	(33) US
720499 P	26.09.2005	US
748417 P	08.12.2005	US
(86) PCT/US2006/005852	17.02.2006	
(87) WO2006/089230	24.08.2006	
(73) Medarex, Inc., Route 206 & Province Line Road, Princeton, NJ 08543-4000, US		
(72) HUANG, Haichun, US		
KING, David, John, US		
PAN, Chin, US		
CARDARELLI, Josephine, M., US		
(74) Woods, Geoffrey Corlett, J A Kemp, 14 South Square, Gray's Inn, London WC1R 5JJ, GB		
Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV		
(54) CILVĒKA MONOKLONĀLA ANTIVIELA PROSTATAS SPECIFISKAM MEMBRĀNAS ANTIGĒNAM (PSMA) HUMAN MONOCLONAL ANTIBODY TO PROSTATE SPECIFIC MEMBRANE ANTIGEN (PSMA)		
(57) 1. Izdalīta cilvēka monoklonāla anti viela vai antigēnu saistoša tās daļa, kas specifiski saista prostatas specifisko membrānas antigēnu (PSMA), kas ietver: smagās ķēdes variablo rajonu CDR1, kas ietver SEQ ID Nr. 10, smagās ķēdes variablo rajonu CDR2, kas ietver SEQ ID Nr. 14, smagās ķēdes variablo rajonu CDR3, kas ietver SEQ ID Nr. 18, vieglās ķēdes variablo rajonu CDR1, kas ietver SEQ ID Nr. 22, vieglās ķēdes variablo rajonu CDR2, kas ietver SEQ ID Nr. 26 un vieglās ķēdes variablo rajonu CDR3, kas ietver SEQ ID Nr. 30.		
2. Anti viela vai antigēnu saistoša tās daļa saskaņā ar 1. pretenziju, kura ietver smagās ķēdes variablo rajonu, kas satur aminoskābes sekvenci SEQ ID Nr. 2, un vieglās ķēdes variablo rajonu, kas satur aminoskābes sekvenci SEQ ID Nr. 6.		
3. Imūnkonjugāts, kas ietver anti vielu vai antigēnu saistošo tās daļu saskaņā ar 2. pretenziju, kas savienots ar terapeitisku līdzekli.		
4. Imūnkonjugāts saskaņā ar 3. pretenziju, kur terapeitiskais līdzeklis ir citotoksīns vai radioaktīvs izotops.		
5. Bispecifiska molekula, kas ietver anti vielu vai antigēnu saistošo tās daļu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas savienota		

ar otru funkcionālo daļu, kurai ir citāds saistīšanas specifiskums nekā minētajai antivielai vai antigēnu saistošajai tās daļai.

6. Kompozīcija, kas ietver antivielu vai antigēnu saistošo tās daļu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, imūnkonjugātu saskaņā ar 3. vai 4. pretenziju vai bispecifisko molekulu saskaņā ar 5. pretenziju un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

7. Izdalīta nukleīnskābes molekula, kas kodē antivielu vai antigēnu saistošo tās daļu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju.

8. Ekspresijas vektors, kas ietver nukleīnskābes molekulu saskaņā ar 7. pretenziju.

9. Saimniekšūna, kas ietver ekspresijas vektoru saskaņā ar 8. pretenziju.

10. Transgēna pele, kas ietver cilvēka imūnglobulīna smagās un vieglās ķēdes transgēnus, kur pele ekspresē antivielu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju.

11. Hibridoma, kas iegūta no peles saskaņā ar 10. pretenziju, kur hibridoma producē minēto antivielu.

12. Antivielā vai antigēnu saistošā tās daļa saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai audzēja augšanas inhibēšanas paņēmienā pacientam, kur audzēja šūnas vai vaskulāras endotēlija šūnas audzēja tuvumā ekspresē PSMA.

13. Antivielā vai antigēnu saistošā tās daļa saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai kombinācijā ar pretaudzēja līdzekli audzēja augšanas inhibēšanas vai aizkavēšanas paņēmienā pacientam, kur audzēja šūnas vai vaskulāras endotēlija šūnas audzēja tuvumā ekspresē PSMA.

14. Antivielā vai antigēnu saistošā tās daļa izmantošanai saskaņā ar 13. pretenziju, kur anti-PSMA antivielas vai antigēnu saistošās tās daļas kombinācijā ar minēto pretaudzēja līdzekli ievadīšana minētajam pacientam noved līdz sinerģētiskam efektam uz minētā audzēja augšanas inhibēšanu.

15. Antivielā vai antigēnu saistošā tās daļa izmantošanai saskaņā ar 13. pretenziju, kur minētais pretaudzēja līdzeklis izraisa bojājumu audzēja masā, tādējādi novedot līdz iedarbīgai antivielas atkarīgai šūnu pastarpinātai audzēja citotoksitātei (ADCC).

16. Antivielā vai antigēnu saistošā tās daļa izmantošanai saskaņā ar jebkuru no 12. līdz 15. pretenzijai, kur audzējs ir vēzis, izvēlēts no prostatas, resnās zarnas, taisnās zarnas, urotēlija, krūšu dziedzera, urīnpūšļa, aknu, aizkuņģa dziedzera vēža un melanomas.

17. Antivielā izmantošanai saskaņā ar 13. pretenziju, kur pretaudzēja līdzeklis ir ķīmiski-terapeitisks līdzeklis, antiangiogēniskais līdzeklis vai imūnmodulators līdzeklis.

18. Antivielā izmantošanai saskaņā ar 17. pretenziju, kur ķīmiski-terapeitiskais līdzeklis ir Taksotere® (docetaksels), minētais antiangiogēniskais līdzeklis ir izvēlēts no angiostatīna K1-3, arestēna, aaAT, kanstatīna, DL- α -difluormetil-orniīna, endostatīna, fumagilīna, genisteīna, minociklīna, staurosporīna, talidomīda un tumstatīna vai minētais imūnmodulatorais līdzeklis ir izvēlēts no anti-PD1 antivielām, anti-CTLA-4 antivielām, fosforotilolāta oligodezoksiribonukleotīda (1018 ISS), GM-CSF gēna vakcīnas, interleikīna-2, interleikīna-7 (CYT 99 07), interleikīna-12 un interleikīna-21.

19. Antivielā vai antigēnu saistošā tās daļa saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai kombinācijā ar pretaudzēja līdzekli ar audzēju saistītas kaheksijas inhibēšanas paņēmienā pacientā vai no antivielas atkarīgas šūnu pastarpinātas audzēja citotoksitātes (ADCC) pacientā stimulēšanas paņēmienā, kur audzēja šūnas vai vaskulāras endotēlija šūnas audzēja tuvumā ekspresē PSMA.

20. Kompozīcija, kas ietver antivielu vai antigēnu saistošo tās daļu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju un pretaudzēja līdzekli izmantošanai audzēja augšanas inhibēšanas vai aizkavēšanas vai no antivielas atkarīgas šūnu pastarpinātas audzēja citotoksitātes (ADCC) stimulēšanas paņēmienā.

21. *In vitro* paņēmieni, lai identificētu pretaudzēja līdzekli, kas spēj sinerģiski iedarboties ar antivielu vai antigēnu saistošo tās daļu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju audzēja augšanas inhibēšanā vai aizkavēšanā, kur audzēja šūnas vai vaskulāras endotēlija šūnas audzēja tuvumā ekspresē PSMA, kas ietver: indikatora kompozīcijas kontaktēšanu ar:

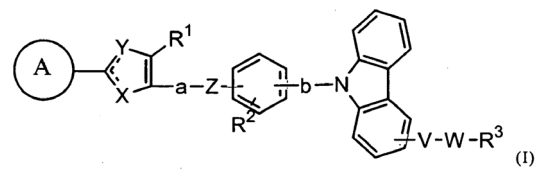
- (a) vienīgi testa pretaudzēja līdzekli,
- (b) vienīgi anti-PSMA antivielu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju un

(c) gan testa pretaudzēja līdzekli, gan anti-PSMA antivielu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju; un

(a) vienīgi testa pretaudzēja līdzekļa un (b) vienīgi anti-PSMA antivielas spējas inhibēt vai aizkavēt audzēja augšanu salīdzināšanu ar (c) gan testa pretaudzēja līdzekļa, gan anti-PSMA antivielas spēju inhibēt vai aizkavēt audzēja augšanu, kur audzēja augšanas inhibēšana vai aizkavēšana ar (c) daudzumā, kas ir lielāks par (a) un (b) kopējo efektu, novestu līdz pretaudzēja līdzekļa, kas spēj sinerģiski iedarboties ar anti-PSMA antivielu audzēja augšanas inhibēšanā vai aizkavēšanā, identificēšanai.

22. Paņēmieni saskaņā ar 21. pretenziju, kur indikatora kompozīcija ir dzīvnieka paraugs audzējam.

- (51) **C07D 413/12**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1852433**
C07D 413/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 417/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/422⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/427⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/4439⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 1/16⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 3/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 3/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 3/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 9/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 05799893.2 (22) 28.10.2005
- (43) 07.11.2007
- (45) 23.11.2011
- (31) 2004316872 (32) 29.10.2004 (33) JP
- (86) PCT/JP2005/020250 28.10.2005
- (87) WO2006/046779 04.05.2006
- (73) ZERIA PHARMACEUTICAL CO., LTD., 10-11, Nihonbashi Kobuna-cho, Chuo-ku, Tokyo 103-8351, JP
- (72) MURATA, Masakazu, JP
 ITOKAZU, Yoshihiko, JP
 NAKAO, Ryu, JP
- (74) Maughan, Sophie Louise, et al, Scott & York Intellectual Property Ltd, 45 Grosvenor Road, St Albans, Hertfordshire AL1 3AW, GB
 Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV
- (54) **KARBAZOLA ATVASINĀJUMS, TĀ SOLVĀTS VAI TĀ FARMACEITISKI PIENĒMAMS SĀLS**
CARBAZOLE DERIVATIVE, SOLVATE THEREOF, OR PHARMACEUTICALLY ACCEPTABLE SALT THEREOF
- (57) 1. Karbazola atvasinājums, tā solvāts vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, karbazola atvasinājums, ko pārstāv sekojoša vispārīga formula (I):



kur A gredzens pārstāv (C₆-C₁₀)arilgrupu, kas var saturēt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu A grupas, vai 5- līdz 7-locekļu aromātiskas heterocikliskas grupas, kas var saturēt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu A grupas;

X pārstāv =N-, -O-, vai -S-;

Y pārstāv =N-, =CH-, -O-, vai -S-;

a un b var būt vienas un tās pašas vai dažādas, un pārstāv (C₁-C₄)alkilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₂-C₄)alkenilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, vai (C₂-C₄)alkinilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas;

V un Z var būt vienas un tās pašas vai dažādas, un pārstāv metilēngrupu, =N-, -NH-, -O-, -S-, -S(=O)-, -S(=O)₂-, -C(=O)-, -C(=O)NH-, vai -NHC(=O)-;

W pārstāv (C₁-C₁₀)alkilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₂-C₁₀)alkenilēngrupu,

kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₂-C₁₀)alkinilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₃-C₇)cikloalifātisko ogļūdeņražu grupu, kas var saturēt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu A grupas, vai (C₆-C₁₀)arilēngrupu, kas var saturēt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu A grupas;

R¹ pārstāv ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₂-C₄)alkenilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₂-C₄)alkinilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, vai (C₁-C₂)alkoksigrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas;

R² pārstāv ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₂-C₄)alkenilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₂-C₄)alkinilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₁-C₂)alkoksigrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, vai (C₁-C₄)alkiltiogrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas;

R³ pārstāv ūdeņraža atomu, hidroksilgrupu, ciāngrupu, -C(=O)R⁴ (R⁴ pārstāv ūdeņraža atomu, hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₁-C₄)alkoksigrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas vai (C₁-C₄)alkiltiogrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas), vai -C(=O)NR⁵R⁶ (R⁵ un R⁶ var būt vienas un tās pašas vai dažādas, un pārstāv ūdeņraža atomu, hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₁-C₄)alkoksigrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₁-C₄)alkilsulfonilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, vai (C₆-C₁₂)arilsulfonilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas),

aizvietotāju grupas A grupa pārstāv grupu, kas ietver:

halogēna atomu;

hidroksilgrupu;

karboksilgrupu,

ciāngrupu;

(C₁-C₆)alkilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu;

(C₂-C₃)alkenilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu;

(C₂-C₃)alkinilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu;

(C₁-C₂)alkoksigrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu;

(C₁-C₆)alkiltiogrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu;

(C₃-C₇)cikloalifātisku ogļūdeņražu grupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu;

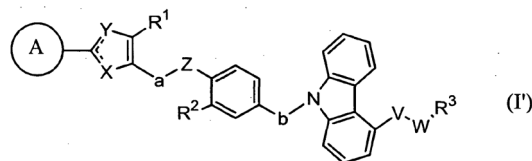
(C₇-C₁₆)aralkilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu;

karbamoilgrupu, kura var būt vienaizvietota vai divaizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no grupas (C₁-C₄)alkoksikarbonilgrupa, (C₁-C₄)alkilgrupa, (C₁-C₄)alkilsulfonilgrupa un (C₆-C₁₀)arilsulfonilgrupa;

(C₆-C₁₀)arilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu; un

5- līdz 7-locekļu aromātisku heterociklisku grupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu.

2. Karbazola atvasinājums, tā solvāts vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kur karbazola atvasinājumu pārstāv sekojoša vispārīga formula (I'):



kur gredzens A, grupas X, Y, a, b, V, Z, W, R¹, R² un R³ attiecīgi pārstāv 1. pretenzijas definīciju sinonīmus.

3. Karbazola atvasinājums, tā solvāts vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur formulā (I) vai (I'):

gredzens A pārstāv {fenilgrupu, indenilgrupu, 1-naftilgrupu vai 2-naftilgrupu}, kas var saturēt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu A grupas, vai {fūrilgrupu, tienilgrupu, pirolilgrupu, pirazolilgrupu, imidazolilgrupu, oksazolilgrupu, izooksazolilgrupu, tiazolilgrupu, izotiazolilgrupu, 1,2,3-oksadiazolilgrupu, triazolilgrupu, tiadiazolilgrupu, piranilgrupu, pīridilgrupu, pīridazinilgrupu, pīrimidinilgrupu, pirazinilgrupu vai azepinilgrupu}, kas var saturēt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu A grupas;

X pārstāv =N-, -O-, vai -S-;

Y pārstāv =N-, -O-, vai -S-;

a un b var būt vienas un tās pašas vai dažādas, un pārstāv (C₁-C₄)alkilēngrupu, kuras 1 vai 2 ūdeņraža atomi ir aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu vai (C₁-C₄)alkoksigrupu};

V un Z var būt vienas un tās pašas vai dažādas, un pārstāv metilēngrupu, -NH-, -O-, -S- vai -S(=O)-;

W pārstāv (C₁-C₁₀)alkilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu B grupas, (C₂-C₆)alkenilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu B grupas, (C₂-C₆)alkinilēngrupu kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu B grupas, (C₃-C₇)cikloalkilēngrupu, kurai var būt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu B grupas, (C₃-C₇)cikloalkenilēngrupu, kurai var būt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu B grupas, kur aizvietotāju grupas B grupa pārstāv grupu, kas ietver halogēna atomu, (C₁-C₆)alkilgrupu, (C₁-C₆)alkoksigrupu, (C₁-C₆)alkiltiogrupu, (C₁-C₆)halogēnalkilgrupu un (C₆-C₁₀)arilgrupu;

R¹ pārstāv (C₁-C₄)alkilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu vai ar (C₁-C₄)haloalkilgrupu}, vai (C₁-C₄)alkoksigrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu vai ar (C₁-C₄)haloalkilgrupu};

R² pārstāv ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar aizvietotāju grupu, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu C grupas, (C₁-C₄)alkoksigrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar aizvietotāju grupu, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu C grupas vai (C₁-C₄)alkiltiogrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar aizvietotāju grupu, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu C grupas, kur aizvietotāju grupas C grupa pārstāv grupu, kas ietver halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu un (C₁-C₄)haloalkilgrupu; un R³ pārstāv ūdeņraža atomu, hidroksilgrupu, ciāngrupu, vai -C(=O)R⁴ (R⁴ pārstāv ūdeņraža atomu, hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu vai ar (C₁-C₄)haloalkilgrupu}, (C₁-C₄)alkoksigrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu vai ar (C₁-C₄)haloalkilgrupu}.

4. Karbazola atvasinājums, tā solvāts vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur formulā (I) vai (I'):

gredzens A pārstāv {fenilgrupu, indenilgrupu, 1-naftilgrupu vai 2-naftilgrupu}, kas var saturēt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu A grupas, vai {fūrilgrupu, tienilgrupu, pirolgrupu, pirazolilgrupu, imidazolilgrupu, oksazolilgrupu, izooksazolilgrupu, tiazolilgrupu, izotiazolilgrupu, 1,2,3-oksadiazolilgrupu, triazolilgrupu, tiadiazolilgrupu, piranilgrupu, pīridilgrupu, pīridazinilgrupu,

pieņemams sāls saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur formulā (I) vai (I'):

gredzens A pārstāv fenilgrupu;

X pārstāv =N-;

Y pārstāv -O-;

a un b var būt vienas un tās pašas vai dažādas, un pārstāv metilēngrupu vai etilēngrupu;

V un Z abi pārstāv -O-;

W pārstāv (C₁-C₄)alkilēngrupu, kuras 1 vai 2 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar (C₁-C₄)alkilgrupu;

R¹ pārstāv metilgrupu;

R² pārstāv metoksigrupu, un

R³ pārstāv karboksilgrupu.

11. Karbazola atvasinājums, tā solvāts vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kur formulā (I) pārstāvētais karbazola atvasinājums ir viens no grupas:

{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}etiķskābe,

{9-[4-((furan-2-il-5-metil-oksazol-4-il)metoksi)-3-metoksi-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}etiķskābe,

2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2-metilpropionskābe,

(±)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}propionskābe,

(±)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}sviestskābe,

(±)-2-{9-[4-((2-furan-2-il)-5-metil-oksazol-4-il)metoksi)-3-metoksi-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2-feniletiķskābe,

2-{9-[4-((2-furan-2-il-5-metil-oksazol-4-il)metoksi)-3-metoksi-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2-metilpropionskābe,

2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-tiofen-2-il-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2-metilpropionskābe,

2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-piridin-2-il-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2-metilpropionskābe,

(±)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-3-metilsviestskābe,

(±)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}baldiriānskābe,

4-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}sviestskābe,

2-metil-2-{9-[4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}propionskābe,

2-{9-[3-(2-(furan-2-il)-5-metoksi-oksazol-4-il)metoksi)-4-metoksi-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2-metilpropionskābe,

2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-tiazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2-metilpropionskābe,

2-{9-[3-metoksi-4-((4-metil-2-fenil-tiazol-5-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2-metilpropionskābe,

(±)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}kapronskābe,

(±)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}heptānskābe,

(±)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}kaprilskābe,

5-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}baldiriānskābe,

6-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}kapronskābe,

3-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2,2-dimetilpropionskābe,

3-{9-[4-((2-(furan-2-il)-5-metil-oksazol-4-il)metoksi)-3-metoksi-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2,2-dimetilpropionskābe,

3-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-(tiofen-2-il)-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2,2-dimetilpropionskābe,

3-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-piridin-4-il-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2,2-dimetilpropionskābe,

(±)-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}feniletiķskābe,

(±)-4-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2-metilsviestskābe,

(S)-(+)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}sviestskābe,

(S)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}propionskābe,

(S)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-3-metilsviestskābe,

(S)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}baldiriānskābe,

(R)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}sviestskābe,

(R)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}propionskābe,

(R)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-3-metilsviestskābe,

(R)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}baldiriānskābe,

4-((9-(4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-3-metoksibenzil)-9H-karbazol-5-iloksi)metil)-benzoscābe,

2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}benzoscābe,

3-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}benzoscābe,

4-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}benzoscābe,

(+)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2-feniletiķskābe,

(-)-2-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2-feniletiķskābe,

(-)-4-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2-metilsviestskābe, un

(+)-4-{9-[3-metoksi-4-((5-metil-2-fenil-oksazol-4-il)metoksi)-benzil]-9H-karbazol-4-iloksi}-2-metilsviestskābe.

12. Medicīniskais sastāvs, kas ietver:

karbazola atvasinājumu, tā solvātu vai tā farmaceitiski pieņemamu sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai; un farmaceitiski pieņemamu nesēju.

13. Profilaktisks un/vai terapeitisks līdzeklis metabolajam sindromam, kas kā aktīvo vielu ietver karbazola atvasinājumu, tā solvātu vai tā farmaceitiski pieņemamu sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai.

14. Profilaktisks un/vai terapeitisks līdzeklis taukainajām aknām, aptaukošanās, lipīdu vielmaiņas traucējumiem, iekšējo orgānu aptaukošanās, diabētam, hiperlipēmijai, traucētai glikozes tolerāncei, paaugstinātam asinsspiedienam, taukaino aknu slimībai, kas nav alkoholisma izcelsmes, vai steatohepatītam, kas nav alkoholisma izcelsmes, kas kā aktīvo vielu ietver karbazola atvasinājumu, tā solvātu vai tā farmaceitiski pieņemamu sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai.

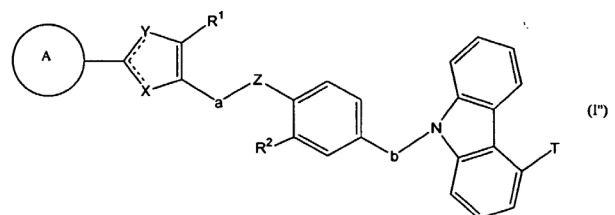
15. Profilaktisks un/vai terapeitisks līdzeklis taukainajām aknām vai aptaukošanās, kas kā aktīvo vielu ietver karbazola atvasinājumu, tā solvātu vai tā farmaceitiski pieņemamu sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai.

16. PPAR modulators, kas kā aktīvo vielu ietver karbazola atvasinājumu, tā solvātu vai tā farmaceitiski pieņemamu sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai.

17. PPAR-γ antagonists, kas kā aktīvo vielu ietver karbazola atvasinājumu, tā solvātu vai tā farmaceitiski pieņemamu sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai.

18. Karbazola atvasinājuma, tā solvāta vai tā farmaceitiski pieņemama sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai izmantošana profilaktiska un/vai terapeitiska līdzekļa pagatavošanai taukainajām aknām, aptaukošanās, lipīdu vielmaiņas traucējumiem, iekšējo orgānu aptaukošanās, diabētam, hiperlipēmijai, traucētai glikozes tolerāncei, paaugstinātam asinsspiedienam, taukaino aknu slimībai, kas nav alkoholisma izcelsmes, vai steatohepatītam, kas nav alkoholisma izcelsmes.

19. Karbazola atvasinājums, tā solvāts vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, karbazola atvasinājumu pārstāv sekojoša vispārīga formula (I''):



kur gredzens A pārstāv (C₆-C₁₀)arilgrupu, kas var saturēt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu A grupas, vai 5- līdz 7-locekļu aromātisku heterociklisku grupu, kas var saturēt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu A grupas;

X pārstāv =N-, =CH-, -O-, vai -S-;

Y pārstāv =N-, -O-, vai -S-;

a un b var būt vienas un tās pašas vai dažādas, un pārstāv (C₁-C₄)alkilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₂-C₄)alkenilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, vai (C₂-C₄)alkinilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas;

Z pārstāv metilēngrupu, =N-, -NH-, -O-, -S-, -S(=O)-, -S(=O)₂-, -C(=O)-, -C(=O)NH-, vai -NHC(=O)-;

R¹ pārstāv ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₂-C₄)alkenilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₂-C₄)alkinilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, vai (C₁-C₄)alkoksigrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas;

R² pārstāv ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₂-C₄)alkenilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₂-C₄)alkinilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₁-C₄)alkoksigrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, vai (C₁-C₄)alkiltiogrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas;

T pārstāv -OH-, -OP-, vai -V-W-P-;

P pārstāv (C₁-C₄)alkilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₁-C₄)alifātisku acilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, vai (C₇-C₁₁)aromātisku acilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas;

V pārstāv metilēngrupu, =N-, -NH-, -O-, -S-, -S(=O)-, -S(=O)₂-, -C(=O)-, -C(=O)NH-, vai -NHC(=O)-;

W pārstāv (C₁-C₁₀)alkilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₂-C₁₀)alkenilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₃-C₇)cikloalifātisku ogļūdeņražu grupu, kurai var būt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu A grupas, (C₆-C₁₀)arilēngrupu, kurai var būt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu A grupas;

P' pārstāv (C₁-C₄)alkilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, (C₁-C₄)alifātisku acilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas, vai (C₇-C₁₁)aromātisku acilgrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu A grupas;

aizvietotāju grupas A grupa pārstāv grupu, kas ietver:

halogēna atomu;

hidroksilgrupu;

karboksilgrupu,

ciāngrupu;

(C₁-C₆)alkilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu;

(C₂-C₆)alkenilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu;

(C₂-C₆)alkinilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu;

(C₁-C₆)alkoksigrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu;

(C₁-C₆)alkiltiogrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu;

(C₃-C₇)cikloalifātisku ogļūdeņražu grupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu;

(C₇-C₁₆)aralkilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu;

karbamoilgrupu, kura var būt vienaizvietota vai divaizvietota ar aizvietotāju, kas izvēlēts no grupas (C₁-C₄)alkoksikarbonilgrupa, (C₁-C₄)alkilgrupa, (C₁-C₄)alkilsulfonilgrupa vai (C₆-C₁₀)arilsulfonilgrupa;

(C₆-C₁₀)arilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu;

5- līdz 7-locekļu aromātisku heterociklisku grupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar halogēna atomu, hidroksilgrupu, karboksilgrupu vai karbamoilgrupu.

20. Karbazola atvasinājums, tā solvāts vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar 19. pretenziju, kur formulā (I^o):

gredzens A pārstāv {fenilgrupu, indenilgrupu, 1-naftilgrupu vai 2-naftilgrupu}, kurai var būt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu A grupas, vai {fūrilgrupa, tienilgrupa, pirolilgrupa, pirazolilgrupa, imidazolilgrupa, oksazolilgrupa, izooksazolilgrupa, tiazolilgrupa, izotiazolilgrupa, 1,2,3-oksadiazolilgrupa, triazolilgrupa, tiadiazolilgrupa, piranilgrupa, pīridilgrupa, pīridazinilgrupa, pīrimidinilgrupa, pirazinilgrupa vai azepinilgrupa}, kurai var būt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu A grupas;

X pārstāv =N-, -O-, vai -S-;

Y pārstāv =N-, -O-, vai -S-;

a un b var būt vienas un tās pašas vai dažādas, un pārstāv (C₁-C₄)alkilēngrupu, kuras 1 vai 2 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, vai (C₁-C₄)alkoksigrupu};

Z pārstāv metilēngrupu, -NH-, -O-, -S-, vai -S(=O)-;

R¹ pārstāv (C₁-C₄)alkilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupu}, vai (C₁-C₄)alkoksigrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupu};

R² pārstāv ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar aizvietotāju grupu no aizvietotāju grupu C grupas, (C₁-C₄)alkoksigrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar aizvietotāju grupu no aizvietotāju grupu C grupas, kur aizvietotāju grupas C grupa pārstāv grupu, kurā ietilpst halogēna atoms, (C₁-C₄)alkilgrupa, (C₁-C₄)alkoksigrupa un (C₁-C₄)haloalkilgrupa;

T pārstāv -OH-, -OP-, vai -V-W-P-;

P pārstāv (C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alifātisku acilgrupu, vai (C₇-C₁₁)aromātisku acilgrupu;

V pārstāv metilēngrupu, -NH-, -O-, -S-, vai -S(=O)-;

W pārstāv (C₁-C₁₀)alkilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu B grupas, (C₂-C₆)alkenilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu B grupas, (C₂-C₆)alkinilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu B grupas, (C₃-C₇)cikloalkilēngrupu, kurai var būt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu B grupas, (C₃-C₇)cikloalkenilēngrupu, kurai var būt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu B grupas, kur aizvietotāju grupu B grupa pārstāv grupu, kurā ietilpst halogēna atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₆)alkoksigrupa, (C₁-C₆)alkiltiogrupa, (C₁-C₆)halogēnalkilgrupa un (C₆-C₁₀)arilgrupa;

P' pārstāv (C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alifātisku acilgrupu, vai (C₇-C₁₁)aromātisku acilgrupu.

21. Karbazola atvasinājums, tā solvāts vai tā farmaceitiski pieņemams sāls saskaņā ar 19. pretenziju, kur formulā (I^o):

gredzens A pārstāv {fenilgrupu, indenilgrupu, 1-naftilgrupu vai 2-naftilgrupu}, kurai var būt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu A grupas, vai {fūrilgrupa, tienilgrupa, pirolilgrupa, pirazolilgrupa, imidazolilgrupa, oksazolilgrupa, izooksazolilgrupa, tiazolilgrupa, izotiazolilgrupa, 1,2,3-oksadiazolilgrupa, triazolilgrupa, tiadiazolilgrupa, piranilgrupa, pīridilgrupa, pīridazinilgrupa, pīrimidinilgrupa, pirazinilgrupa vai azepinilgrupa}, kurai var būt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu A grupas;

X pārstāv =N-, -O-, vai -S-;
 Y pārstāv =N-, -O-, vai -S-;
 a un b var būt vienas un tās pašas vai dažādas, un pārstāv (C₁-C₄)alkilēngrupu, kuras 1 vai 2 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, vai (C₁-C₄)alkoksigrupu};
 Z pārstāv metilēngrupu, -NH-, -O-, -S-, vai -S(=O)-;
 R¹ pārstāv (C₁-C₄)alkilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupu}, vai (C₁-C₄)alkoksigrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupu};
 R² pārstāv ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {(C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupu}, (C₁-C₄)alkoksigrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {(C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupu}, vai (C₁-C₄)alkilgrupu, kuras 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {(C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupu};
 T pārstāv -OH, -OP, vai -V-W-P';
 P pārstāv (C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alifātisku acilgrupu, vai (C₇-C₁₁)aromātisku acilgrupu;
 V pārstāv metilēngrupu, -NH-, -O-, -S-, vai -S(=O)-;
 W pārstāv (C₁-C₁₀)alkilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu B grupas, (C₂-C₆)alkenilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu B grupas, (C₂-C₆)alkinilēngrupu, kurai var būt aizvietotāja grupa, kas izvēlēta no aizvietotāju grupu B grupas, (C₃-C₇)cikloalkilēngrupu, kurai var būt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu B grupas, (C₃-C₇)cikloalkenilēngrupu, kurai var būt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu B grupas, (C₅-C₁₀)arilēngrupu, kurai var būt 1 līdz 3 aizvietotāju grupas, kas izvēlētas no aizvietotāju grupu B grupas, kur aizvietotāju grupu B grupa pārstāv grupu, kurā ietilpst halogēna atoms, (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₁-C₆)alkoksigrupa, (C₁-C₆)alkiltiogrups, (C₁-C₆)halogēnalkilgrupa un (C₆-C₁₀)arilgrupa;
 P' pārstāv (C₁-C₄)alkilgrupu, (C₁-C₄)alifātisku acilgrupu, vai (C₇-C₁₁)aromātisku acilgrupu.

22. Karbazola atvasinājums, tā solvāts vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar 19. pretenziju, kur formulā (I^o):
 gredzens A pārstāv {fenilgrupu, 1-naftilgrupu, vai 2-naftilgrupu}, kuru 1 vai 2 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, vai (C₁-C₄)alkoksigrupu}, vai pārstāv {fūrilgrupu, tienilgrupu, pirolilgrupu, imidazolilgrupu, oksazolilgrupu, izooksazolilgrupu, tiazolilgrupu, izotiazolilgrupu, piranilgrupu vai pīridilgrupu}, kuru 1 vai 2 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu vai (C₁-C₄)alkoksigrupu};
 X pārstāv =N-, -O-, vai -S-;
 Y pārstāv =N-, -O-, vai -S-;
 a un b var būt vienas un tās pašas vai dažādas, un pārstāv (C₁-C₄)alkilēngrupu;
 Z pārstāv metilēngrupu, -NH-, -O-, -S-, vai -S(=O)-;
 R¹ pārstāv (C₁-C₄)alkilgrupu vai (C₁-C₄)alkoksigrupu;
 R² pārstāv ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, vai (C₁-C₄)alkiltiogrupu;
 T pārstāv -OH, -OP, vai -V-W-P';
 P pārstāv alilgrupu, benzilgrupu, metoksimetilgrupu vai t-butilgrupu;
 V pārstāv metilēngrupu, -NH-, -O-, -S-, vai -S(=O)-;
 W pārstāv {(C₁-C₁₀)alkilēngrupu, (C₂-C₆)alkenilēngrupu vai (C₂-C₆)alkinilēngrupu}, kuru 1 vai 2 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₆)alkilgrupu vai ar fenilgrupu}, vai {(C₃-C₇)cikloalkilēngrupu, (C₃-C₇)cikloalkenilēngrupu vai (C₆-C₁₀)arilēngrupu}, kuru 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₆)alkilgrupu vai ar fenilgrupu};
 P' pārstāv (C₁-C₄)alkilgrupu, alilgrupu, benzilgrupu, vai metoksimetilgrupu.

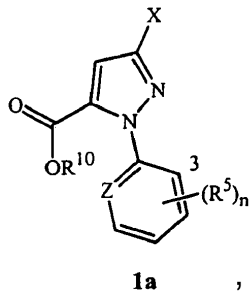
23. Karbazola atvasinājums, tā solvāts vai tā farmaceutiski pieņemams sāls saskaņā ar 19. pretenziju, kur formulā (I^o):
 gredzens A pārstāv {fenilgrupu, 1-naftilgrupu, vai 2-naftilgrupu}, kuru 1 vai 2 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, vai (C₁-C₄)alkoksigrupu}, vai pārstāv {fūrilgrupu, tienilgrupu, pirolilgrupu, imidazolilgrupu, oksazolilgrupu, izooksazolilgrupu, tiazolilgrupu, izotiazolilgrupu, piranilgrupu vai pīridilgrupu}, kuru 1 vai 2 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu vai (C₁-C₄)alkoksigrupu};

X un Y pārstāv jebkuru no: (i) X pārstāv -O- un Y pārstāv =N-, (ii) X pārstāv =N- un Y pārstāv -O- vai -S-, un (iii) X pārstāv -S- un Y pārstāv =N-;
 a un b var būt vienas un tās pašas vai dažādas, un pārstāv (C₁-C₄)alkilēngrupu;
 Z pārstāv -NH-, -O-, -S-, vai -S(=O)-;
 R¹ pārstāv (C₁-C₄)alkilgrupu vai (C₁-C₄)alkoksigrupu;
 R² pārstāv ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, vai (C₁-C₄)alkiltiogrupu;
 T pārstāv -OH, -OP, vai -V-W-P';
 P pārstāv alilgrupu, benzilgrupu, metoksimetilgrupu vai t-butilgrupu;
 V pārstāv metilēngrupu, -NH-, -O-, -S-, vai -S(=O)-;
 W pārstāv {(C₁-C₁₀)alkilēngrupu, (C₂-C₆)alkenilēngrupu vai (C₂-C₆)alkinilēngrupu}, kuru 1 vai 2 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₆)alkilgrupu vai ar fenilgrupu}, vai {(C₃-C₇)cikloalkilēngrupu, (C₃-C₇)cikloalkenilēngrupu vai (C₆-C₁₀)arilēngrupu}, kuru 1 līdz 3 ūdeņraža atomi var būt aizvietoti ar {halogēna atomu, (C₁-C₆)alkilgrupu vai ar fenilgrupu};
 P' pārstāv (C₁-C₄)alkilgrupu, alilgrupu, benzilgrupu, vai metoksimetilgrupu.

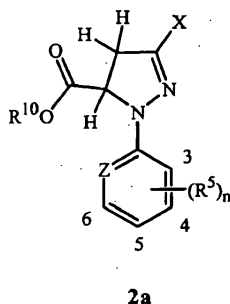
- (51) **A61K 9/22**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1858490**
A61K 31/53⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 06706994.8 (22) 16.02.2006
 (43) 28.11.2007
 (45) 11.04.2012
 (31) 102005009240 (32) 01.03.2005 (33) DE
 (86) PCT/EP2006/001393 16.02.2006
 (87) WO2006/092207 08.09.2006
 (73) Bayer Pharma Aktiengesellschaft, Müllerstrasse 178, 13355 Berlin, DE
 (72) SERNO, Peter, DE
 HEINIG, Roland, DE
 PAULI, Kerstin, DE
 HAYAUCHI, Yutaka, DE
 (74) Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV
 (54) **ZĀĻU FORMAS AR UZLABOTĀM FARMĀKOKINĒTIKĀJĀM ĪPAŠĪBĀM**
PHARMACEUTICAL FORMS WITH IMPROVED PHARMACOKINETIC PROPERTIES
 (57) 1. Zāļu forma, kas ātri sadalās mutē, un kas satur:
 a) vardenafila hidrohlorīda trihidrātu un b) cukurspirtu, kas raksturīga ar to, kas vismaz 80 % vardenafila devas no izmantotās substances formas izšķīst pie 25°C 10 mililitros fizioloģiskā vārāmā sāls šķīduma, un izdalīšanās intensitāte no zāļu formas 900 mililitros fizioloģiskā vārāmā sāls šķīduma pirmo 5 minūšu laikā USP lāpstīgmaistītajā ar ātrumu 50 apgriezīenu minūtē pie 37°C ir vismaz 70 %.
 2. Zāļu forma saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur vardenafila hidrohlorīda trihidrātu izsmalcinātā, amorfā vai jau izšķīdinātā formā.
 3. Zāļu forma saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur vardenafila hidrohlorīda trihidrātu mikronizētā formā ar daļiņu vidējo lielumu mazāku par 20 μm.
 4. Zāļu forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas satur no 40 % līdz 99 % cukurspirta.
 5. Zāļu forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas satur mannitolu kā cukurspirtu.
 6. Zāļu forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas satur sorbitolu kā cukurspirtu.
 7. Zāļu forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas satur mannitolu un sorbitola maisījumu kā cukurspirtu.
 8. Zāļu forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas satur starp 0,8 % un 25 % vardenafila, aprēķinot kā vardenafila brīvu bāzi.
 9. Zāļu forma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai zāļu iepakojumā ar norādi informācijas lapaņā, etiķetē vai uz iesaiņošanas kārbas, ka zāļu forma tiek ielikta mutes dobumā un pēc tās sadalīšanas tiek norīta.

- (51) **C07D 401/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1858878**
C07D 231/16⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 231/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 06738651.6 (22) 14.03.2006
 (43) 28.11.2007
 (45) 25.04.2012
 (31) 663410 P (32) 18.03.2005 (33) US
 (86) PCT/US2006/009617 14.03.2006
 (87) WO2006/102025 28.09.2006
 (73) E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY, 1007 Market Street, Wilmington, DE 19898, US
 (72) FAGAN, Paul, Joseph, US
 (74) Beacham, Annabel Rose, Dehns, St Bride's House, 10 Salisbury Square, London EC4Y 8JD, GB
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
 (54) **2-PIRAZOLĪNU PĀRVĒRŠANA PIRAZOLOS, IZMANTOJOT BROMU**
CONVERSION OF 2-PYRAZOLINES TO PYRAZOLES USING BROMINE

(57) 1. Savienojuma ar formulu (1a):



kur:
 X ir halogēna atoms, OR³ grupa vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupa;
 R³ ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupa;
 katra R⁵ neatkarīgi ir halogēna atoms vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupa;
 R¹⁰ ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₄)alkilgrupa;
 Z ir slāpekļa atoms vai CR⁹ grupa;
 R⁹ ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupa; un
 n ir vesels skaitlis no 0 līdz 3;
 iegūšanas paņēmiens, kurā ietilpst:
 2-pirazolīna ar formulu (2a):



nonāksana saskarē ar bromu vismaz 80°C temperatūrā.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur:
 X ir broma atoms vai CF₃ grupa; un
 Z ir slāpekļa atoms;
 katra R⁵ neatkarīgi ir halogēna atoms vai CF₃ grupa; un
 R¹⁰ ir metilgrupa vai etilgrupa.
 3. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur:
 X ir OR³ grupa;
 R³ ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupa; un
 R¹⁰ ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₄)alkilgrupa.
 4. Paņēmiens saskaņā ar 3. pretenziju, kur:
 X ir OH grupa, OCF₂H grupa vai OCH₂CF₃ grupa;
 Z ir slāpekļa atoms;
 katra R⁵ neatkarīgi ir halogēna atoms vai CF₃ grupa; un
 R¹⁰ ir metilgrupa vai etilgrupa.
 5. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur temperatūra ir starp 120°C un 140°C.
 6. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur bāzi pirms vai pēc nonāksanas saskarē ar bromu sajauc ar savienojumu ar formulu (2a), un molāro ekvivalentu attiecība bāze pret bromu ir 0:1 līdz 4:1.

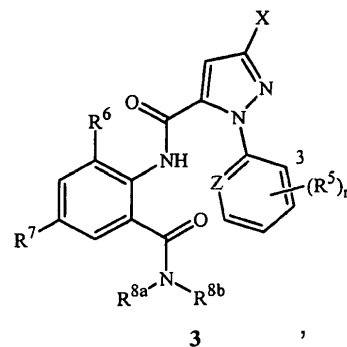
lu (2a), un molāro ekvivalentu attiecība bāze pret bromu ir 0:1 līdz 4:1.

7. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur bromu pret savienojumu ar formulu (2a) molāro ekvivalentu attiecība ir 2:1 līdz 1:1.

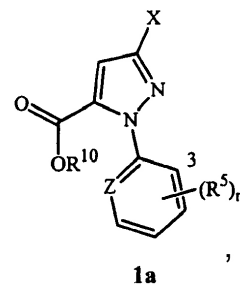
8. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur šķīdinātāju sajauc ar savienojumu ar formulu (2a), veidojot maisījumu pirms nonāksanas saskarē ar bromu, un temperatūra ir aptuveni šķīdinātāja viršanas temperatūra.

9. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur bromu pievieno savienojumam ar formulu (2a) gāzes veidā un gāzveidīgais broms ir atšķaidīts ar inerti gāzi.

10. Savienojuma ar formulu (3):



kur:
 X ir halogēna atoms, OR³ grupa vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupa;
 Z ir slāpekļa atoms vai CR⁹ grupa;
 R³ ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupa;
 katra R⁵ neatkarīgi ir halogēna atoms vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupa;
 R⁶ ir CH₃ grupa, fluora atoms, hlora atoms vai bromu atoms; un
 R⁷ ir fluora atoms, hlora atoms, bromu atoms, joda atoms, CN grupa vai CF₃ grupa;
 R^{8a} ir (C₁-C₄)alkilgrupa;
 R^{8b} ir ūdeņraža atoms vai CH₃ grupa;
 R⁹ ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms vai (C₁-C₄)halogēnalkilgrupa; un
 n ir vesels skaitlis no 0 līdz 3;
 iegūšanas paņēmiens, izmantojot savienojumu ar formulu (1a):



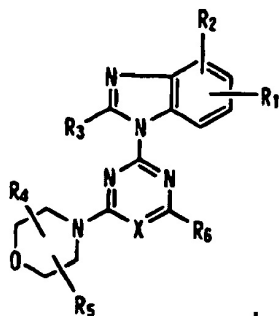
kur R¹⁰ ir ūdeņraža atoms vai (C₁-C₄)alkilgrupa; paņēmiens raksturīgs ar savienojuma ar formulu (1a) iegūšanu, izmantojot paņēmienu saskaņā ar 1. pretenziju.

11. Paņēmiens saskaņā ar 10. pretenziju, kur:
 Z ir slāpekļa atoms;
 katra R⁵ neatkarīgi ir hlora atoms, bromu atoms vai CF₃ grupa; viena R⁵ atrodas 3. pozīcijā; un
 R¹⁰ ir metilgrupa vai etilgrupa.
 12. Paņēmiens saskaņā ar 11. pretenziju, kur:
 X ir bromu atoms;
 n ir 1; un
 R⁵ ir hlora atoms.

- (51) **C12N 15/15**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1859041**
C07K 14/81⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 47/43⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 47/42⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 51/08⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 49/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 25/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

- (21) 05770546.9 (22) 21.07.2005
 (43) 28.11.2007
 (45) 28.03.2012
 (31) 653928 P (32) 18.02.2005 (33) US
 (86) PCT/CA2005/001158 21.07.2005
 (87) WO2006/086870 24.08.2006
 (73) Angiochem Inc., 201 President Kennedy Avenue, Suite PK-R220, Montréal, QC H2X 3Y7, CA
 (72) BÉLIVEAU, Richard, CA
 DEMEULE, Michel, CA
 CHÉ, Christian, CA
 REGINA, Anthony, CA
 (74) Bösl, Raphael Konrad, et al, Isenbruck Bösl Hörschler LLP, Patentanwälte, Prinzregentenstrasse 68, 81675 München, DE
 Aleksandrs SMIRNOVS, patenti aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV
 (54) **APROTIŅĪNA POLIPEPTĪDI SAVIENOJUMA TRANSPORTĒŠANAI CAUR ASINS-SMADZĒŅU BARJERU**
APROTININ POLYPEPTIDES FOR TRANSPORTING A COMPOUND ACROSS THE BLOOD-BRAIN BARRIER
 (57) 1. Peptīds ar sekvenci TFFYGGSRGKRNNFKTEEY.

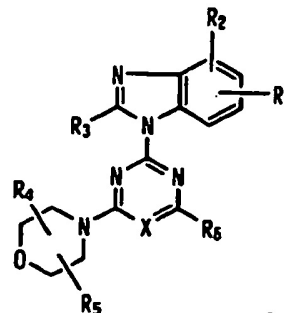
- (51) **A61K 31/5377⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **1864665**
A61P 1/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 17/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 19/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 29/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 37/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 37/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 37/08⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 403/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 403/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 413/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 06729002.3 (22) 13.03.2006
 (43) 12.12.2007
 (45) 16.05.2012
 (31) 2005069255 (32) 11.03.2005 (33) JP
 (86) PCT/JP2006/304937 13.03.2006
 (87) WO2006/095906 14.09.2006
 (73) ZENYAKU KOGYO KABUSHIKIKAIISHA, 2-9 Nihonbashi-Muromachi 3-chome Chuo-ku, Tokyo 103-0022, JP
 (72) HARUTA, Kazuhiko, JP
 YAGUCHI, Shinichi, JP
 MATSUNO, Toshiyuki, JP
 TSUCHIDA, Yoshio, JP
 WATANABE, Tetsuo, JP
 YOSHIOKA, Kimitomo, JP
 YUI, Ryogo, JP
 (74) Crowhurst, Charlotte Waveney, Potter Clarkson LLP, Park View House, 58 The Ropewalk, Nottingham NG1 5DD, GB
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
 (54) **IMŪNSUPRESĪVS LĪDZEKLIS, KAS SATUR HETERO-CIKLISKU SAVIENOJUMU KĀ AKTĪVU INGREDIENTU**
IMMUNOSUPPRESSIVE AGENT COMPRISING A HETERO-CYCLIC COMPOUND AS ACTIVE INGREDIENT
 (57) 1. Heterocikliska savienojuma, kas atbilst vispārējai formulai (I):



kur:
 X apzīmē slāpekļa atomu vai CH grupu;

R₁ un R₂ abas kopā vai katra atsevišķi apzīmē ūdeņraža atomu, hidroksilgrupu, halogēna atomu, aminogrupu, (C₁-C₆)alkilaminogrupu, (C₁-C₆)alkoksigrupu, (C₁-C₆)alkilgrupu vai ciāngrupu;
 R₃ apzīmē ūdeņraža atomu, difluorometilgrupu, aminogrupu, (C₁-C₆)alkilaminogrupu, metilgrupu vai hidroksimetilgrupu;
 R₄ un R₅ apzīmē ūdeņraža atomu vai (C₁-C₆)alkilgrupu;
 R₆ apzīmē morfolinogrupu (iespējams aizvietotu ar vienu vai divām (C₁-C₆)alkilgrupām), pīrolidīnīlgrupu (iespējams aizvietotu ar hidroksi-(C₁-C₆)alkilgrupu), piperidīnīlgrupu (iespējams aizvietotu ar vienu vai diviem skābekļa atomiem, hidroksilgrupām, formilgrupām vai (C₁-C₆)alkilgrupām), piperazīnīlgrupu (iespējams aizvietotu ar vienu vai diviem skābekļa atomiem, pie tam slāpekļa atoms 4. pozīcijā iespējams aizvietots ar aizvietotāju, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no formilgrupas, (C₁-C₆)hidroksialkilgrupas, (C₁-C₆)alkoksikarbonilgrupas, (C₁-C₆)oksoalkilgrupas, aromātiskas karbonilgrupas, benzilkarbonilgrupas un aizvietotas karbamoilgrupas) vai 1,4-diazepanogrupu (iespējams aizvietotu ar vienu vai diviem skābekļa atomiem, pie tam slāpekļa atoms 4. pozīcijā iespējams aizvietots ar aizvietotāju, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no formilgrupas, (C₁-C₆)hidroksialkilgrupas, (C₁-C₆)alkoksikarbonilgrupas, (C₁-C₆)oksoalkilgrupas, aromātiskas karbonilgrupas, benzilkarbonilgrupas, aizvietotas karbamoilgrupas);
 vai tā farmaceutiski pieņemama sāls izmantošana medikamenta ražošanā imūnās sistēmas slimības ārstēšanai, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no transplantāta atgrūšanas slimības vai transplantāta reakcijas pret saimnieka organismu; zarnu iekaisuma slimības, vislabāk čūlainā kolīta vai Krona slimības; ādas iekaisuma vai alergiskās slimības, vislabāk psoriāzes vai atopiskā dermatīta; elpošanas ceļu iekaisuma vai alergiskā traucējuma, vislabāk obstruktīvas plaušu slimības vai astmas; autoimūnslimības, vislabāk reimatoīdā artrīta, sistēmiskās sarkanās vilkēdes, sklerodermijas vai Šegrena sindroma; sepses vai fulminantā hepatīta.

2. Heterociklisks savienojums, kas atbilst vispārējai formulai (I):



kur:

X apzīmē slāpekļa atomu vai CH grupu;
 R₁ un R₂ abas kopā vai katra atsevišķi apzīmē ūdeņraža atomu, hidroksilgrupu, halogēna atomu, aminogrupu, (C₁-C₆)alkilaminogrupu, (C₁-C₆)alkoksigrupu, (C₁-C₆)alkilgrupu vai ciāngrupu;
 R₃ apzīmē ūdeņraža atomu, difluorometilgrupu, aminogrupu, (C₁-C₆)alkilaminogrupu, metilgrupu vai hidroksimetilgrupu;
 R₄ un R₅ apzīmē ūdeņraža atomu vai (C₁-C₆)alkilgrupu;
 R₆ apzīmē morfolinogrupu (iespējams aizvietotu ar vienu vai divām (C₁-C₆)alkilgrupām), pīrolidīnīlgrupu (iespējams aizvietotu ar hidroksi-(C₁-C₆)alkilgrupu), piperidīnīlgrupu (iespējams aizvietotu ar vienu vai diviem skābekļa atomiem, hidroksilgrupām, formilgrupām vai (C₁-C₆)alkilgrupām), piperazīnīlgrupu (iespējams aizvietotu ar vienu vai diviem skābekļa atomiem, pie tam slāpekļa atoms 4. pozīcijā iespējams aizvietots ar aizvietotāju, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no formilgrupas, (C₁-C₆)hidroksialkilgrupas, (C₁-C₆)alkoksikarbonilgrupas, (C₁-C₆)oksoalkilgrupas, aromātiskas karbonilgrupas, benzilkarbonilgrupas un aizvietotas karbamoilgrupas) vai 1,4-diazepanogrupu (iespējams aizvietotu ar vienu vai diviem skābekļa atomiem, pie tam slāpekļa atoms 4. pozīcijā iespējams aizvietots ar aizvietotāju, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no formilgrupas, (C₁-C₆)hidroksialkilgrupas, (C₁-C₆)alkoksikarbonilgrupas, (C₁-C₆)oksoalkilgrupas, aromātiskas karbonilgrupas, benzilkarbonilgrupas, aizvietotas karbamoilgrupas);
 vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kuru izmanto, imūnās sistēmas slimības ārstēšanā, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no transplantāta atgrūšanas slimības vai transplantāta reakcijas pret

saimnieka organismu; zarnu iekaisuma slimības, vislabāk čūlainā kolīta vai Krona slimības; ādas iekaisuma vai alerģiskās slimības, vislabāk psoriāzes vai atopiskā dermatīta; elpošanas ceļu iekaisuma vai alerģiskā traucējuma, vislabāk obstruktīvas plaušu slimības vai astmas; autoimūnslimības, vislabāk reimatoīdā artrīta, sistēmiskās sarkanās vilkēdes, sklerodermijas vai Šegrena sindroma; sepses vai fulminantā hepatīta.

3. Izmantošana vai savienojums, kuru izmanto, saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur R_1 vai R_2 ir hidroksilgrupa.

4. Izmantošana vai savienojums, kuru izmanto, saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur R_1 vai R_2 ir hidroksilgrupa un R_3 ir difluormetilgrupa.

5. Izmantošana vai savienojums, kuru izmanto, saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur abas R_1 un R_2 grupas ir ūdeņraža atomi un R_3 ir difluormetilgrupa.

6. Izmantošana vai savienojums, kuru izmanto, saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kur R_6 ir 4-acetilpiperazīn-grupa.

7. Izmantošana vai savienojums, kuru izmanto, saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur minētais heterocikliskais savienojums ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

2-(2-metilbenzimidazol-1-il)-4,6-dimorfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-hidroksimetilbenzimidazol-1-il)-4,6-dimorfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-morfolino-6-(piperazin-1-il)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-morfolino-6-(5-okso-1,4-diazepan-1-il)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-morfolino-6-(3-oksopiperazin-1-il)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(4-formilpiperazin-1-il)-4-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(3,5-dioksopiperazin-1-il)-4-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(benzimidazol-1-il)-4-(*trans*-2,3-dimetilmorfolino)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-morfolino-6-piperidino-1,3,5-triazīna;
 2-(6-amino-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-(*cis*-2,3-dimetilmorfolino)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetil-6-etoksibenzimidazol-1-il)-4,6-dimorfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetil-4-metilbenzimidazol-1-il)-4,6-dimorfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetil-5-hidroksibenzimidazol-1-il)-4,6-dimorfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-aminobenzimidazol-1-il)-4,6-dimorfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4,6-dimorfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(6-amino-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-(2,2-dimetilmorfolino)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-(2-hidroksimetilpiperidino-1-il)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-metilbenzimidazol-1-il)-4,6-dimorfolinopirimidīna;
 2-(2-hidroksimetilbenzimidazol-1-il)-4,6-dimorfolinopirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-morfolino-6-(piperazin-1-il)pirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-morfolino-6-(5-okso-1,4-diazepan-1-il)pirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-morfolino-6-(3-oksopiperazin-1-il)pirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(4-formilpiperazin-1-il)-4-morfolinopirimidīna;
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-(2,2-dimetilmorfolino)-6-morfolinopirimidīna;
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-(3,3-dimetilmorfolino)-6-morfolinopirimidīna;
 2-(2-aminobenzimidazol-1-il)-4,6-dimorfolinopirimidīna;
 2-(2-difluormetil-4-metoksibenzimidazol-1-il)-4-(2,6-dimetilmorfolino)-6-morfolinopirimidīna;
 2-(5-amino-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4,6-di(2,6-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-(2-hidroksimetilpiperidino-1-il)-6-morfolinopirimidīna;
 2-(6-amino-4-hlor-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-(2,2-dimetilmorfolino)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;

2-(6-amino-4-hlor-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[metil-(1-metilpiperidino-4-il)amino]-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-(2-hidroksimetilpiperidino-1-il)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(4-hlor-2-difluormetil-5-hidroksibenzimidazol-1-il)-4,6-dimorfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(5,6-dimetil-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4,6-dimorfolino-1,3,5-triazīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(*cis*-2,3-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(*trans*-2,3-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(2,2-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(4-amino-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-hidroksimetilbenzimidazol-1-il)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-morfolinopirimidīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(*cis*-2,3-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(*trans*-2,3-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(2,2-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-6-morfolinopirimidīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(4-amino-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-morfolinopirimidīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-hidroksimetilbenzimidazol-1-il)-6-morfolinopirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-(*cis*-2,3-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-(*trans*-2,3-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-(2,2-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(4-amino-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-hidroksimetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolinopirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-(*cis*-2,3-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-(*trans*-2,3-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolinopirimidīna;
 2-(4-amino-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolinopirimidīna;
 2-(2-hidroksimetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolinopirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-(*cis*-2,3-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-(*trans*-2,3-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-(2,2-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-morfolino-1,3,5-triazīna;

2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-(4-metoksikarbonilpiperazin-1-il)-6-(*trans*-2,3-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-(4-metoksikarbonilpiperazin-1-il)-6-(2,2-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-(4-metoksikarbonilpiperazin-1-il)-6-morfolinopirimidīna;
 2-(4-amino-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-(4-metoksikarbonilpiperazin-1-il)-6-morfolinopirimidīna;
 2-(2-hidroksimetilbenzimidazol-1-il)-4-(4-metoksikarbonilpiperazin-1-il)-6-morfolinopirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-morfolino-6-(5-okso-1,4-diazepan-1-il)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-morfolino-6-(3-okso-piperazin-1-il)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(3,5-dioksopiperazin-1-il)-4-morfolino-1,3,5-triazīna; un
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4,6-dimorfolino-1,3,5-triazīna.

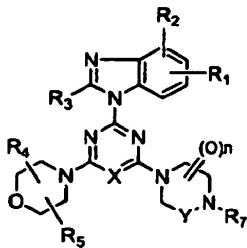
8. Izmantošana vai savienojums, kuru izmanto, saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur heterocikliskais savienojums ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-(2-hidroksimetilpirolidin-1-il)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-(2,2-dimetilmorfolino)-6-morfolinopirimidīna;
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-(3,3-dimetilmorfolino)-6-morfolinopirimidīna; un
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4,6-dimorfolino-1,3,5-triazīna.

9. Izmantošana vai savienojums, kuru izmanto, saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur heterocikliskais savienojums ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4,6-dimorfolino-1,3,5-triazīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-morfolinopirimidīna; un
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-morfolino-1,3,5-triazīna.

10. Heterocikliskais savienojums, kas atbilst vispārējai formulai (II):



kur:

n apzīmē 0-2;

X apzīmē slāpekļa atomu vai CH-grupu;

Y apzīmē $-(CH_2)_n$ -grupu, kur n, ir 1-2;

R₁ un R₂, abas vai katra, apzīmē ūdeņraža atomu, hidroksilgrupu, halogēna atomu, aminogrupu, C₁-C₆alkilaminogrupu, C₁-C₆alkoksigrupu, C₁-C₆alkilgrupu vai ciāngrupu;

R₃ apzīmē difluormetilgrupu, aminogrupu, C₁-C₆alkilaminogrupu, metilgrupu vai hidroksimetilgrupu;

R₄ un R₅ apzīmē ūdeņraža atomu vai C₁-C₆alkilgrupu;

R₇ apzīmē ūdeņraža atomu, C₁-C₆alkilgrupu, formilgrupu, C₁-C₆hidroksilalkilgrupu, C₁-C₆alkoksikarbonilgrupu, C₁-C₆oksoalkilgrupu, aromātisku karbonilgrupu, benzilkarbonilgrupu vai aizvietotu karbamoilgrupu;

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

11. Savienojums saskaņā ar 10. pretenziju, kur heterocikliskais savienojums ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(*cis*-2,3-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(*trans*-2,3-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(2,2-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;

4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(4-amino-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-hidroksimetilbenzimidazol-1-il)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-morfolinopirimidīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(*cis*-2,3-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(*trans*-2,3-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-(2,2-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-6-morfolinopirimidīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(4-amino-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-6-morfolinopirimidīna;
 4-(4-acetilpiperazin-1-il)-2-(2-hidroksimetilbenzimidazol-1-il)-6-morfolinopirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-(*cis*-2,3-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-(*trans*-2,3-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-(2,2-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(4-amino-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-hidroksimetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolinopirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-(*cis*-2,3-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-(*trans*-2,3-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolinopirimidīna;
 2-(4-amino-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolinopirimidīna;
 2-(2-hidroksimetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(N,N-dimetilkarbamoil)piperazin-1-il]-6-morfolinopirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-(*cis*-2,3-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-(*trans*-2,3-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-(2,2-dimetilmorfolino)-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(4-amino-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-2-(2-hidroksimetilbenzimidazol-1-il)-6-morfolino-1,3,5-triazīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-morfolinopirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-(*cis*-2,3-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-(*trans*-2,3-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 2-(2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-(2,2-dimetilmorfolino)pirimidīna;
 2-(2-difluormetil-4-hidroksibenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-morfolinopirimidīna;
 2-(4-amino-2-difluormetilbenzimidazol-1-il)-4-[4-(2-furoil)piperazin-1-il]-6-morfolinopirimidīna;

12. Savienojums saskaņā ar 10. vai 11. pretenziju, kur R₃ apzīmē difluormetilgrupu.

- (51) **A61K 9/20**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1868581**
A61K 31/47⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 31/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 9/48⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 06740898.9 (22) 11.04.2006
(43) 26.12.2007
(45) 14.03.2012
(31) 670207 P (32) 11.04.2005 (33) US
(86) PCT/US2006/013651 11.04.2006
(87) WO2006/110815 19.10.2006
(73) Abbott Laboratories, Department D377/AP6A-1, 100 Abbott Park Road, Abbott Park, Illinois 60064-6008, US
(72) WU, Huailiang, US
ZHANG, Geoff, US
(74) Modiano, Micaela Nadia, Modiano Josif Pisanty & Staub Ltd, Thierschstrasse 11, 80538 München, DE
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
(54) **MAZŠKĪSTOŠU ZĀĻU FARMACEITISKAS KOMPOZĪCIJAS AR UZLABOTIEM ŠĶĪDĪBAS PROFILIEM PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS HAVING IMPROVED DISSOLUTION PROFILES FOR POORLY SOLUBLE DRUGS**

(57) 1. Kompozīcija, kas ietver 1-(6-amino-3,5-difluorpiridin-2-il)-8-hlor-6-fluor-7-(3-hidroksiazetidīn-1-il)-4-okso-1,4-dihidrohinoīn-3-karbonskābi vai tās sāli, kristalizācijas inhibitoru, kas atlasīts no grupas, kura sastāv no hidroksipropilmetilcelulozes, polivinilpirolidona un hidroksipropilcelulozes, un pH modificētāju, kur minētā kompozīcija nodrošina 1-(6-amino-3,5-difluorpiridin-2-il)-8-hlor-6-fluor-7-(3-hidroksiazetidīn-1-il)-4-okso-1,4-dihidrohinoīn-3-karbonskābes vai tās sāls šķīšanas ātruma izmērāmu uzlabojumu.

2. 1-(6-amino-3,5-difluorpiridin-2-il)-8-hlor-6-fluor-7-(3-hidroksiazetidīn-1-il)-4-okso-1,4-dihidrohinoīn-3-karbonskābes vai tās sāls, kristalizācijas inhibitora, kas atlasīts no grupas, kura sastāv no hidroksipropilmetilcelulozes, polivinilpirolidona un hidroksipropilcelulozes, un pH modificētāja kompozīcijas ražošanai, kas nodrošina 1-(6-amino-3,5-difluorpiridin-2-il)-8-hlor-6-fluor-7-(3-hidroksiazetidīn-1-il)-4-okso-1,4-dihidrohinoīn-3-karbonskābes vai tās sāls šķīšanas ātruma izmērāmu uzlabojumu, kura paredzēta slimības ārstēšanai pacientam, ievadot minēto kompozīciju.

3. Kompozīcija vai pielietojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur 1-(6-amino-3,5-difluorpiridin-2-il)-8-hlor-6-fluor-7-(3-hidroksiazetidīn-1-il)-4-okso-1,4-dihidrohinoīn-3-karbonskābes sāls ietver meglumīnu.

4. Kompozīcija vai pielietojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur pH modificētājs ir atlasīts no grupas, kas sastāv no NaOH, LiOH, KOH, Na₂CO₃, NaHCO₃, K₂CO₃, KHCO₃, NaH₂PO₄, Na₂HPO₄, Na₃PO₄, KH₂PO₄, K₂HPO₄, K₃PO₄, Ca(OH)₂, Mg(OH)₂, Zn(OH)₂, Al(OH)₃, piridoksīna, trietanolamīna, amonija hidroksīda, citozīna, dietilamīna, meglumīna, ornitīna, glicīna, lizīna, arginīna, valīna, prolīna, asparagīnskābes, alanīna, asparagīna, izoleicīna, leicīna, metionīna, treonīna, holīna hidroksīda, prokaīna, dietiletanolamīna, glikozamīna, guanīna, nikotīnamīda, piperazīna, guanidīna, olamīna, piperidīna, trietilamīna, trometamīna, benzaīna, adenīna un to maisījumiem.

5. Kompozīcija vai pielietojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas nodrošina vismaz 5 % šķīšanas ātruma pieaugumu.

6. Kompozīcija vai pielietojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kur zāļu deva ir no 0,03 līdz 200 mg/kg ķermeņa svara.

- (51) **A61K 31/407**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1868600**
A61K 31/438⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/485⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 45/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 25/36⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 06724117.4 (22) 07.04.2006
(43) 26.12.2007

(45) 27.06.2012

(31) 102005016460 (32) 11.04.2005 (33) DE

(86) PCT/EP2006/003176 07.04.2006

(87) WO2006/108565 19.10.2006

(73) Grüenthal GmbH, Zieglerstrasse 6, 52078 Aachen, DE

(72) FRIDERICHS, Elmar, DE
KÖGEL, Babette-Yvonne, DE
LINZ, Klaus, DE

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

(54) **SPIROCĪKLISKA CIKLOHEKSĀNA ATVASINĀJUMI IZMANTOŠANAI VIĒĻU ATKARĪBAS ĀRSTĒŠANĀ SPIROCYCLIC CYCLOHEXANE DERIVATIVES FOR USE IN THE TREATMENT OF SUBSTANCE DEPENDENCY**

(57) 1. Spirocikliska cikloheksāna atvasinājums, kas izvēlēts no šādas rindas:

1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-cinnamoil-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-(3,3-dimetilbutanoil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-(ciklopentilkarbonil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-fenilpentametilēn)-2-(3,3-dimetilbutanoil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-(pentanoil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-(2-furilkarbonil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-(2-furilkarbonil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-(4-fluorbenzoiļ)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-(2-metoksibenzoil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-fenilpentametilēn)-2-(3-metilbutanoil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-(cikloheksilkarbonil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-benzoil-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-fenilpentametilēn)-2-(cikloheksilkarbonil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-(fenilacetil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-(4-metoksibenzoil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-fenilpentametilēn)-2-(4-trifluormetilbenzoil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-(tien-2-ilacetil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-(fenilacetil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-betanoil-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-benzilpentametilēn)-2-(4-trifluormetilbenzoil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-benzilpentametilēn)-2-(3-fluor-5-trifluormetilbenzoil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-(2,3-difluorbenzoil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
1,1-(3-dimetilamino-3-(3-fluorfenil)pentametilēn)-2-(4-metilbenzoil)-1,3,4,9-tetrahydro-2,9-diazafluorēns,
tīru diastereomēru, racemātu, tīru enantiomēru formā vai stereoisomēru maisījumu formā jebkura vēlamā maisījumu attiecībā, tā bāžu vai sāļu formā, it īpaši fizioloģiski pieņemamu sāļu vai fizioloģiski pieņemamu skābju sāļu vai katjonu formā, vai solvātu formā.

2. Spirocikliska cikloheksāna atvasinājums saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai vielu atkarības ārstēšanā.

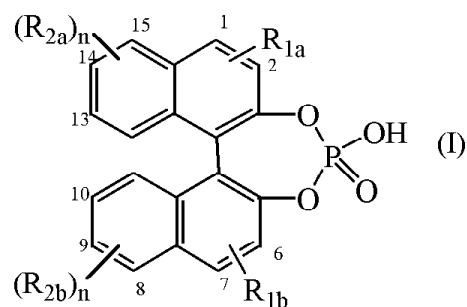
3. Spirocikliska cikloheksāna atvasinājums izmantošanai saskaņā ar 2. pretenziju, kur vielu atkarība ir opiātu atkarība.

4. Spirocikliska cikloheksāna atvasinājums izmantošanai saskaņā ar 2. vai 3. pretenziju, kur vielu atkarība ir heroīna, morfīna vai metadona atkarība.

- (51) **C07K 16/22**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1869085**
A61K 39/395⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C12N 15/13⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C12N 5/20⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 06721544.2 (22) 24.03.2006
(43) 26.12.2007
(45) 14.03.2012
(31) 664768 P (32) 24.03.2005 (33) US
(86) PCT/BE2006/000023 24.03.2006
(87) WO2006/099698 28.09.2006
(73) ThromboGenics N.V., Gaston Geenslaan 1, 3000 Leuven, BE
Life Sciences Research Partners, Onderwijs en Navorsing Campus Gasthuisberg K.U. Leuven, Herestraat 49, 3000 Leuven, BE
Vlaams Interuniversitair Instituut voor Biotechnologie vzw., Rijvisschestraat 120, 9052 Zwijnaarde, BE
- (72) STASSEN, Jean-Marie, BE
CARMELIET, Peter, BE
COLLEN, Désiré, BE
- (74) Bird, Ariane, et al, Bird Goën & Co NV, Klein Dalenstraat 42A, 3020 Winksele, BE
Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV
- (54) **JAUNA ANTI-PLGF ANTIVIELA
NOVEL ANTI-PLGF ANTIBODY**
- (57) 1. Antigēnu saistoša molekula, kas ir spējīga saistīties pie PIGF, kas raksturīga ar to, ka tā satur CDR reģionus, kuri atbilst sekvencai SEQ ID Nr. 17 līdz 22.
2. Antigēnu saistošā molekula saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir molekula, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no Fab, Fab' vai F(ab')₂, vismaz divu komplementaritāti noteicošo reģionu (CDR) kombinācijas, šķīdināmas vai membrānā noenkurotas, vienķēdes mainīgas daļas vai atsevišķa mainīga domēna.
3. Antigēnu saistošā molekula saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tā satur smagās ķēdes mainīgu reģionu, kas satur sekvenci SEQ ID Nr. 2, un ar to, ka tā satur vieglās ķēdes mainīgu reģionu, kas satur sekvenci SEQ ID Nr. 4.
4. Antigēnu saistošā molekula saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas ir anti-16D3, kas tiek producēta ar šūnu līniju, kas deponēta kā LMBP 6399CB, vai tās fragments.
5. Antigēnu saistošā molekula saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas ir humanizēta anti-16D3 vai anti-16D3 fragments.
6. Antigēnu saistošā molekula saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir vienķēdes mainīgs fragments.
7. Antigēnu saistošā molekula saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur aminoskābju sekvenci SEQ ID Nr. 24.
8. Antigēnu saistošā molekula saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur aminoskābju sekvenci SEQ ID Nr. 26.
9. Šūnu līnija, kas producē antigēnu saistošu molekulu saskaņā ar 1. pretenziju.
10. Šūnu līnija saskaņā ar 9. pretenziju, kas ir šūnu līnija, kas deponēta kā LMBP 6399CB.
11. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur kā aktīvo ingredientu PIGF-saistošu molekulu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai maisījumā ar farmaceutiski pieņemamu nesēju.
12. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 11. pretenziju, kas turpmāk satur cita antiangiogēna līdzekļa terapeitiski efektīvu daudzumu.
13. Polinukleotīds, kas kodē antigēnu saistošu molekulu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai.
14. Antigēnu saistošās molekulas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai izmantošana savienojumu ar papildu PIGF-inhibēšanas efektu skrīningam vēža ārstēšanā.
15. Antigēnu saistošās molekulas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai izmantošana par *in vitro* diagnostikas instrumentu.
16. Antigēnu saistošās molekulas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai izmantošana antigēnu saistošu molekulu, kas ir spējīga saistīties pie tā paša PIGF epitopa, skrīningam.
17. Metode antigēnu saistošu molekulu, kas ir spējīga saistīties pie tā paša PIGF epitopa, kā anti-16D3 saskaņā ar 4. pretenziju, selekcijai, kas ietver šādas stadijas:
- a) PIGF saistošās molekulas nodrošināšana un
- b) PIGF saistošās molekulas, kas ir spējīga saistīties pie tā paša PIGF epitopa kā anti-16D3, selekcija uz reaģētspējas ar

minēto epitopu bāzes vai konkurences ar antivielu 16D3 bāzes.
18. Antigēnu saistoša molekula saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai vai polinukleotīds saskaņā ar 13. pretenziju, kuru lieto nevēlamas angiogēnēzes ārstēšanai un/vai novēršanai zīdītājam patoloģiskā stāvoklī.
19. Antigēnu saistošā molekula vai polinukleotīds saskaņā ar 18. pretenziju, kur patoloģiskais stāvoklis ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no vēža, iekaisuma, adhēzijas veidošanās, acu slimībām, plaušu hipertensijas un paaugstinātas asinsvadu sienīgu caurlaidības.
20. Antigēnu saistošā molekula vai polinukleotīds saskaņā ar 19. pretenziju, kur vēzis ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no resnās zarnas vēža, krūts vēža, aizkuņģa dziedzera vēža un melanomas.

- (51) **C07F 9/09**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1888604**
C07D 215/22⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 06755275.2 (22) 22.05.2006
(43) 20.02.2008
(45) 14.03.2012
(31) 05104482 (32) 25.05.2005 (33) EP
(86) PCT/EP2006/062502 22.05.2006
(87) WO2006/125769 30.11.2006
(73) Janssen Pharmaceutica NV, Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, BE
(72) PORSTMANN, Frank, Ralf, Cilag AG, CH
HORNS, Stefan, Cilag AG, CH
BADER, Thomas, CH
(74) Vervoort, Liesbeth, Janssen Pharmaceutica N.V., Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, BE
Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV
- (54) **PAŅĒMIENS (ALFA S, BETA R)-6-BROM-ALFA-[2-(DIMETILAMINO)ETIL]-2-METOKSI-ALFA-1-NAFTALINIL-BETA-FENIL-3-HINOLĪNETANOLA IEGŪŠANAI
PROCESS FOR PREPARING (ALPHA S, BETA R)-6-BROMO-ALPHA-[2-(DIMETHYLAMINO)ETHYL]-2-METHOXY-ALPHA-1-NAPHTHALENYL-BETA-PHENYL-3-QUINOLINEETHANOL**
- (57) 1. Paņēmiens (*alfaS, betaR*)-6-brom-*alfa*-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-*alfa*-1-naftalinil-*beta*-fenil-3-hinolīnetanola izolēšanai no 6-brom-*alfa*-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-*alfa*-1-naftalinil-*beta*-fenil-3-hinolīnetanola stereozomēru formu maisījuma, izmantojot stereozomēru sadalīšanu ar hirālu 4-hidroksidinafto[2,1-d:1',2'-f][1,3,2]dioksafosfepīna 4-oksīdu vai tā atvasinājumu kā sadalīšanas līdzekli, minētajā paņēmiņā ietilpst šādas stadijas:
a) 6-brom-*alfa*-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-*alfa*-1-naftalinil-*beta*-fenil-3-hinolīnetanola stereozomēru formu maisījuma pakļaušana reakcijai ar sadalīšanas līdzekli piemērotā šķīdinātājā;
b) iegūtā (*alfaS, betaR*)-6-brom-*alfa*-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-*alfa*-1-naftalinil-*beta*-fenil-3-hinolīnetanola kristāliskā sāls un minētā sadalīšanas līdzekļa atdalīšana no stadijā a) iegūtā reakcijas maisījuma;
c) neobligāti stadijā b) iegūtā sāls rekrystalizēšana vai suspendēšana piemērotā šķīdinātājā;
d) (*alfaS, betaR*)-6-brom-*alfa*-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-*alfa*-1-naftalinil-*beta*-fenil-3-hinolīnetanola atbrīvošana no stadijā b) vai c) iegūtā sāls.
2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur hirālais 4-hidroksidinafto[2,1-d:1',2'-f][1,3,2]dioksafosfepīna 4-oksīds vai tā atvasinājums ir hirāls savienojums ar formulu (I):



kur:

n ir vesels skaitlis, kas ir 1 vai 2;

R_{1a} un R_{1b} katrs neatkarīgi apzīmē ūdeņraža atomu; halogēna atomu; C₁₋₁₂alkilgrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar arilgrupu; arilgrupu; naftilgrupu; Si(fenil)grupu; C₁₋₆alkiloksigrupu; antracēnilgrupu; C₂₋₁₂alkinilgrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar arilgrupu;

R_{2a} un R_{2b} katrs neatkarīgi apzīmē ūdeņraža atomu; halogēna atomu; C₁₋₁₂alkilgrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar arilgrupu; arilgrupu; C₂₋₁₂alkēnilgrupu; C₁₋₆alkiloksigrupu, kas neobligāti ir aizvietota ar fenilgrupu; nitrogrupu; hidroksilgrupu;

R_{2a} 4-hidroksidinafto[2,1-d:1',2'-f][1,3,2]dioksafosfepīna 4-oksīda 14. pozīcijā un 15. pozīcijā var arī būt ņemti kopā, lai veidotu kopā ar naftilgredzenu, kuram abi R_{2a} aizvietotāji ir pievienoti, 13-metil-12,13,14,15,16,17-heksahidro-11H-ciklopenta[a]fenantrēnu;

R_{2b} 4-hidroksidinafto[2,1-d:1',2'-f][1,3,2]dioksafosfepīna 4-oksīda 8. pozīcijā un 9. pozīcijā var arī būt ņemti kopā, lai veidotu kopā ar naftilgredzenu, kuram abi R_{2b} aizvietotāji ir pievienoti, 13-metil-12,13,14,15,16,17-heksahidro-11H-ciklopenta[a]fenantrēnu;

arilgrupa ir fenilgrupa vai fenilgrupa, kas ir aizvietota ar vienu, diviem vai trim aizvietotājiem, katrs neatkarīgi ir izvēlēts no C₁₋₆alkilgrupas, polihalogēnalkilgrupas, C₁₋₆alkiloksigrupas, kas ir aizvietota ar fenilgrupu, fenilgrupas, kas neobligāti ir aizvietota ar vienu, diviem vai trim aizvietotājiem, kas ir izvēlēti no C₁₋₆alkilgrupas vai naftilgrupas.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kur sadalīšanas līdzeklis ir (11bR)-4-hidroksidinafto[2,1-d:1',2'-f][1,3,2]dioksafosfepīna 4-oksīds.

4. Paņēmiens saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju, kur piemērotais šķīdinātājs stadijā a) ir ketons, esteris, ketona maisījums ar aprotisku polāru šķīdinātāju vai estera maisījums ar aprotisku polāru šķīdinātāju.

5. Paņēmiens saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju, kur piemērotais šķīdinātājs stadijā a) ir ketons vai ketona maisījums ar aprotisku polāru šķīdinātāju.

6. Paņēmiens saskaņā ar 5. pretenziju, kur ketons ir acetons vai metilētilketons un kur aprotiskais polārais šķīdinātājs ir dimetilsulfoksīds vai N,N-dimetilformamīds.

7. Paņēmiens saskaņā ar 5. pretenziju, kur piemērotais šķīdinātājs ir acetons.

8. Paņēmiens saskaņā ar 5. pretenziju, kur piemērotais šķīdinātājs ir acetona un dimetilsulfoksīda maisījums.

9. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kur reakcijas maisījumā saskaņā ar a) tiek ievadīti (alfaS,betaR)-6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola sāls kristalizācijas aizmetņi un sadalīšanas līdzeklis, kā definēts jebkurā 1., 2. vai 3. pretenzijā, pirms sadalīšanas līdzekļa pievienošanas reakcijas maisījumam.

10. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kur reakcijas maisījumā saskaņā ar a) tiek ievadīti (alfaS,betaR)-6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola sāls kristalizācijas aizmetņi un sadalīšanas līdzeklis, kā definēts jebkurā 1., 2. vai 3. pretenzijā, pēc sadalīšanas līdzekļa pievienošanas reakcijas maisījumam.

11. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kur reakcijas maisījumā saskaņā ar a) tiek ievadīti (alfaS,betaR)-6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola sāls kristalizācijas aizmetņi un sadalīšanas līdzeklis, kā definēts jebkurā 1., 2. vai 3. pretenzijā, pirms un pēc sadalīšanas līdzekļa pievienošanas reakcijas maisījumam.

12. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, kur sadalīšanas līdzeklis kā šķīdums piemērotā šķīdinātājā tiek pievienots 6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola stereoizomēru formu maisījumam.

13. Paņēmiens saskaņā ar 12. pretenziju, kur piemērotais šķīdinātājs ir aprotisks polārs šķīdinātājs.

14. Paņēmiens saskaņā ar 13. pretenziju, kur aprotiskais polārais šķīdinātājs ir dimetilsulfoksīds, N,N-dimetilformamīds, N,N-dimetilacetamīds vai N-metilpirolidons.

15. Paņēmiens saskaņā ar 14. pretenziju, kur aprotiskais polārais šķīdinātājs ir dimetilsulfoksīds vai N,N-dimetilformamīds.

16. Paņēmiens saskaņā ar 15. pretenziju, kur aprotiskais polārais šķīdinātājs ir dimetilsulfoksīds.

17. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 16. pretenzijai, kur rekrystalizēšanas vai suspendēšanas stadijā saskaņā ar c)

tiek veikta acetona, N,N-dimetilformamīdā, N,N-dimetilformamīda un ūdens maisījumā, dimetilsulfoksīda un ūdens maisījumā, dimetilsulfoksīda un acetona maisījumā, dimetilsulfoksīda un spirta maisījumā vai N,N-dimetilformamīda un spirta maisījumā.

18. Paņēmiens saskaņā ar 17. pretenziju, kur rekrystalizēšana vai suspendēšana tiek veikta acetona.

19. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 18. pretenzijai, kur bāzes atbrīvošana no sāls saskaņā ar d) tiek veikta, pakļaujot sāli reakcijai ar piemērotu bāzi piemērotā šķīdinātājā.

20. Paņēmiens saskaņā ar 19. pretenziju, kur piemērotais šķīdinātājs ir organisks šķīdinātājs, kas nav sajaukams ar ūdeni vai sāļu ūdens šķīdumiem.

21. Paņēmiens saskaņā ar 19. pretenziju, kur šķīdinātājs ir toluols vai tetrahidrofurāns.

22. Paņēmiens saskaņā ar 21. pretenziju, kur šķīdinātājs ir toluols.

23. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 19. līdz 22. pretenzijai, kur bāze ir karbonāta bāze vai fosfāta bāze.

24. Paņēmiens saskaņā ar 23. pretenziju, kur bāze ir K₂CO₃, KHCO₃, Na₂CO₃, NaHCO₃, Na₃PO₄ vai Na₂HPO₄.

25. Paņēmiens saskaņā ar 24. pretenziju, kur bāze ir K₂CO₃.

26. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 25. pretenzijai, kur sadalīšanas līdzekļa daudzums ir diapazonā no 0,5 līdz 1,5 ekvivalentiem, kas ir aprēķināts attiecībā uz 6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola stereoizomēru formu, kas ir maisījumā saskaņā ar a), summu.

27. Paņēmiens saskaņā ar 25. pretenziju, kur sadalīšanas līdzekļa daudzums ir 1 ekvivalents, kas ir aprēķināts attiecībā uz 6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola stereoizomēru formu, kas ir maisījumā saskaņā ar stadiju a), summu.

28. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 27. pretenzijai, kur 6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola stereoizomēru formu maisījums ir maisījums, kur dominējoši ir (alfaS,betaR)-6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola un (alfaR,betaS)-6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola racēmiskais maisījums.

29. Paņēmiens (alfaS,betaR)-6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola izolēšanai no 6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola stereoizomēru formu maisījuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 28. pretenzijai, kur stereoizomēru formu maisījums tiek iegūts ar:

a) 3-benzil-6-brom-2-metoksihinolīna pakļaušanu reakcijai ar litija diizopropilamīdu un (3-dimetilamino)-1'-propionaftonu piemērotā šķīdinātājā, kam seko piemērotas skābes pievienošana.

30. Paņēmiens (alfaS,betaR)-6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola izolēšanai no 6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola stereoizomēru formu maisījuma saskaņā ar 28. pretenziju, kur stereoizomēru formu maisījums tiek iegūts ar:

a) 3-benzil-6-brom-2-metoksihinolīna pakļaušanu reakcijai ar litija diizopropilamīdu un (3-dimetilamino)-1'-propionaftonu piemērotā šķīdinātājā, kam seko piemērotas skābes pievienošana;

b) stadijā a) iegūtā maisījuma bagātināšanu ar (alfaS,betaR)-6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola un (alfaR,betaS)-6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola racēmisko maisījumu, atšķēlot (alfaS,betaS)-6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola un (alfaR,betaR)-6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola racēmisko maisījumu no reakcijas maisījuma.

31. Paņēmiens saskaņā ar 30. pretenziju, kur stereoizomēru formu maisījums tiek iegūts ar:

a) 3-benzil-6-brom-2-metoksihinolīna pakļaušanu reakcijai ar litija diizopropilamīdu un (3-dimetilamino)-1'-propionaftonu piemērotā šķīdinātājā, kam seko piemērotas skābes pievienošana;

b) stadijā a) iegūtā maisījuma bagātināšanu ar (alfaS,betaR)-6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola un (alfaR,betaS)-6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola racēmisko maisījumu, atšķēlot (alfaS,betaS)-6-brom-alfa-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-alfa-1-naftalinil-beta-fenil-3-hinolīnetanola un (alfaR,betaR)-

6-brom-*alfa*-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-*alfa*-1-naftalīnīl-*beta*-fenil-3-hinolīnetanola racēmisko maisījumu no reakcijas maisījuma; un c) iegūto 6-brom-*alfa*-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-*alfa*-1-naftalīnīl-*beta*-fenil-3-hinolīnetanola stereoizomēru formu kristalizēšanu no reakcijas maisījuma, kas iegūts stadijā b) piemērotā šķīdinātājā.

32. Paņēmiens saskaņā ar 31. pretenziju, kur piemērotais šķīdinātājs saskaņā ar stadiju c) ir spirts vai ētera un spirta maisījums.

33. Paņēmiens saskaņā ar 31. pretenziju, kur piemērotais šķīdinātājs saskaņā ar stadiju c) ir spirts.

34. Paņēmiens saskaņā ar 32. vai 33. pretenziju, kur spirts ir etanols.

35. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 29. līdz 34. pretenzijai, kur piemērotais šķīdinātājs saskaņā ar stadiju a) ir apolārs aprotisks šķīdinātājs.

36. Paņēmiens saskaņā ar 35. pretenziju, kur apolārais aprotiskais šķīdinātājs ir ēteris.

37. Paņēmiens saskaņā ar 36. pretenziju, kur ēteris ir tetrahidrofurāns.

38. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 29. līdz 37. pretenzijai, kur stadijas a) reakcija tiek veikta temperatūrā zem 0°C.

39. Sāls ar šādu formulu:

(*alfa*S,*beta*R)-6-brom-*alfa*-[2-(dimetilamino)etil]-2-metoksi-*alfa*-1-naftalīnīl-*alfa*-fenil-3-hinolīnetanol*(11bR)-4-hidroksidinafto[2,1-d:1',2'-f][1,3,2]dioksafosfepīna 4-oksīds.

- (51) **C07K 14/59**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1899454**
 (21) 06764058.1 (22) 04.07.2006
 (43) 19.03.2008
 (45) 30.05.2012
 (31) 05106060 (32) 05.07.2005 (33) EP
 697077 P 06.07.2005 US
 (86) PCT/EP2006/063862 04.07.2006
 (87) WO2007/003640 11.01.2007
 (73) ARES TRADING S.A., Zone Industrielle de l'Ouriettaz, 1170 Aubonne, CH
 (72) FONTA, Jean-Pierre, CH
 DUCOMMUN, Paul, CH
 DEPARIS, Véronique, CH
 (74) Merck Serono SA - Geneva Intellectual Property, 9, chemin des Mines, 1202 Geneva, CH
 Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV

(54) **BEZSERUMA KULTIVĒŠANAS VIDE REKOMBINANTU GONADOTROPĪNU RAŽOŠANAI**
SERUM-FREE CULTURE MEDIUM FOR THE PRODUCTION OF RECOMBINANT GONADOTROPINS

(57) 1. Bezseruma kultivēšanas vides izmantošana rekombinanta dimēra gonadotropīna oksidēto formu satursamazināšanai tā ražošanas procesa laikā, pie kam minētā kultivēšanas vide satur antioksidantu, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

- L-glutaciona koncentrācijā, kas svārstās robežās no apmēram 1 līdz apmēram 20 mg/l;
- 2-merkaptotetanola koncentrācijā, kas svārstās robežās no apmēram 5 līdz apmēram 15 mg/l;
- L-metionīna koncentrācijā, kas svārstās robežās no apmēram 200 līdz apmēram 400 mg/l un
- askorbīnskābes koncentrācijā, kas svārstās robežās no apmēram 10 līdz apmēram 50 mg/l, un (+)-*alfa*-tokoferola koncentrācijā, kas svārstās robežās no apmēram 5 līdz apmēram 25 mg/l, kombinācijas.

2. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam minētais antioksidants ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

- L-glutaciona koncentrācijā apmēram 3 mg/l;
- 2-merkaptotetanola koncentrācijā apmēram 10 mg/l;
- L-metionīna koncentrācijā apmēram 250 mg/l un
- askorbīnskābes koncentrācijā apmēram 30 mg/l un (+)-*alfa*-tokoferola koncentrācijā apmēram 14 mg/l kombinācijas.

3. Izmantošana saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam minētā kultivēšanas vide ir vide ar noteiktu ķīmisko sastāvu.

4. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, pie kam minētā kultivēšanas vide ir izvēlēta no grupas, kas sastāv

no SFM 90, SFM 90.1, SupMed300, DMEM, DMEM/F12, SFM CHO 3a, CHP PFM, ProCHO 5, EX-CELL, CHO-CD3, CHO III PFM, CHO-S-SFM II, CHO-DHFR, SFM4CHO, Ultra CHO, HyQ PF CHO, HyQ SFX CHO, HyQ CDM4CHO, IS CHO-CD, IS CHO-V un to atvasinājumiem.

5. Izmantošana saskaņā ar 4. pretenziju, pie kam minētais dimērais gonadotropīns ir folikulstimulējošais hormons (FSH).

6. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, pie kam minētais rekombinantais dimērais gonadotropīns tiek producēts Ķīnas kāmjā olnīcu (CHO) šūnās.

- (51) **A61K 31/198**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1909782**
A61K 31/385⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 15/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 15/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 15/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 06776605.5 (22) 04.08.2006
 (43) 16.04.2008
 (45) 16.05.2012
 (31) 05107206 (32) 04.08.2005 (33) EP
 (86) PCT/EP2006/007733 04.08.2006
 (87) WO2007/017191 15.02.2007
 (73) Encrypta GmbH, Stichelfeldstrasse 3, 61350 Bad Homburg vor der Höhe, DE
 (72) WESSEL, Klaus, DE
 (74) Hrovat, Andrea Darinka, FUCHS Patentanwälte, Westhafenplatz 1, 60327 Frankfurt am Main, DE
 Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
 (54) **ARGINĪNU UN R-ALFA-LIPOSKĀBI SATUROŠAS KOMPOZĪCIJAS UN TO IZMANTOŠANA SEKSUĀLĀS FUNKCIJAS UZLABOŠANAI**
COMPOSITIONS COMPRISING ARGININE AND R-ALPHA-LIPOIC ACID AND THEIR USE FOR IMPROVEMENT OF SEXUAL FUNCTION

(57) 1. Šķidrā, perorāli lietojama kompozīcija, kas satur arginīnu un R- α -liposkābi, kur arginīns ir pārākumā, rēķinot uz kompozīcijā esošās R- α -liposkābes molāro daudzumu.

2. Kompozīcija saskaņā ar vienu vai vairākām no iepriekšējām pretenzijām, kur pārākums ir 2,1 līdz 50 reizes lielāks par R- α -liposkābes molāro daudzumu.

3. Kompozīcija saskaņā ar vienu vai vairākām no iepriekšējām pretenzijām, kur katjonu arginīna pārākums attiecībā pret anjonu R- α -liposkābi ir kompensēts ar papildu anjonu sāls sastāvdaļām.

4. Kompozīcija saskaņā ar vienu vai vairākām no iepriekšējām pretenzijām, kur arginīna daudzums ir no 200 mg līdz 15 g un R- α -liposkābes daudzums ir no 25 mg līdz 1200 mg.

5. Kompozīcija saskaņā ar vienu vai vairākām no iepriekšējām pretenzijām, kur arginīna daudzums ir no 500 mg līdz 10 g un R- α -liposkābes daudzums ir no 55 mg līdz 1200 mg.

6. Kompozīcija saskaņā ar vienu vai vairākām no iepriekšējām pretenzijām, kur arginīns ir L-arginīns.

7. Kompozīcija saskaņā ar vienu vai vairākām no iepriekšējām pretenzijām, kur tā satur papildu sāls sastāvdaļu.

8. Kompozīcija saskaņā ar 7. pretenziju, kur sāls sastāvdaļa ir nelielā pārpalikumā papildus daudzumam, kas ir nepieciešams, lai kompensētu arginīna sārmaino pārpalikumu.

9. Šķidrās, perorāli lietojamas, arginīnu un R- α -liposkābi saturošas kompozīcijas izmantošana, kur arginīns ir pārākumā, rēķinot uz kompozīcijā esošās R- α -liposkābes molāro daudzumu, medikamenta ražošanai vīriešu un sieviešu seksuālās funkcijas uzlabošanai.

10. Izmantošana saskaņā ar 9. pretenziju, kur seksuālā disfunkcija ir erektilā disfunkcija.

11. Izmantošana saskaņā ar 9. pretenziju, kur seksuālā disfunkcija ir libido trūkums gan sievietēm, gan vīriešiem.

12. Izmantošana saskaņā ar vienu vai vairākām no iepriekšējām pretenzijām, kur seksuālās disfunkcijas pamatā ir fiziski cēloņi un/vai psihogēni cēloņi.

13. Izmantošana saskaņā ar 9. un/vai 12. pretenziju, kur seksuālā disfunkcija ir frigiditāte, nespēja sasniegt orgasmu vai orgasma aizture, ģenitāliju sensorie traucējumi, *ejaculatio praecox*,

nepieņemami īss seksuālā akta ilgums, salivācijas trūkums, samazināta vai trūkstosa klitora erekcija vai uzbudināmība un samazināta labiālā un vaginālā hiperēmija.

- (51) **C07D 417/14**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1928872**
C07D 403/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 207/46⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/506⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/4015⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/404⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 35/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 06793379.6 (22) 08.09.2006
(43) 11.06.2008
(45) 14.03.2012
(31) 05108728 (32) 21.09.2005 (33) EP
(86) PCT/EP2006/066197 08.09.2006
(87) WO2007/039404 12.04.2007
(73) 4SC AG, Am Klopferspitz 19 a, 82152 Planegg - Martinsried, DE
(72) MAIER, Thomas, DE
BECKERS, Thomas, DE
HUMMEL, Rolf-Peter, DE
FETH, Martin, DE
MÜLLER, Matthias, DE
BÄR, Thomas, DE
VOLZ, Jürgen, DE
(74) Kilger, Ute, et al, Forrester & Boehmert, Pettenkoferstrasse 20-22, 80336 München, DE
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
(54) **JAUNI SULFONILPIROLI KĀ HDAC INHIBITORI NOVEL SULPHONYLPYRROLES AS INHIBITORS OF HDAC**
(57) 1. Savienojuma, kas izvēlēts no:
(E)-3-[1-(bifenil-4-sulfonyl)-1H-pirol-3-il]-N-hidroksi-akrilamīda,
(E)-N-hidroksi-3-(1-[4-((2-(1H-indol-2-il)-etil)-metil-amino)-metil]-benzolsulfonyl]-1H-pirol-3-il)-akrilamīda,
(E)-3-[1-(4-dimetilaminometil-benzolsulfonyl)-1H-pirol-3-il]-N-hidroksi-akrilamīda un
(E)-N-hidroksi-3-[1-(5-piridin-2-il-tiofēn-2-sulfonyl)-1H-pirol-3-il]-akrilamīda, sāls ar skābi, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no: bromūdeņražskābes, fosforskābes, slāpekļskābes, sērskābes, etiķskābes, citronskābes, D-glikonskābes, benzoskābes, 2-(4-hidroksibenzoil)benzoskābes, sviestskābes, sulfosalicilskābes, maleīnskābes, laurīnskābes, ābolskābes, piemēram, (-)-L-ābolskābes vai (+)-D-ābolskābes, fumārskābes, dzintarskābes, skābeņskābes, vīnskābes, piemēram, (+)-L-vīnskābes vai (-)-D-vīnskābes vai mezovīnskābes, embonskābes, stearīnskābes, toluolsulfonskābes, metānsulfonskābes, 3-hidroksi-2-naftoskābes, adipīnskābes, L-askorbīnskābes, L-asparagīnskābes, benzolsulfonskābes, 4-acetamido-benzoskābes, (+)-kamparskābes, (+)-kampir-10-sulfonskābes, kaprīliskābes (oktānskābes), dodecilsulfonskābes, etān-1,2-disulfonskābes, etānsulfonskābes, 2-hidroksi-etānsulfonskābes, skudrskābes, galaktārskābes, gēntezīnskābes, D-glikoheptonskābes, D-glukuronskābes, glutamīnskābes, 2-okso-glutārskābes, hipūrskābes, pienskābes, piemēram, D-pienskābes vai L-pienskābes, malonskābes, mandeļskābes, piemēram, (+)-mandeļskābes vai (-)-mandeļskābes, naftalīn-1,5-disulfonskābes, naftalīn-2-sulfonskābes, nikotīnskābes, palmitīnskābes, piroglutamīnskābes, piemēram, L-piroglutamīnskābes, jodūdeņražskābes, ciklamīnskābes, tiociānskābes, 2,2-dihlor-etiķskābes, glicerofosforskābes, 1-hidroksi-2-naftoskābes, salicilskābes, 4-aminosalicilskābes, glikolskābes, oleīnskābes, glutārskābes, kanēļskābes, kapronskābes, izosviestskābes, propionskābes, kaprīnskābes, undecilēnskābes un orotskābes,
vai ar bāzi, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no: nātrija sāls, guanidīnija sāls, litija sāls, magnija sāls, kalcija sāls, kālija sāls, dzelzs sāls, amonija sāls un trietilamonija sāls;
vai tā hidrāts.
2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir (E)-3-[1-(4-dimetilaminometil-benzolsulfonyl)-1H-pirol-3-il]-N-hidroksi-akrilamīda sāls ar jebkuru skābi, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no: fosforskābes, sērskābes, etiķskābes, citronskābes, maleīnskābes, fumārskābes, dzintarskābes, skābeņskābes, stearīnskābes, laurīn-

skābes, metānsulfonskābes, L-askorbīnskābes, L-asparagīnskābes, etānsulfonskābes, glutamīnskābes, pienskābes, piemēram, D-pienskābes vai L-pienskābes, malonskābes, ciklamīnskābes, salicilskābes, kapronskābes, glutārskābes, palmitīnskābes, toluolsulfonskābes, benzolsulfonskābes un naftalīn-2-sulfonskābes, vai ar bāzi, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no: nātrija sāls, guanidīnija sāls, magnija sāls, kalcija sāls, amonija sāls un trietilamonija sāls;
vai tā hidrāts.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir (E)-3-[1-(4-dimetilaminometil-benzolsulfonyl)-1H-pirol-3-il]-N-hidroksi-akrilamīda pievienotās skābes sāls ar jebkuru skābi, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no: fosforskābes, sērskābes, etiķskābes, citronskābes, maleīnskābes, fumārskābes, dzintarskābes, skābeņskābes, toluolsulfonskābes un metānsulfonskābes; vai tā hidrāts.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir (E)-3-[1-(4-dimetilaminometil-benzolsulfonyl)-1H-pirol-3-il]-N-hidroksi-akrilamīda pievienotās skābes sāls ar jebkuru skābi, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no: benzolsulfonskābes, etānsulfonskābes, glutamīnskābes, malonskābes, naftalīn-2-sulfonskābes, salicilskābes, kapronskābes, glutārskābes un palmitīnskābes; vai tā hidrāts.

5. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir (E)-3-[1-(4-dimetilaminometil-benzolsulfonyl)-1H-pirol-3-il]-N-hidroksi-akrilamīda pievienotās skābes sāls ar jebkuru skābi, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no: fosforskābes, maleīnskābes, skābeņskābes, malonskābes un metānsulfonskābes; vai tā hidrāts.

6. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir (E)-3-[1-(4-dimetilaminometil-benzolsulfonyl)-1H-pirol-3-il]-N-hidroksi-akrilamīda pievienotās skābes sāls ar jebkuru skābi, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no: metānsulfonskābes, p-toluolsulfonskābes, benzolsulfonskābes, etānsulfonskābes, naftalīn-2-sulfonskābes un palmitīnskābes; vai tā hidrāts.

7. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir (E)-3-[1-(4-dimetilaminometil-benzolsulfonyl)-1H-pirol-3-il]-N-hidroksi-akrilamīda pievienotās skābes sāls ar metānsulfonskābi; vai tā hidrāts.

8. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir (E)-3-[1-(4-dimetilaminometil-benzolsulfonyl)-1H-pirol-3-il]-N-hidroksi-akrilamīda mezilāts.

9. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir (E)-N-hidroksi-3-[1-(5-piridin-2-il-tiofēn-2-sulfonyl)-1H-pirol-3-il]-akrilamīda pievienotās skābes sāls ar jebkuru skābi, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no: metānsulfonskābes, etānsulfonskābes, toluolsulfonskābes, benzolsulfonskābes un naftalīn-2-sulfonskābes; vai tā hidrāts.

10. Savienojuma sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kuru izmanto slimību ārstēšanā.

11. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojuma sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai kopā ar parastiem farmaceutiskiem atšķaidītājiem, pildvielām un/vai nesējiem.

12. Cieta farmaceutiska zāļu forma, kas satur savienojuma sāli saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai.

13. Savienojuma sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai izmantošana farmaceutisko kompozīciju ražošanai labdabīgas vai ļaundabīgas neoplāzijas, piemēram, vēža ārstēšanai, profilaksei vai tā stāvokļa uzlabošanai.

14. Savienojuma sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kuru izmanto labdabīgas vai ļaundabīgas norises hiperproliferatīvo slimību un/vai traucējumu, kas reaģē uz apoptozes inducēšanu, piemēram, labdabīgas vai ļaundabīgas neoplāzijas, piemēram, vēža ārstēšanas, profilakses vai tā stāvokļa uzlabošanas pagēmiēnā pacientam.

15. Savienojuma sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kuru izmanto slimību, kas reaģē uz histonu deacetilāzes aktivitātes inhibēšanu vai kas ir jutīga pret to, ārstēšanas pagēmiēnā pacientam.

16. Kombinācija, kas ietver: pirmo aktīvo ingredientu, kas ir vismaz viens savienojuma sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, un otro aktīvo ingredientu, kas ir vismaz viens pretvēža līdzeklis, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no pretvēža ķīmijterapietiskiem līdzekļiem un mērķorientētiem pretvēža līdzekļiem, atsevišķai, secīgai, vienlaicīgai, sakrītošai vai hronoloģiski regulētai izmantošanai ārstēšanas terapijā, piemēram, labdabīgas vai ļaundabīgas neoplāzijas, piemēram, vēža ārstēšanas terapijā.

17. Savienojuma sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kuru izmanto hiperproliferatīvo slimību un/vai traucējumu, kas reaģē uz apoptozes inducēšanu, piemēram, labdabīgas vai ļaundabīgas neoplāzijas, piemēram, vēža ārstēšanas, profilakses vai tā stāvokļa uzlabošanas paņēmienā pacientam, kurā ietilpst: pirmā aktīvā ingredienta, kas ir savienojuma sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, daudzuma un vismaz viena otrā aktīvā ingredienta daudzuma atsevišķa, secīga, vienlaicīga, sakrītoša vai hronoloģiski regulēta ievadīšana minētajam pacientam, kam šī ārstēšana ir nepieciešama, pie tam minētais otrais aktīvais savienojums ir pretvēža līdzeklis, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no pretvēža ķīmijterapeitiskiem līdzekļiem un mērķorientētiem pretvēža līdzekļiem, kur pirmā aktīvā savienojuma un minētā otrā aktīvā savienojuma daudzumi dod terapeitisku efektu.

18. Savienojuma sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kuru izmanto paņēmienā saskaņā ar 17. pretenziju, kurā minētie pretvēža ķīmijterapeitiskie līdzekļi ir izvēlēti no:

- (i) alkilējošiem/karbamilējošiem līdzekļiem, ieskaitot ciklofosfamīdu, ifosfamīdu, tiotepu, melfalanu un hloretilnitrozourīnvielu;
- (ii) platīna atvasinājumiem, ieskaitot cisplatīnu, oksaliplatīnu, satraplatīnu un karboplatīnu;
- (iii) antimetaboliskiem līdzekļiem/tubulīna inhibitoriem, ieskaitot vinka alkaloidus, piemēram, vinkristīnu, vinblastīnu vai vinorelbīnu, taksānus, piemēram, paklitakselu, docetakselu, un to analogus, kā arī sastāvus un konjugātus, un epotilonus, piemēram, epotilonu B, azaepotilonu vai ZK-EPO;
- (iv) topoizomerāzes inhibitoriem, ieskaitot antraciklīnus, piemēram, doksorubicīnu, epipodofilotoksīnus, piemēram, etopozīdu, un kamptotecīnu un kamptotecīna analogus, piemēram, irinotekānu vai topotekānu;
- (v) pirimidīna antagonistiem, ieskaitot 5-fluoruracilu, kapecitabīnu, arabinozilcitozīnu/citarabīnu un gemcitabīnu;
- (vi) purīna antagonistiem, ieskaitot 6-merkaptopurīnu, 6-tioguanīnu un fludarabīnu; un
- (vii) folijskābes antagonistiem, ieskaitot metotreksātu un pemetreksedu.

19. Savienojuma sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kuru izmanto paņēmienā saskaņā ar 17. vai 18. pretenziju, kurā minētie mērķorientētie pretvēža līdzekļi ir izvēlēti no:

- (i) kināzes inhibitoriem, ieskaitot imatinibu, ZD-1839/gefitinibu, BAY43-9006/sorafenibu, SU11248/sunitinibu, OSI-774/erlotinibu, dasatinibu, lapatinibu, vatalanibu, vandetanibu un pazopanibu;
- (ii) proteasomu inhibitoriem, ieskaitot PS-341/bortezomibu;
- (iii) histonu deacetilāzes inhibitoriem, ieskaitot SAHA, PDX101, MS275, MGCD0103, depsipectīdu/FK228, NVP-LBH589, NVP-LAQ824, valprojskābi (VPA) un butirātus;
- (iv) karstuma šoka proteīna 90 inhibitoriem, ieskaitot 17-alilaminogeldanamicīnu (17-AAG);
- (v) vaskulārajiem mērķa līdzekļiem, ieskaitot kombretastatīna A4 fostātu un AVE8062/AC7700, un antiangiogēniem zāļu preparātiem, ieskaitot VEGF anti vielas, piemēram, bevacizumabu, un KDR tipozīnkīnāzes inhibitoriem, piemēram, PTK787/ZK222584 (vatalaniba), vandetaniba vai pazopaniba;
- (vi) monoklonālām antivielām, ieskaitot trastuzumabu, rituksimābu, alemtuzumabu, tositumomabu, cetuximābu, bevacizumabu un panitumomabu, kā arī monoklonālo antivielu mutantiem un konjugātiem, piemēram, gemtuzumaba ozogamicīna vai ibritumomaba tiuksetāna, un antivielu fragmentiem;
- (vii) terapeitiskiem līdzekļiem uz oligonukleotīdu bāzes, ieskaitot G-3139/oblimersēnu;
- (viii) Toll-līdzīga receptora/TLR 9 agonistiem, ieskaitot Promune®, TLR 7 agonistiem līdzīga imikvimoda un izatoribina un to analogiem vai TLR 7/8 agonistiem, ieskaitot rezikvimodu, kā arī imūnstimulējošās RNS kā TLR 7/8 agonistiem;
- (ix) proteāžu inhibitoriem;
- (x) hormonāliem terapeitiskiem preparātiem, ieskaitot antiestrogēnus, piemēram, tamoksifēnu vai raloksifēnu, antiandrogēnus, piemēram, flutamīdu vai kazodeksu, LHRH analogiem, piemēram, luprolīdu, goserelīnu vai triptorelīnu un aromatāzes inhibitoriem; bleomicīna; retinoīdiem, ieskaitot pilnīgi trans-retinoīdskābi (ATRA); DNS metiltransferāzes inhibitoriem, ieskaitot decitabīna 2-deoksicitidīna atvasinājumu un 5-azacitidīnu; alanozīna; citokīniem, ieskaitot interleikīnu-2; interferoniem, ieskaitot interferonu *alfa*2 un *gamma* interferonu un nāves receptora agonistiem, ieskaitot

TRAIL, DR4/5 agonistiskas antivielas, FasL un TNF-R agonistus, piemēram, TRAIL receptora agonistus līdzīgus mapatumumabam vai leksatumumabam.

20. Savienojuma sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kuru izmanto paņēmienā saskaņā ar 17. vai 18. pretenziju, kurā minētie mērķorientētie pretvēža līdzekļi ir izvēlēti no: nāves receptora agonistiem, ieskaitot TRAIL, DR4/5 agonistiskas antivielas, FasL un TNF-R agonistus, piemēram, TRAIL receptora agonistus līdzīgus mapatumumabam vai leksatumumabam.

21. Savienojuma sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kuru izmanto paņēmienā saskaņā ar jebkuru no 14. līdz 17. pretenzijai, kurā minētais vēzis ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

krūts dziedera vēža, urīnpūšļa vēža, kaulu vēža, smadzeņu vēža, centrālās un perifērās nervu sistēmas vēža, resnās zarnas vēža, endokrīno dziedzeru vēža, barības vada vēža, endometrija vēža, germinogēna vēža, galvas un kakla vēža, nieru vēža, aknu vēža, plaušu vēža, balsenes un rīkles apakšējās daļas (*hipofarinksa*) vēža, mezoteliomas, sarkomas, olnīcu vēža, aizkuņģa dziedera vēža, prostatas vēža, taisnās zarnas vēža, nieru vēža, tievās zarnas vēža, mīksto audu vēža, sēklinieka vēža, kuņģa vēža, ādas vēža, urīnvada vēža, maksts un vulvas vēža; pārmantotiem vēžiem, retinoblastomas un Vilmsa audzēja; leukēmijas, limfomas, ne-Hodžkina slimības, hroniskas un akūtas mieloīdas leukēmijas, akūtas limfoblastiskas leukēmijas, Hodžkina slimības, multiplās mielomas un T-šūnu limfomas; mielodisplastiskā sindroma, plazmas šūnu neoplāzijas, paraneoplastiskajiem sindromiem, nezināmas primāras lokalizācijas vēžiem un AIDS, kas saistīts ar malignizāciju.

22. Izmantošana saskaņā ar 13. pretenziju, kurā minētais vēzis ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no: krūts dziedera vēža, urīnpūšļa vēža, kaulu vēža, smadzeņu vēža, centrālās un perifērās nervu sistēmas vēža, resnās zarnas vēža, endokrīno dziedzeru vēža, barības vada vēža, endometrija vēža, germinogēna vēža, galvas un kakla vēža, nieru vēža, aknu vēža, plaušu vēža, balsenes un rīkles apakšējās daļas (*hipofarinksa*) vēža, mezoteliomas, sarkomas, olnīcu vēža, aizkuņģa dziedera vēža, prostatas vēža, taisnās zarnas vēža, nieru vēža, tievās zarnas vēža, mīksto audu vēža, sēklinieka vēža, kuņģa vēža, ādas vēža, urīnvada vēža, maksts un vulvas vēža; pārmantotiem vēžiem, retinoblastomas un Vilmsa audzēja; leukēmijas, limfomas, ne-Hodžkina slimības, hroniskas un akūtas mieloīdas leukēmijas, akūtas limfoblastiskas leukēmijas, Hodžkina slimības, multiplās mielomas un T-šūnu limfomas; mielodisplastiskā sindroma, plazmas šūnu neoplāzijas, paraneoplastiskajiem sindromiem, nezināmas primāras lokalizācijas vēžiem un AIDS, kas saistīts ar malignizāciju.

23. Kombinācija saskaņā ar 16. pretenziju, kurā minētie pretvēža ķīmijterapeitiskie līdzekļi ir izvēlēti no:

- (i) alkilējošiem/karbamilējošiem līdzekļiem, ieskaitot ciklofosfamīdu, ifosfamīdu, tiotepu, melfalanu un hloretilnitrozourīnvielu;
- (ii) platīna atvasinājumiem, ieskaitot cisplatīnu, oksaliplatīnu, satraplatīnu un karboplatīnu;
- (iii) antimetaboliskiem līdzekļiem/tubulīna inhibitoriem, ieskaitot vinka alkaloidus, piemēram, vinkristīnu, vinblastīnu vai vinorelbīnu, taksānus, piemēram, paklitakselu, docetakselu, un to analogus, kā arī sastāvus un konjugātus, un epotilonus, piemēram, epotilonu B, azaepotilonu vai ZK-EPO;
- (iv) topoizomerāzes inhibitoriem, ieskaitot antraciklīnus, piemēram, doksorubicīnu, epipodofilotoksīnus, piemēram, etopozīdu, un kamptotecīnu un kamptotecīna analogus, piemēram, irinotekānu vai topotekānu;
- (v) pirimidīna antagonistiem, ieskaitot 5-fluoruracilu, kapecitabīnu, arabinozilcitozīnu/citarabīnu un gemcitabīnu;
- (vi) purīna antagonistiem, ieskaitot 6-merkaptopurīnu, 6-tioguanīnu un fludarabīnu; un
- (vii) folijskābes antagonistiem, ieskaitot metotreksātu un pemetreksedu.

24. Kombinācijas saskaņā ar 16. pretenziju, kurā minētie mērķorientētie pretvēža līdzekļi ir izvēlēti no:

- (i) kināzes inhibitoriem, ieskaitot imatinibu, ZD-1839/gefitinibu, BAY43-9006/sorafenibu, SU11248/sunitinibu, OSI-774/erlotinibu, dasatinibu, lapatinibu, vatalanibu, vandetanibu un pazopanibu;
- (ii) proteasomu inhibitoriem, ieskaitot PS-341/bortezomibu;

(iii) histonu deacetilāzes inhibitoriem, ieskaitot SAHA, PXD101, MS275, MGCDO103, depsipectīdu/FK228, NVP-LBH589, NVP-LAQ824, valprojskābi (VPA) un butirātus;

(iv) karstuma šoka proteīna 90 inhibitoriem, ieskaitot 17-alilami-nogeldanamicīnu (17-AAG);

(v) vaskulārajiem mērķa līdzekļiem, ieskaitot kombretastafīna A4 fostātu un AVE8062/AC7700, un antiangiogēniem zāļu preparātiem, ieskaitot VEGF antivielas, piemēram, bevacizumabu, un KDR tipzīnkināzes inhibitoriem, piemēram, PTK787/ZK222584 (vatalaniba), vandetaniba vai pazopaniba;

(vi) monoklonālām antivielām, ieskaitot trastuzumabu, rituksimabu, alemtuzumabu, tositumomabu, cetuximabu, bevacizumabu un panitumomabu, kā arī monoklonālo antivielu mutantiem un konjugātiem, piemēram, gemtuzumaba ozogamicīna vai ibritumomaba tiuksetāna, un antivielu fragmentiem;

(vii) terapeitiskiem līdzekļiem uz oligonukleotīdu bāzes, ieskaitot G-3139/oblimersēnu;

(viii) Toll-līdzīga receptora/TLR 9 agonistiem, ieskaitot Promune®, TLR 7 agonistiem līdzīga imikvimoda un izatoribina un to analogiem vai TLR 7/8 agonistiem, ieskaitot rezikvimodu, kā arī imūnstimulējošās RNS kā TLR 7/8 agonistiem;

(ix) proteāžu inhibitoriem;

(x) hormonāliem terapeitiskiem preparātiem, ieskaitot antiestrogēnus, piemēram, tamoksifēnu vai raloksifēnu, antiandrogēnus, piemēram, flutamīdu vai kazodeksu, LHRH analogiem, piemēram, luprolīdu, goserelīnu vai triptorelīnu un aromatāzes inhibitoriem; bleomicīna; retinoīdiem, ieskaitot pilnīgi trans-retinoīdskābi (ATRA); DNS metiltransferāzes inhibitoriem, ieskaitot decitabīna 2-deoksicitidīna atvasinājumu un 5-azacitidīnu; alanozīna; citokīniem, ieskaitot interleikīnu-2; interferoniem, ieskaitot interferonu *alfa*2 un *gamma* interferonu un nāves receptora agonistiem, ieskaitot TRAIL, DR4/5 agonistiskas antivielas, FasL un TNF-R agonistus, piemēram, TRAIL receptora agonistus līdzīgus mapatumumabam vai leksatumumabam.

25. Kombinācija saskaņā ar 16. pretenziju, kurā minētie mērķorientētie pretvēža līdzekļi ir izvēlēti no: nāves receptora agonistiem, ieskaitot TRAIL, DR4/5 agonistiskas antivielas, FasL un TNF-R agonistus, piemēram, TRAIL receptora agonistus līdzīgus mapatumumabam vai leksatumumabam.

26. Kombinācija saskaņā ar 16. pretenziju, kurā minētais vēzis ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no: krūts dziedzera vēža, urīnpūšļa vēža, kaulu vēža, smadzeņu vēža, centrālās un perifērās nervu sistēmas vēža, resnās zarnas vēža, endokrīno dziedzeru vēža, barības vada vēža, endometrija vēža, germinogēna vēža, galvas un kakla vēža, nieru vēža, aknu vēža, plaušu vēža, balsenes un rīkles apakšējās daļas (*hipofarinks*) vēža, mezoteliomas, sarkomas, olnīcu vēža, aizkuņģa dziedzera vēža, prostatas vēža, taisnās zarnas vēža, nieru vēža, tievās zarnas vēža, mīksto audu vēža, sēklinieka vēža, kuņģa vēža, ādas vēža, urīnvada vēža, maksts un vulvas vēža; pārmantotiem vēžiem, retinoblastomas un Vilmsa audzēja; leukēmijas, limfomas, ne-Hodžkina slimības, hroniskas un akūtas mieloidas leukēmijas, akūtas limfoblastiskas leukēmijas, Hodžkina slimības, multiplās mielomas un T-šūnu limfomas; mielodisplastiskā sindroma, plazmas šūnu neoplāzijas, paraneoplastiskajiem sindromiem, nezināmas primāras lokalizācijas vēžiem un AIDS, kas saistīts ar malignizāciju.

(51) **C07K 14/47**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1928903**
 (21) 06792004.1 (22) 12.09.2006
 (43) 11.06.2008
 (45) 30.05.2012
 (31) PCT/EP2005/009782 (32) 12.09.2005 (33) WO
 (86) PCT/EP2006/008882 12.09.2006
 (87) WO2007/031280 22.03.2007
 (73) Xigen S.A., Route de la Corniche 4, 1066 Epalinges, CH
 (72) BONNY, Christophe, CH
 (74) Graf von Stosch, Andreas, et al, Graf von Stosch Patent-anwalts-gesellschaft mbH, Prinzregentenstrasse 22, 80538 München, DE
 Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV

(54) **ŠŪNĀ IEKĻŪT SPĒJĪGI JNK SIGNĀLU TRANSDUKCIJAS CEĻA PEPTĪDU INHIBITORI CELL-PERMEABLE PEPTIDE INHIBITORS OF THE JNK SIGNAL TRANSDUCTION PATHWAY**

(57) 1. JNK inhibitora sekvenca, kas sastāv no retro-invertētas D-aminoskābju sekvences saskaņā ar SEQ ID Nr. 2.

2. JNK inhibitora sekvenca saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam JNK inhibitora sekvenca saistās ar c-Jun aminogala kināzi (JNK).

3. JNK inhibitora sekvenca saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam tad, kad JNK inhibitora sekvenca atrodas JNK ekspresējošā šūnā, JNK inhibitora sekvenca inhibē vismaz viena JNK mērķa transkripcijas faktora aktivāciju.

4. JNK inhibitora sekvenca saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, pie kam JNK mērķa transkripcijas faktors ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no c-Jun, ATF2 un E1kl.

5. JNK inhibitora sekvenca saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, pie kam tad, kad JNK ekspresējošā šūnā atrodas peptīds, JNK inhibitora sekvenca izmaina JNK iedarbību.

6. Himērs peptīds, kas sastāv no pirmā domēna un otrā domēna, kuri ir saistīti ar kovalentu saiti, pie kam pirmais domēns satur transportsekvenci un otrais domēns sastāv no JNK inhibitora sekvences saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, pie tam pirmais domēns ir saistīts pie otrā domēna C-gala.

7. Peptīds saskaņā ar 6. pretenziju, pie kam transportsekvence satur cilvēka imūndeficīta vīrusa TAT polipeptīda aminoskābju sekvenci.

8. Peptīds saskaņā ar 6. vai 7. pretenziju, pie kam transportsekvence satur SEQ ID Nr. 5 vai 7 L aminoskābju sekvenci vai retro-invertētu D-aminoskābju sekvenci saskaņā ar SEQ ID Nr. 6 vai 8.

9. Peptīds saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 8. pretenzijai, pie kam transportsekvences pastiprina peptīda uzkrāšanos šūnās.

10. Peptīds saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 9. pretenzijai, pie kam transportsekvence vada peptīda lokalizēšanu kodolā.

11. Peptīds saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 10. pretenzijai, pie kam JNK inhibitora sekvenca satur retro-invertētu D-aminoskābju sekvenci saskaņā ar SEQ ID Nr. 11.

12. Peptīds saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 11. pretenzijai, pie kam peptīds satur retro-invertēto D-aminoskābju sekvenci saskaņā ar SEQ ID Nr. 11 vai sastāv no tās.

13. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur JNK inhibitora sekvenci, kas sastāv no sekvences saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, vai himēro peptīdu saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 12. pretenzijai un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

14. JNK inhibitora sekvences saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai vai himērā peptīda saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 12. pretenzijai izmantošana farmaceutiskas kompozīcijas gatavošanai patofizioloģiska stāvokļa ārstēšanai, kas ir izvēlēts no plaušu, krūts dziedzera, limfoidiem, gastrointestinālā un urogenitālā trakta ļaundabīgiem veidojumiem, kā arī adenokarcinomām, ietverot ļaundabīgus veidojumus, tādus kā resnās zarnas vēzis, nieru šūnu karcinoma, prostatas vēzis, nesīkšūnu plaušu karcinoma, tievo zarnu vēzis un barības vada vēzis, kā arī leukoze, vēži ar Bcr-Abl onkogēnām transformācijām, psoriāzes, vienkāršā jeb hroniskā pemfīga, Behčeta sindroma, akūta respiratorā distresa sindroma (ARDS), išēmiskās sirds slimības, pēcdialīzes sindroma, reimatoīdā artrīta, iegūtā imūndeficīta sindroma, vaskulīta, septiskā šoka, restenozes, dzirdes zuduma, auss traumas, išēmijas, triekas, reperfūzijas bojājumiem, hipoksijas, ārstēšanas ar pro-iekaisuma citokīniem izraisītām blakusparādībām, diabēta, sirds un kardiālās hipertrofijas un arteriosklerotiskiem bojājumiem, patoloģiskiem stāvokļiem, kurus izraisījis staru terapijā lietotais jonizējošais starojums un ultravioletais starojums (UV starojums), patoloģiskiem stāvokļiem, kurus izraisījuši DNS bojājoši līdzekļi, ietverot ķīmijterapijas zāles, hypo- un hipertermijas, iekaisuma, autoiekaisuma, imūnām un autoimūnām slimībām, deģeneratīvām slimībām, miopātijām, kardiomiopātijām un transplantāta atgrūšanas.

15. Izmantošana saskaņā ar 14. pretenziju, pie kam farmaceutiskā kompozīcija ir jāievada, izmantojot ievadīšanas ceļu, kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no intraperitoneālā, intranazālā, intravenozā, perorālā ceļa un ievadīšanas ar plākstera palīdzību.

16. Komplekts, kas satur JNK inhibitora sekvenci, kas sastāv no sekvences saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, un/vai himēro peptīdu saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 12. pretenzijai.

- (51) **E02D 5/80⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **1934404**
E21D 21/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
E02D 5/76⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 07784595.6 (22) 26.07.2007
 (43) 25.06.2008
 (45) 04.04.2012
 (31) 13822006 (32) 17.08.2006 (33) AT
 (86) PCT/AT2007/000366 26.07.2007
 (87) WO2008/019409 21.02.2008
 (73) Atlas Copco MAI GmbH, Werkstrasse 17, Postfach 8, 9710 Feistritz/Drau, AT
 (72) TSCHERNUTH, Christof, AT
 NEUHOLD, Martin, AT
 MEIDL, Michael, AT
 (74) Beer, Manfred, et al, BEER & PARTNER PATENTANWÄLTE KG, Lindengasse 8, 1070 Wien, AT
 Artis KROMANIS, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV
 (54) **BERZES CAURULES ENKURS UN TAM PAREDZĒTS IZPLEŠANAS ADAPTERIS**
FRICITION BOLT AND EXPANSION ADAPTOR FOR SAID ANCHOR

(57) 1. Berzes caurules tipa enkurs ar izplešamu cauruli (1), kas raksturīgs ar to, ka izplešamā caurule (1) ir savienota ar apvalku (6), ka ir apvalkveidīga čaula (7), ka apvalks (6), kas ir savienots ar izplešamo cauruli (1), ir ievietots apvalkveidīgajā čaulā (7) un ka apvalkveidīgā čaula (7) tās daļā (14), kas ir pretstāta daļai (13), kas notur apvalku (6) ar izplešamo cauruli (1), ir izveidota, lai tajā izvietotu vēl vienu detaļu.

2. Enkurs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka otrā detaļa ir apvalks (6), kas ir savienots ar berzes caurules enkura izplešamo cauruli (1).

3. Enkurs saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka izplešamās caurules (1) gals, jo īpaši divu izplešamo cauruļu (1) gali, kas ir savienoti ar apvalkiem (6), ir izveidoti vaļējas metinājuma šuves veidā.

4. Enkurs saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka izplešamās caurules (1) gals, jo īpaši abu izplešamo cauruļu (1) gali, kas ir savienoti ar apvalkiem (6), ir izveidoti slēgtas metinājuma šuves veidā.

5. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tai starp apvalkveidīgās čaulas (7) daļām (13, 14) ir apgabals (15) ar palielinātu diametru.

6. Enkurs saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka apvalkveidīgās čaulas (7) apgabals (15), kas ir starp apvalkiem (6), kas ir savienoti ar izplešamajām caurulēm (1), nesatur vītņi.

7. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka apvalkos (6) ir radiāli orientētas atveres (17), pie kam izplešamo cauruļu (1) galos, kas ir savienoti ar apvalku (6), urbūmi ar atverēm (17) ir vienā līmenī (ir salāgoti).

8. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka apvalkveidīgās čaulas (7) daļās (13, 14) ir iekšējās vītņnes.

9. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka apvalkveidīgās čaulas (7) daļās (13, 14) ir apaļvītņnes un ka apvalki (6) ir aprīkoti ar ārējām apaļvītņēm.

10. Enkurs saskaņā ar 9. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka apvalku (6) ārējā apaļvītne un čaulu (7) apaļvītnes ir salāgotas.

11. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka daļās (13, 14) esošās vītņnes ir vītņnes, kas iet vienā un tajā pašā virzienā vai pretējos virzienos, proti, labā vītne un kreisā vītne.

12. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka starp apvalkveida čaulu (7) un vismaz vienu apvalku (6) ir blīve (1).

13. Enkurs saskaņā ar 12. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka blīve ir gredzenveida starplika (11), kas ir ievietota apvalka (6) rievā, pie kam rievā ir atvērta uz āru.

14. Enkurs saskaņā ar 13. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka gredzenveida starpliku (11) ietverošā rievā ir ierīkota tajā apvalka (6) gala apgabalā, kas vērsts prom no izplešamās caurules (1) brīvā gala.

15. Enkurs saskaņā ar 1. un jebkuru no 8. līdz 14. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka zem spiediena esošās vides padevei paredzētais piepūšanas spiediena adapteris (20) ir ievietots apvalkveidīgās čaulas (7) daļā (14), kas ir pretī apvalkveidīgās čaulas (7) daļai (13), kurā ir ievietots apvalks (6), kas ir savienots ar izplešamo cauruli.

16. Enkurs saskaņā ar 15. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka piepūšanas spiediena adapteris (20) ir ieskrūvējams apvalkveidīgās čaulas (7) daļā (14).

17. Enkurs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka minētā vēl viena detaļa ir nostiprinātājskrūve.

18. Enkurs saskaņā ar 17. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka pie izplešamās caurules (1) pievienotajam apvalkam (6) ir ārēja vītne, kas ir ieskrūvējama apvalkveidīgās čaulas (7) daļās (13) iekšējā vītņē.

19. Enkurs saskaņā ar 18. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka apvalkam (6) no ārpuses ir apaļvītne un apvalkveidīgās čaulas (7) daļai (13) ir iekšējā apaļvītne.

20. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 17. līdz 19. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka daļai (14) vai apvalkveidīgajai čaulai (7) ir vītne.

21. Enkurs saskaņā ar 20. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka apgabalā (13) un apvalkveidīgās čaulas (7) daļā (14) esošās vītņnes ir vītņnes, kas ir vērstas vienā virzienā vai pretējos virzienos.

22. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 17. līdz 21. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka apvalks (6) attiecībā pret apvalkveidīgās čaulas (7) daļās (13) iekšējo virsmu ir noblīvēts.

23. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 17. līdz 22. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka starp apvalkveidīgās čaulas (7) daļām (13 un 14) esošais apgabals (15) nav vītņots.

24. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 17. līdz 23. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka starp apvalkveidīgās čaulas (7) daļām (13 un 14) esošais apgabals (15) ir veidots ar palielinātu diametru.

25. Enkurs saskaņā ar 23. vai 24. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka apvalks (6) ar tā galu, kas atrodas apvalkveidīgajā čaulā (7), ir izvietots apgabalā (15).

26. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 17. līdz 25. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka izplešamā caurule (1) ir savienota ar apvalku (6).

27. Enkurs saskaņā ar 26. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka izplešamā caurule (1) ir piemētināta pie apvalka (6).

28. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 17. līdz 27. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka izplešamā caurule (1) tās galā, kas ir savienots ar apvalku (6), ir izveidota vaļējas metinājuma šuves veidā.

29. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 17. līdz 27. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka izplešamā caurule (1) tās galā, kas ir savienots ar apvalku (6), ir izveidota slēgtas metinājuma šuves veidā.

30. Enkurs saskaņā ar 29. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka apvalka (6) sienā ir vismaz viens radiāls urbūms (17).

31. Enkurs saskaņā ar 30. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka izplešamajā caurulē (1) ir atvere, kas ir salāgota ar apvalkā (6) esošo urbūmu (17).

32. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 20. līdz 31. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka viena no apgabals (13 vai 14) esošajām vītņēm ir kreisā vītne un otra ir labā vītne.

33. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 20. līdz 32. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka daļā (14) esošā vītne ir metriskā vītne.

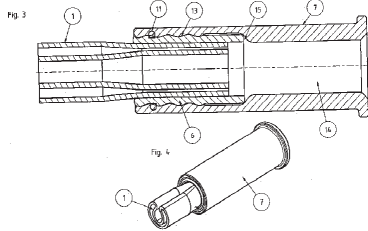
34. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 33. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka metinājums (41), kas noslēdz izplešamo cauruli slēgtas metinājuma šuves veidā, savieno izplešamo cauruli (1) ar apvalku (6).

35. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 34. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka izplešamās caurules (1) slēgtais metinājums (41) ir aprīkots ar vismaz vienu atveri (45), kas ir vērsta uz izplešamās caurules (1) iekšieni.

36. Enkurs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 35. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka izplešamās caurules (1) uz iekšu vērsta atloka gals ir noslēgts.

37. Enkurs saskaņā ar 36. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka izplešamās caurules (1) atloks ir noslēgts ar aizbāzni.

38. Enkurs saskaņā ar 37. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka aizbāznis (43) ir savienots ar izplešamo cauruli (1).



- (51) **A47J 31/10**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1937118**
A47J 31/44⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A47J 31/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A47J 31/60⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 06807061.4 (22) 06.10.2006
(43) 02.07.2008
(45) 20.06.2012
(31) 05109368 (32) 07.10.2005 (33) EP
(86) PCT/EP2006/067165 06.10.2006
(87) WO2007/042485 19.04.2007
(73) Cense d'Almez S.A., Rue d'Almez 5, 1325 Corroy le Grand, BE
(72) VAN BELLEGHEM, Luc, BE
(74) Luys, Marie-José A.H., et al, Gevers Intellectual Property House, Holidaystraat 5, 1831 Diegem, BE
Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV
- (54) **IERĪCE EKSTRAĢĒTU DZĒRIENU PAGATAVOŠANAI
DEVICE FOR PREPARING INFUSED BEVERAGES**

(57) 1. Ierīce (2) ekstrāģētu dzērienu (4) pagatavošanai, kura ietver:

- uzlējuma pagatavošanas konteineru (6), lai tajā noturētu šķidrumu (4), kurš satur atveri (8), kas ļauj šķidrumu (4) izvadīt no konteinerā (6);
- tvertni (10), kura definē dobumu (16) kartridža (12) uzņemšanai, kurš satur ekstrāģējamās vielas (14), pie tam uzlējuma pagatavošanas konteiners (6) un tvertne (10) ir darbināmi viens saistībā ar otru un ir izvietoti pozīcijā, kurā uzlējuma pagatavošanas konteiners (6) un dobums (16) komunicē caur atveri (8);
- atveramu un noslēdzamu kanālu (18), kurš komunicē ar dobumu (16), lai ļautu šķidrumam no uzlējuma pagatavošanas konteinerā (6) ieplūst kanālā (18) caur dobumu (16);
- tīrīšanas līdzekļus šķidruma un/vai tvaika ievadīšanai uzlējuma pagatavošanas konteinerā (6);
- demontāžas līdzekļus, lai no dobuma (16) aizvāktu kartridžu (12),

kas raksturīga ar to, ka tā papildus satur darbināšanas līdzekļus, lai darbinātu tīrīšanas līdzekļus un secīgi darbinātu demontāžas līdzekļus.

2. Ierīce (2) saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam darbināšanas līdzekļi ir pielāgoti tīrīšanas līdzekļu, izvades līdzekļu un vēlreiz atkārtoti tīrīšanas līdzekļu darbināšanai.

3. Ierīce (2) saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas papildus ietver ievades līdzekļus gāzes ievadīšanai uzlējuma pagatavošanas konteinerā (6) caur dobumu (16).

4. Ierīce (2) saskaņā ar 3. pretenziju, pie kam ievades līdzekļi satur izvīrītu sprauslu (112), kas ir izvietota dobumā (18) un ir aprīkota vismaz ar vienu inžekcijas atveri (113) gāzes ievadīšanai.

5. Ierīce (2) saskaņā ar 4. pretenziju, pie kam ierīce satur nolasīšanas līdzekļus (34) dzēriena pagatavošanas parametru automātiskai nolasīšanai no kartridža (12), pie kam pagatavošanas parametri ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no sekojošiem parametriem: uzlējuma pagatavošanas temperatūra, tā pagatavošanas ilgums un, kad notiek gāzes ievadīšana, tās ilgums, kā arī minēto parametru kombinācija.

6. Ierīce (2) saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, pie kam kanāls (18) satur izvades tekni (19), lai ļautu ekstrāģēšanas ceļā pagatavotajam šķidrumam (4) no kanāla (18) ieplūst tieši krūzītē.

7. Ierīce (2) saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, pie kam ierīce papildus satur pirmo palieku konteineru (76), lai savāktu tīrīšanas šķidruma un/vai tvaika (22) paliekas, un otro palieku konteineru (78), lai uzņemtu izmantoto kartridžu (12), kas tiek aizvākts no dobuma (16).

8. Paņēmiens ekstrāģētu dzērienu (4) pagatavošanai ierīcē, kura ietver uzlējuma pagatavošanas konteineru (6) šķidruma (4) noturēšanai un tvertni (10), kura satur dobumu (16), pie kam uzlējuma pagatavošanas konteiners (6) satur atveri (8) šķidruma izplūdei, un paņēmiens ietver sekojošus soļus:

a) kartridža (12), kurš satur ekstrāģējamo materiālu, ievirzīšanu dobumā (16), pie kam kartridžs (12) satur filtru (44), kas ļauj šķidrumam plūst tam cauri;

b) konteinerā (6) un tvertnes (10) uzstādīšanu vienu attiecībā pret otru tādā pozīcijā, ka uzlējuma pagatavošanas konteiners (6) un dobums (16) komunicē viens ar otru caur atveri (8);

c) šķidruma (4) ievadīšanu, lai uzlējuma pagatavošanas konteinerā (6) noritētu ekstrāģēšana tā, ka šķidrumas plūst uz dobumu (16), iegremdējot sevī kartridžā (12) ievietoto ekstrāģējamo materiālu;

d) ierīces (2) kanāla (18) atvēršanu, kurš komunicē ar dobumu (16), lai ļautu ekstrakcijas ceļā iegūtajam šķidrumam (4) ieplūst kanālā (18) no uzlējuma pagatavošanas konteinerā (6) caur dobumu (16) un kartridža (12) filtru (44);

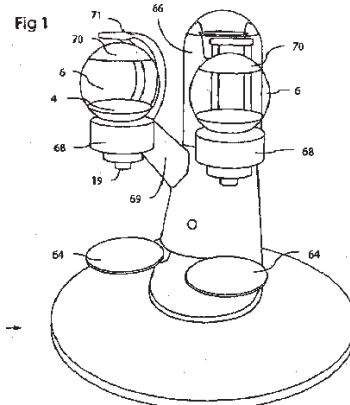
e) šķidruma un/vai tvaika ievadīšanu konteinerā (6), lai veiktu tā tīrīšanu,

kas raksturīgs ar to, ka paņēmiens papildus ietver secīgu soli f), kurā kartridžs (12) tiek aizvākts prom no dobuma (16).

9. Paņēmiens saskaņā ar 8. pretenziju, kas papildus ietver šķidruma un/vai tvaika ievadīšanas soli konteinerā (6).

10. Paņēmiens saskaņā ar 8. vai 9. pretenziju, kurš starp šķidruma (4) ievadīšanas soli uzlējuma pagatavošanai un kanāla (18) atvēršanas soli ietver gāzes ievadīšanas soli uzlējuma pagatavošanas konteinerā dobumā (16).

11. Paņēmiens saskaņā ar 10. pretenziju, pie kam gāzes ievadīšanas soļa izpildes ilgums ir robežās no 50 līdz 80 procentiem vai, vēl labāk, no 60 līdz 70 procentiem no laika, kas paiet no ekstrāģēšanai nepieciešamā šķidruma (4) ievadīšanas soļa beigām līdz kanāla (18) atvēršanas soļa sākumam, un/vai būtībā tūlīt pēc šķidruma (4) ievadīšanas soļa ekstrāģēšanas vajadzībai.



- (51) **F01M 11/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1947302**
F02B 63/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 07122193.1 (22) 03.12.2007
(43) 23.07.2008
(45) 28.03.2012
(31) 1033012 (32) 07.12.2006 (33) NL
(73) B.B.A. Participaties B.V., Zutphenseweg 11, 7382 AJ Klarenbeek, NL
(72) BRUIN, Johannes, NL
(74) Dokter, Hendrik Daniel, Octrooibureau Dokter, P.O. Box 657, 7300 AR Apeldoorn, NL
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV

(54) DĪZĒLMOTORA EĻĻAS TVERTNE, DĪZĒLMOTORS, KAS APRĪKOTS AR ŠĀDU EĻĻAS TVERTNI, UN ŠĀDA DĪZĒLMOTORA IZMANTOŠANA
OIL SUMP FOR A DIESEL ENGINE, DIESEL ENGINE PROVIDED WITH SUCH AN OIL SUMP AND USE OF SUCH A DIESEL ENGINE

(57) 1. Dīzeļmotora (1) eļļas tvertne (2), kura satur iekļūdes atveri (6), līmeņa mēritāja atveri (7) un izplūdes atveri (8), kas raksturīga ar to, ka iekļūdes atvere (6), līmeņa mēritāja atvere (7) un izplūdes atvere (8) dīzeļmotoram (1), kas ir aprīkots ar šo eļļas tvertni (2), iekļūdes atveri (6), līmeņa mēritāja atveri (7) un izplūdes atveri (8), ir izvietotas tādā veidā, ka tās visas ir dīzeļmotora (1) sadales pusē.

2. Eļļas tvertne (2) saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tā ir aprīkota ar eļļas filtru (9) tā, ka dīzeļmotoram (1), kas ir aprīkots ar šo eļļas tvertni (2), eļļas filtrs (9) ir dīzeļmotora (1) sadales pusē.

3. Eļļas tvertne (2) saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tā ir aprīkota ar degvielas filtru (10) tā, ka dīzeļmotoram (1), kas ir aprīkots ar šo eļļas tvertni (2), degvielas filtrs (10) ir dīzeļmotora (1) sadales pusē.

4. Eļļas tvertne (2) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka tā apakšpusē ir aprīkota ar montāžas līdzekļiem (13) eļļas tvertnes (2) nostiprināšanai uz virsmas.

5. Dīzeļmotors (1), kas ir aprīkots ar eļļas tvertni (2) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka kombinācijā ar eļļas tvertni (2) tas veido modulāru struktūru.

6. Dīzeļmotors (1), kas ir aprīkots ar eļļas tvertni (2) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka tas ir izvietots šķidrumsūkņa, kuru darbina ar šo dīzeļmotoru, apvalkā, kurš ir aprīkots ar noslēdzamu atveri, pie kam dīzeļmotora sadales puse ir vērsta noslēdzamās atveres virzienā.

7. Dīzeļmotora (1), kas ir aprīkots ar eļļas tvertni (2) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, izmantošana šķidrumsūkņa darbināšanai.

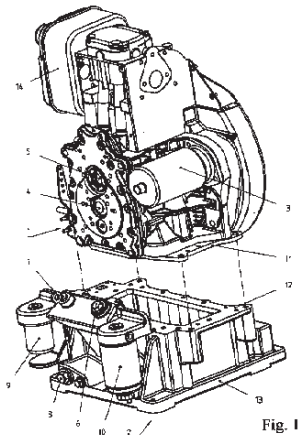


Fig. 1

(54) FARMACEITISKĀ KOMPOZĪCIJA, KAS SATUR DROKSIDOPU
PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS COMPRISING DROXIDOPA

(57) 1. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur droksidopu kopā ar vienu vai vairākiem papildu savienojumiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no katehol-O-metiltransferāzes inhibitoriem, holīnesterāzes inhibitoriem un to kombinācijām, kur droksidopa un viens vai vairāki papildu savienojumi ir kombinēti masas attiecībās no 100:1 līdz 1:2.

2. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur katehol-O-metiltransferāzes inhibitori ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no entakapona, tolkapona, nitekapona un to kombinācijām.

3. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur holīnesterāzes inhibitori ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no piridostigmīna, donepezila, rivastigmīna, galantamīna, takrīna, neostigmīna, metrifonāta, fizostigmīna, ambenonija, demarkarija, tiafizovenīna, fenzerīna, edrofonija, kimzerīna un to kombinācijām.

4. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur viens vai vairāki papildu savienojumi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no entakapona, tolkapona, piridostigmīna, donepezila un to kombinācijām.

5. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur droksidopu kopā ar tolkaponu.

6. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur droksidopu kopā ar piridostigmīnu.

7. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur droksidopu kopā ar entakaponu.

8. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur droksidopu kopā ar donepezilu.

9. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur droksidopa un viens vai vairāki papildu savienojumi ir kombinēti masas attiecībās aptuveni no 50:1 līdz 2:1.

10. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur droksidopu kopā ar vienu vai vairākiem papildu savienojumiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no katehol-O-metiltransferāzes inhibitoriem, holīnesterāzes inhibitoriem un to kombinācijām, kur kompozīcija satur 10 mg līdz 2 g droksidopas un 1 mg līdz 200 mg viena vai vairāku papildu savienojumu.

11. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kas satur 1 mg līdz 200 mg katehol-O-metiltransferāzes inhibitora.

12. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kas satur 1 mg līdz 200 mg holīnesterāzes inhibitora.

13. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kur katehol-O-metiltransferāzes inhibitori ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no entakapona, tolkapona, nitekapona un to kombinācijām.

14. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kur holīnesterāzes inhibitori ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no piridostigmīna, donepezila, rivastigmīna, galantamīna, takrīna, neostigmīna, metrifonāta, fizostigmīna, ambenonija, demarkarija, tiafizovenīna, fenzerīna, edrofonija, kimzerīna un to kombinācijām.

15. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kur viens vai vairāki papildu savienojumi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no entakapona, tolkapona, piridostigmīna, donepezila un to kombinācijām.

16. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kas satur droksidopu kopā ar tolkaponu.

17. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kas satur droksidopu kopā ar piridostigmīnu.

18. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kas satur droksidopu kopā ar entakaponu.

19. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kas satur droksidopu kopā ar donepezilu.

20. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur droksidopu kopā ar vienu vai vairākiem papildu savienojumiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no katehol-O-metiltransferāzes inhibitoriem, holīnesterāzes inhibitoriem un to kombinācijām, kur kombinācija ir paredzēta kā vienas devas vienība.

21. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 20. pretenziju, kur katehol-O-metiltransferāzes inhibitori ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no entakapona, tolkapona, nitekapona un to kombinācijām.

22. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 20. pretenziju, kur holīnesterāzes inhibitori ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no

- (51) **A61K 31/198**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1948155**
A61P 9/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/275⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/27⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/15⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 07784556.8 (22) 28.06.2007
- (43) 30.07.2008
- (45) 07.03.2012
- (31) 806036 P (32) 28.06.2006 (33) US
- (86) PCT/US2007/072334 28.06.2007
- (87) WO2008/003028 03.01.2008
- (73) Chelsea Therapeutics Inc., 3530 Toringdon Way, Charlotte, NC 28277, US
- (72) ROBERTS, Michael, J., US
 PEDDER, Simon, US
- (74) Orès, Bernard, et al, Cabinet ORES, 36, rue de St Pétersbourg, 75008 Paris, FR
 Ludmila IVANOVA, Patentu aģentūra TESIO, Kronvalda bulv. 3, Rīga LV-1010, LV

piridostigmīna, donepezila, rivastigmīna, galantamīna, takrīna, neostigmīna, metrifonāta, fizostigmīna, ambenonija, demarkarija, tiafzovenīna, fenzerīna, edrofonija, kimzerīna un to kombinācijām.

23. Farmaceitiska kompozīcija saskaņā ar 20. pretenziju, kur viens vai vairāki papildu savienojumi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no entakapona, tolkapona, piridostigmīna, donepezila un to kombinācijām.

24. Farmaceitiska kompozīcija saskaņā ar 20. pretenziju, kas satur droksidopu kopā ar tolkaponu.

25. Farmaceitiska kompozīcija saskaņā ar 20. pretenziju, kas satur droksidopu kopā ar piridostigmīnu.

26. Farmaceitiska kompozīcija saskaņā ar 20. pretenziju, kas satur droksidopu kopā ar entakaponu.

27. Farmaceitiska kompozīcija saskaņā ar 20. pretenziju, kas satur droksidopu kopā ar donepezilu.

28. Droksidopas kopā ar vienu vai vairākiem papildu savienojumiem, izvēlētiem no grupas, kas sastāv no katehol-O-metiltransferāzes inhibitoriem, monoamīnoksidāzes inhibitoriem un to kombinācijām, izmantošana medikamenta ražošanai ortostatiskās hipotensijas ārstēšanai.

29. Izmantošana saskaņā ar 28. pretenziju, kur droksidopa un viens vai vairāki papildu savienojumi ir kombinēti masas attiecībās no 100:1 līdz 1:2.

30. Izmantošana saskaņā ar 28. pretenziju, kur droksidopa un viens vai vairāki papildu savienojumi ir kombinēti masas attiecībās no 50:1 līdz 2:1.

31. Izmantošana saskaņā ar 28. pretenziju, kur kombinācija satur 10 mg līdz 2 g droksidopas un 1 mg līdz 200 mg vienu vai vairāk papildu savienojumu.

32. Izmantošana saskaņā ar 28. pretenziju, kur kombinācija ir paredzēta kā vienas devas vienība.

33. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 28. līdz 31. pretenzijai, kur droksidopa un viens vai vairāki papildu savienojumi tiek ievadīti vienlaikus.

34. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 28. līdz 31. pretenzijai, kur droksidopa un viens vai vairāki papildu savienojumi tiek ievadīti secīgi.

35. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 28. līdz 32. pretenzijai, kur katehol-O-metiltransferāzes inhibitori ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no entakapona, tolkapona, nitekapona un to kombinācijām.

36. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 28. līdz 32. pretenzijai, kur monoamīnoksidāzes inhibitori ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no izokarboksazīda, moklobemīda, fenelzīna, tranilciprofīna, selegilīna, nialamīda, iproniazīda, iproklozīda, toloksatona, harmalas, brofaromīna, benmoksīna, 5-metoksi-N,N-dimetiltriptamīna, 5-metoksi- α -metiltriptamīna un to kombinācijām.

37. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 28. līdz 32. pretenzijai, kur viens vai vairāki papildu savienojumi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no entakapona, tolkapona, nialamīda un to kombinācijām.

38. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 28. līdz 32. pretenzijai, kur viens vai vairāki papildu savienojumi ir entakapons.

39. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 28. līdz 32. pretenzijai, kur viens vai vairāki papildu savienojumi ir tolkapons.

40. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 28. līdz 32. pretenzijai, kur viens vai vairāki papildu savienojumi ir nialamīds.

(72) POHL, Jens, DE
PLÖGER, Frank, DE
KRUSE, Michael, DE

(74) Böhm, Brigitte, et al, Weickmann & Weickmann
Patentanwälte, Postfach 86 08 20, 81635 München, DE
Lūcija KUŽUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS,
a/k 61, Rīga LV-1010, LV

(54) **AUGSTAS AKTIVITĀTES AUGŠANAS FAKTORA MUTANTI**

HIGH ACTIVITY GROWTH FACTOR MUTANTS

(57) 1. Rekombinants GDF-5 radniecīgs proteīns ar uzlabotu bioloģisko aktivitāti, pie kam

a) aminoskābe pozīcijā, kas atbilst cilvēka savvaļas tipa GDF-5 (SEQ ID Nr. 1) metionīnam 453 (M453), ir alanīns, valīns vai izoleicīns,

un/vai
b) aminoskābe pozīcijā, kas atbilst cilvēka savvaļas tipa GDF-5 (SEQ ID Nr. 1) metionīnam 456 (M456), ir alanīns, valīns vai izoleicīns,

un pie kam tas satur sekvenci, kas saskan ar kādu no šādām vispārējām aminoskābju formulām:

a) CX₁X₂KX₃LHVX₄FX₅X₆X₇GWDDWX₈IAPLX₉YEAX₁₀HGX₁₁GX₁₂-CX₁₃FPX₁₄RSHLEPTNHAX₁₅IQTLZ₁NSMX₁₆PX₁₇X₁₈X₁₉PX₂₀X₂₁CCV-PX₂₂X₂₃LX₂₄PISILX₂₅X₂₆DX₂₇X₂₈NNVVYX₂₉X₃₀YEX₃₁MVVE₃₂CGCR vai

b) CX₁X₂KX₃LHVX₄FX₅X₆X₇GWDDWX₈IAPLX₉YEAX₁₀HGX₁₁GX₁₂-CX₁₃FPX₁₄RSHLEPTNHAX₁₅IQTLMNSZ₁PX₁₇X₁₈X₁₉PX₂₀X₂₁CCV-PX₂₂X₂₃LX₂₄PISILX₂₅X₂₆DX₂₇X₂₈NNVVYX₂₉X₃₀YEX₃₁MVVE₃₂CGCR, vai

c) CX₁X₂KX₃LHVX₄FX₅X₆X₇GWDDWX₈IAPLX₉YEAX₁₀HGX₁₁GX₁₂-CX₁₃FPX₁₄RSHLEPTNHAX₁₅IQTLZ₁NSZ₁PX₁₇X₁₈X₁₉PX₂₀X₂₁CCV-PX₂₂X₂₃LX₂₄PISILX₂₅X₂₆DX₂₇X₂₈NNVVYX₂₉X₃₀YEX₃₁MVVE₃₂CGCR, kur

X₁ apzīmē asparagīnu (N) vai serīnu (S),
X₂ apzīmē arginīnu (R) vai lizīnu (K),
X₃ apzīmē alanīnu (A), glutamīnu (Q), prolīnu (P) vai serīnu (S),
X₄ apzīmē asparagīnu (N) vai asparagīnskābi (D),
X₅ apzīmē arginīnu (R) vai lizīnu (K),
X₆ apzīmē asparagīnskābi (D) vai glutamīnskābi (E),
X₇ apzīmē leicīnu (L) vai metionīnu (M),
X₈ apzīmē izoleicīnu (I) vai valīnu (V),
X₉ apzīmē asparagīnskābi (D) vai glutamīnskābi (E),
X₁₀ apzīmē histidīnu (H), fenilalanīnu (F) vai tirozīnu (Y),
X₁₁ apzīmē asparagīnskābi (D) vai glutamīnskābi (E),
X₁₂ apzīmē leicīnu (L), metionīnu (M) vai valīnu (V),
X₁₃ apzīmē asparagīnskābi (D) vai glutamīnskābi (E),
X₁₄ apzīmē izoleicīnu (I) vai leicīnu (L),
X₁₅ apzīmē izoleicīnu (I) vai valīnu (V),
X₁₆ apzīmē alanīnu (A), asparagīnu (N) vai asparagīnskābi (D),
X₁₇ apzīmē arginīnu (R), asparagīnu (N), asparagīnskābi (D), glutamīnskābi (E), glicīnu (G) vai serīnu (S),
X₁₈ apzīmē alanīnu (A), asparagīnu (N), serīnu (S) vai treonīnu (T),
X₁₉ apzīmē alanīnu (A), metionīnu (M) vai treonīnu (T),
X₂₀ apzīmē alanīnu (A) vai prolīnu (P),
X₂₁ apzīmē serīnu (S) vai treonīnu (T),
X₂₂ apzīmē alanīnu (A), serīnu (S) vai treonīnu (T),
X₂₃ apzīmē arginīnu (R) vai lizīnu (K),
X₂₄ apzīmē serīnu (S) vai treonīnu (T),
X₂₅ apzīmē fenilalanīnu (F) vai tirozīnu (Y),
X₂₆ apzīmē izoleicīnu (I) vai treonīnu (T),
X₂₇ apzīmē alanīnu (A) vai serīnu (S),
X₂₈ apzīmē alanīnu (A) vai glicīnu (G),
X₂₉ apzīmē asparagīnu (N) vai lizīnu (K),
X₃₀ apzīmē glutamīnskābi (E) vai glutamīnu (Q),
X₃₁ apzīmē asparagīnskābi (D) vai glutamīnskābi (E),
X₃₂ apzīmē alanīnu (A), glutamīnu (Q), serīnu (S) vai treonīnu (T),

Z₁ apzīmē alanīnu (A), izoleicīnu (I) vai valīnu (V),
Z₂ apzīmē alanīnu (A), izoleicīnu (I) vai valīnu (V),
vai atbilstošu sekvenci, kurā par dimēra veidošanu atbildīgais cisteīns ir aizvietots ar citu aminoskābi vai ir izņemts.

2. Proteīns saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam GDF-5 radniecīgais proteīns ir mugurkaulnieku GDF-5 proteīns vai tā bioloģiski aktīvs fragments vai alēles variants.

- (51) **C07K 14/51**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1948689**
A61K 38/18⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 19/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 19/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 25/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 06818642.8 (22) 17.11.2006
(43) 30.07.2008
(45) 11.04.2012
(31) 05025261 (32) 18.11.2005 (33) EP
(86) PCT/EP2006/011074 17.11.2006
(87) WO2007/057212 24.05.2007
(73) BIOPHARM GESELLSCHAFT ZUR BIOTECHNOLOGISCHEN ENTWICKLUNG VON PHARMAKA mbH, Czernyng 22, 69115 Heidelberg, DE

3. Proteīns saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam GDF-5 radniecīgais proteīns ir cilvēka GDF-5 (SEQ ID Nr. 1) vai tā bioloģiski aktīvs fragments.

4. Nukleīnskābe, kas kodē proteīnu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai.

5. Ekspresijas vektors, kas satur nukleīnskābi saskaņā ar 4. pretenziju.

6. Saimniekšūna, kas satur nukleīnskābi saskaņā ar 4. pretenziju vai ekspresijas vektoru saskaņā ar 5. pretenziju.

7. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur proteīnu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai vai/un nukleīnskābi saskaņā ar 4. pretenziju, vai/un ekspresijas vektoru saskaņā ar 5. pretenziju, vai/un saimniekšūnu saskaņā ar 6. pretenziju.

8. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 7. pretenziju, kas papildus satur farmaceutiski pieņemamas palīgvielas un/vai nesējvielas.

9. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 7. vai 8. pretenziju, pie kam proteīns un/vai nukleīnskābe, un/vai vektors, un/vai saimniekšūna atrodas bioloģiski savietojamā matricē materiālā vai uz tā.

10. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 9. pretenzijai izmantošanai traumai vai slimībai, kas ir saistīta ar bojātu kaulu, skrimšļi, diagnozē, profilaksē un/vai terapijā.

11. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 10. pretenzijai izmantošanai skrimšļa un/vai kaula veidošanās un/vai spondilodēzes veicināšanā, bojātu vai slimības skartu asinšvadu audu diagnozei, profilaksei un/vai terapijai un angioģenēzes inducēšanai.

12. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, pie kam minētā slimība, kas ir saistīta ar kaula vai skrimšļa bojājumu, ir osteoporozē.

13. Metode rekombinantā proteīna saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai ražošanai, kas ietver no GDF-5 radniecīgā proteīna atvasināta proteīna iegūšanu,

a) aizstājot aminoskābi pozīcijā, kas atbilst cilvēka savvaļas tipa GDF-5 (SEQ ID Nr. 1) metionīnam 453 (M453), ar alanīnu, valīnu vai izoleicīnu,

b) aizstājot aminoskābi pozīcijā, kas atbilst cilvēka savvaļas tipa GDF-5 (SEQ ID Nr. 1) metionīnam 456 (M456), ar alanīnu, valīnu vai izoleicīnu.

14. Antiviela, kas ir specifiska rekombinantajam GDF radniecīgajam proteīnam saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, pie kam antiiviela ir specifiska apgabalam, kas aptver aminoskābes, kuras atbilst cilvēka savvaļas tipa GDF-5 (SEQ ID Nr. 1) aminoskābēm 453-456.

15. Proteīna saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, nukleīnskābes saskaņā ar 4. pretenziju, ekspresijas vektora saskaņā ar 5. pretenziju un/vai saimniekšūnas saskaņā ar 6. pretenziju izmantošana terapeitiskas un/vai diagnostiskas kompozīcijas ražošanai slimību, kuras pavada kaula un/vai skrimšļa bojājums, vai kaulu un/vai skrimšļi bojājošas slimības diagnozei, profilaksei un/vai terapijai.

16. Proteīna saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, nukleīnskābes saskaņā ar 4. pretenziju, ekspresijas vektora saskaņā ar 5. pretenziju un/vai saimniekšūnas saskaņā ar 6. pretenziju izmantošana terapeitiskas un/vai diagnostiskas kompozīcijas ražošanai slimību, kuras pavada kaula un/vai spondilodēzes veicināšanai.

17. Proteīna saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, nukleīnskābes saskaņā ar 4. pretenziju, ekspresijas vektora saskaņā ar 5. pretenziju un/vai saimniekšūnas saskaņā ar 6. pretenziju izmantošana terapeitiskas un/vai diagnostiskas kompozīcijas ražošanai bojātu vai slimības skartu asinšvadu audu diagnozei, profilaksei un/vai terapijai.

18. Proteīna saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, nukleīnskābes saskaņā ar 4. pretenziju, ekspresijas vektora saskaņā ar 5. pretenziju un/vai saimniekšūnas saskaņā ar 6. pretenziju izmantošana terapeitiskas un/vai diagnostiskas kompozīcijas ražošanai angioģenēzes inducēšanai.

(21) 06831163.8

(22) 23.11.2006

(43) 13.08.2008

(45) 07.03.2012

(31) 0512189

(32) 01.12.2005 (33) FR

(86) PCT/FR2006/002577

23.11.2006

(87) WO2007/063200

07.06.2007

(73) PIERRE FABRE MEDICAMENT, 45, Place Abel Gance, 92100 Boulogne, FR

(72) BERTHOUMIEU, Didier, FR

DUPINAY, Pierre, FR

TRANNOY, Philippe, FR

(74) Rousseau, Pierrick Edouard, Pierre Fabre SA, Direction Propriété Intellectuelle, 17, Avenue Jean Moulin, F-81106 Castres Cedex, FR

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

(54) **KOMPOZĪCIJA AR DZELZS SĀLS KĀ AKTĪVA INGREDIENTA PALĒNINĀTU ATBRĪVOŠANU, TĀS IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS UN TĀS IZMANTOŠANA SLOW-RELEASE COMPOSITION OF FE SALT AS ACTIVE INGREDIENT, METHOD FOR THE PREPARATION THEREOF AND USE OF THE SAME**

(57) 1. Farmaceutiska vai nutraceutiska kompozīcija, kas satur vismaz vienu apvalkotu granulu ar dzelzs sāls palēninātu atbrīvošanu; minētā apvalkotā granula satur minētā dzelzs sāls saturošu daļiņu, kas ir pārklāta ar vismaz diviem slāņiem, kas raksturīga ar to, ka tie satur palīgvielu kombināciju, kas satur:

- vismaz vienu kopolimēru (a): poli(etilakrilāt-ko-metilmetakrilāt-ko-trimetilamonijetilmetakrilāta hlorīds) 1:2:0,1 (Eudragit RS30D®) ar ceturrtējā amonija grupu molāro procentu koncentrāciju mazāku par vai vienādu ar 8 %;

- kombināciju ar otro kopolimēru (b): poli(etilakrilāt-ko-metilmetakrilāt-ko-trimetilamonijetilmetakrilāta hlorīds) 1:2:0,2 (Eudragit RL30D®) ar ceturrtējā amonija grupu molāro procentu koncentrāciju lielāku par 8 %;

- (a) un (b) masu attiecību diapazonā no 60/40 līdz 80/20;

- un (a) daudzumu starp 2,5 % un 5,0 % sausā masa attiecībā uz kompozīcijas kopējo masu.

2. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka dzelzs sāls ir dzelzs (II) vai dzelzs (III) formā.

3. Kompozīcija saskaņā ar 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka dzelzs sāls ir izvēlēts no grupas, kas satur sulfātu, fumarātu, gluconātu, askorbātu, oksalātu, sukcinātu, glicerofosfātu un feredetātu.

4. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka dzelzs sāls ir dzelzs (II) sulfāts.

5. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tā nesatur jebkuru citu antioksidantu.

6. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka ceturrtējā amonija grupu molāro procentu koncentrācija kopolimērā (a) ir no 2 % līdz 8 % un labāk 5 %.

7. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka ceturrtējā amonija grupu molāro procentu koncentrācija kopolimērā (b) ir no 8 % līdz 12 % un labāk 10 %.

8. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka (a) un (b) masu attiecība gala kompozīcijā ir 70/30 un labāk 65/35.

9. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka kopolimēra (a) daudzums ir no 3,5 % līdz 4 % sausā masa attiecībā uz kompozīcijas kopējo masu.

10. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka palīgvielu kombinācija satur atšķaidītāju, saistvielu, smērvielu, antiaglomerācijas līdzekli, plastifikatoru, kas tiek izmantoti atsevišķi vai maisījuma formā.

11. Kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka plastifikators ir izvēlēts no grupas, kas izvēlēts no acetiltributilcitrāta, acetiltriethylcitrāta, acetilētiem taukskābes glicerīdiem, rīcinellas, dietilsebakāta, dibutilsebakāta, glicerīna, glicerīnmonostearāta, glicerīntriacetāta, polietilēnglikoliem, polioksietilēna/polioksipropilēna kopolimēriem, propilēnglikola, tributilcitrāta, trietilcitrāta, kas tiek izmantoti atsevišķi vai maisījuma formā, un labāk ir trietilcitrāts.

12. Kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka atšķaidītājs ir izvēlēts no grupas, kas izvēlēts no celulozēm vai laktozes, un labāk ir celuloze.

(51) **A61K 9/50⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**
A61K 33/26⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 7/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(11) **1954251**

13. Kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka saistviela ir izvēlēta no grupas, kas izvēlēta no maltodekstrīniem un povidoniem, un labāk ir maltodekstrīns.

14. Kompozīcijas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai izmantošana farmaceitiska vai nutraceutiska produkta ar dzelzs sāls palēninātu atbrīvošanu iegūšanai.

15. Kompozīcijas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai izmantošana farmaceitiska, nutraceutiska, kosmētiska vai veterināra produkta iegūšanai, kas paredzēts minerālu un oligoelementu deficīta ārstēšanai un/vai novēršanai.

16. Izmantošana saskaņā ar 14. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka farmaceitiskais, nutraceutiskais, kosmētiskais vai veterinārais preparāts ir perorālā formā.

17. Izmantošana saskaņā ar 16. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka perorālā forma ir izvēlēta no tabletēm, želatīna kapsulām, kapsulām, un pulveriem, kas paredzēti dzeramajām suspensijām un sīrupiem.

18. Kompozīcijas saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 13. pretenzijai izmantošana medikamenta iegūšanā, kas paredzēts dzelzs deficīta ar anēmiju vai bez anēmijas ārstēšanai un/vai novēršanai.

19. Kompozīcijas saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 13. pretenzijai izmantošana medikamenta iegūšanā, kas paredzēts dzelzs deficīta anēmijas ārstēšanai un/vai novēršanai.

20. Kompozīcijas saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 13. pretenzijai izmantošana medikamenta iegūšanā, kas paredzēts dzelzs deficīta ārstēšanai un/vai novēršanai grūtniecēm, kad nevar būt nodrošināts dzelzs pietiekams daudzums ar ēdienu.

21. Paņēmiens farmaceitiskas vai nutraceutiskas kompozīcijas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 13. pretenzijai iegūšanai, kas raksturīgs ar to, ka paņēmiens ietver šādas stadijas:

1) dzelzs sāls tiek pārklāts, lāpstiņu maisītājā, ar divu kopolimēru (a) un (b) ūdens dispersiju, pie tam (a) un (b) masu attiecība ir no 60/40 līdz 80/20, ar (a) daudzumu no 2,5 % līdz 5,0 % sausā masa attiecībā uz kompozīcijas kopējo masu;

2) stadijā 1) iegūtā granula tiek sašķelta;

3) stadijā 2) iegūtās granulas tiek žāvētas;

4) izžāvētās granulas, kas iegūtas stadijā 3), tiek pārklātas verdošajā slānī, izputekļojot divu kopolimēru (a) un (b) ūdens dispersiju, pie tam (a) un (b) masu attiecība ir no 60/40 līdz 80/20, ar (a) daudzumu no 3,5 % līdz 5,0 % sausā masa attiecībā uz kompozīcijas kopējo masu;

5) pārklātās granulas, kas iegūtas stadijā 4), tiek žāvētas.

22. Paņēmiens saskaņā ar 21. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tajā netiek izmantots organisks šķīdinātājs.

23. Paņēmiens saskaņā ar 21. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka (a) un (b) masu attiecība stadijās 1) un 4) ir identiska.

24. Paņēmiens saskaņā ar 21. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka iegūtās granulas tiek iepakotas tieši pulvera formā, kas paredzēts dzeramajai suspensijai vai sīrupam.

25. Paņēmiens saskaņā ar 21. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tas ietver papildu stadiju, kurā granulas tiek lubricētas, lai iegūtu tabletes, želatīna kapsulas vai sūkājāmās tabletes.

26. Paņēmiens saskaņā ar 21. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tas ietver papildu stadiju, kurā granulas tiek presētas, lai iegūtu tabletes vai sūkājāmās tabletes.

27. Paņēmiens saskaņā ar 21. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka stadija 4) tiek veikta vairākas reizes pēc kārtas.

Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV

(54) **UZ ALUMĪNIJA ADJUVANTIEM TŪLĪTĒJI ABSORBĒTAS GRIPAS VAKCĪNAS INFLUENZA VACCINES EXTEMPORANEOUSLY ADSORBED TO ALUMINIUM ADJUVANTS**

(57) 1. (i) Gripas vīrusa antigēna, kas satur hemaglutinīnu, un (ii) adjuvanta sastāvdaļas, kas satur alumīnija sāli, izmantošana, ražojot medikamentu imūnreakcijas pastiprināšanai pacientā, kur medikaments satur antigēnu un adjuvantu kā atsevišķas sastāvdaļas, tūlītējai samaisīšanai lietošanas brīdī.

2. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, kur gripas vīrusa antigēns ir inaktivēts vīruss.

3. Izmantošana saskaņā ar 2. pretenziju, kur gripas vīrusa antigēns satur veselu vīrusu.

4. Izmantošana saskaņā ar 2. pretenziju, kur gripas vīrusa antigēns satur sašķeltu vīrusu.

5. Izmantošana saskaņā ar 2. pretenziju, kur gripas vīrusa antigēns satur attīrītus virsmas antigēnus.

6. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur gripas vīrusa antigēns ir no H1, H2, H3, H5, H7 vai H9 gripas A vīrusa apakštipiem.

7. Izmantošana saskaņā ar 6. pretenziju, kur gripas vīrusa antigēns ir no H5N1.

8. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur gripas vīrusa antigēns, tiek iegūts no gripas vīrusa, kas kultivēts uz olām.

9. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kur gripas vīrusa antigēns, tiek iegūts no gripas vīrusa, kas kultivēts uz šūnu kultūras.

10. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kur gripas vīrusa antigēna sastāvdaļa ir brīva no ovalbumīna, ovomukoīda un cāļu DNS.

11. Izmantošana saskaņā ar 9. pretenziju, kur gripas vīrusa antigēna sastāvdaļa satur mazāk par 10 ng šūnu DNS no šūnu kultūras saimnieka.

12. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur gripas vīrusa antigēna sastāvdaļa satur katrā sastāvdaļā no 0,1 līdz 50 µg hemaglutinīna uz katru vīrusu celmu.

13. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur adjuvanta sastāvdaļa satur alumīnija hidroksīda adjuvantu.

14. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kur adjuvanta sastāvdaļa satur alumīnija fosfāta adjuvantu.

- (51) **A61K 39/145⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **1957104**
- A61K 39/39⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**
- (21) 06808433.4 (22) 06.11.2006
- (43) 20.08.2008
- (45) 21.03.2012
- (31) 0522601 (32) 04.11.2005 (33) GB
- 735605 P 09.11.2005 US
- (86) PCT/GB2006/004138 06.11.2006
- (87) WO2007/052060 10.05.2007
- (73) Novartis Vaccines and Diagnostics S.r.l., Via Fiorentina 1, 53100 Siena (SI), IT
- (72) COLEGATE, Anthony, GB
- SIZER, Philip, GB
- (74) Marshall, Cameron John, et al, Carpmaels & Ransford, One Southampton Row, London WC1B 5HA, GB

- (51) **E04C 2/296⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **1958767**
- B32B 37/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**
- (21) 08151062.0 (22) 05.02.2008
- (43) 20.08.2008
- (45) 23.05.2012
- (31) 20075085 (32) 06.02.2007 (33) FI
- (73) Paroc Oy Ab, Läkikisepäntie 23, 00621 Helsinki, FI
- (72) WILLBERG, Jim, FI
- (74) LEITZINGER OY, Tammasaarenkatu 1, 00180 Helsinki, FI
- Artis KROMANIS, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV

(54) **PAŅĒMIENS VAIRĀKSLĀŅU ELEMENTA UN KONSTRUKTĪVA ELEMENTA RAŽOŠANAI METHOD FOR MANUFACTURING A SANDWICH ELEMENT AND BUILDING ELEMENT**

(57) 1. Paņēmiens vairākslāņu tipa konstruktīvu elementu (12) ražošanai, kas satur vismaz vienu materiāla slāni (2), kas būtība ir no minerālvates, pie kam: paņēmiens vairākslāņu elementa materiālu slāņi (1, 2, 3) tiek nostiprināti viens pie otra ar adhēzijas palīdzību; viens vai vairāki no minētajiem elementiem (12) tiek ietverti pārsegumā (4), kas aprīkots ar vismaz vienu vārstu (9), kurš(-i) tiek novests(-i) sūkņa kontaktā ar minerālvatī un ir savienots(-i) ar vakuumsūkni vai tamlīdzīgu ierīci, lai aptverošā pārseguma (4) iekšpusē izveidotu vakuumu, izvadot gaisu no pārseguma (4), kurš tādējādi tiek novests tādā spiestā stāvoklī, ka materiālu slāņi (1, 2, 3) adhēzijas nodrošināšanai tiek spiesti viens pret otru.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam adhēzija tiek realizēta ar līmes uznešanu starp materiālu slāņiem (1, 2, 3) un/vai tādā veidā, ka vismaz daļai no materiālu slāņiem (1, 2, 3) ir pašlīmējošas īpašības.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam vismaz viens no ārējiem materiālu slāņiem (1, 3) neatkarīgi viens no otra tiek izvēlēts no stingriem materiāliem, tādiem kā metāli, piemēram, lokšņveida metāli, un materiāliem ar mazu siltumvadītspēju, tādiem kā finieris.

4. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka pārsegums (4) tiek veidots no formējama, cieši aptveroša materiāla, tāda kā plastmasas plēve.

5. Konstruktīva elementa produkts (20), kas būtībā sastāv no viena vai vairākiem vairākslāņu tipa konstruktīviem elementiem (12), pie kam: katrs konstruktīvais elements satur vismaz vienu materiāla slāni (2), kas būtībā sastāv no minerālvates; produkts (20) sastāv no viena vai vairākiem minētajiem vairākslāņu elementiem, kurus aptver pārsegums (4), kas aprīkots ar vismaz vienu vārstu (9), kurš(-i) ir sūkņa kontaktā ar minerālvati un ir savienojams(-i) ar vakuumsūkni vai tamlīdzīgu ierīci, lai aptverošā pārseguma (4) iekšienē izveidotu vakuumu, izvadot gaisu no pārseguma (4), kas tādējādi tiek novests tādā saspīestā stāvoklī, ka materiālu slāņi (1, 2, 3) adhēzijas nodrošināšanai tiek spiesti viens pret otru.

6. Konstruktīvā elementa produkts saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka pārsegums (4) ir veidots no formējama, cieši aptveroša materiāla, tāda kā plastmasas plēve.

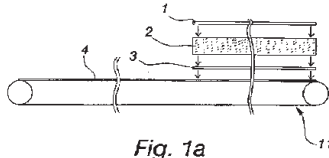


Fig. 1a

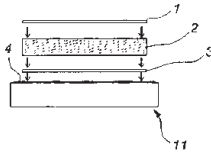


Fig. 1b

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka pildījuma maisījums veido vairāk par 35 % no lazānjas galīgās masas.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka minētais paņēmiens ietver arī minētās lazānjas konservēšanas etapu aizsargatmosfērā, ko pilnībā vai daļēji veido oglekļa dioksīds.

4. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka pasterizēšana tiek veikta, lazānjas blokus liekot vienu uz otra karstā veidā, kamēr starp tiem dozē karstu bešamela un/vai citu mērci, un tādējādi pagatavoto produktu sterilā telpā atdzesē un iesaiņo.

5. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka minētais pasterizēšanas etaps ir pasterizēšana ar mikroviļņiem, kas ietver ātru minētās lazānjas uzkaršēšanu, minētās ātri uzkaršētās lazānjas atdzesēšanu ar mikrobioloģiski filtrēta dzesēšanas gaisa sistēmu un minētās atdzesētās lazānjas aseptisku iesaiņošanu.

6. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka minētais pasterizēšanas etaps ietver pasterizējošu apstrādi ar karstu tvaiku un ar sekojošu dzesēšanu uz konveijera lentēm, kas izvietotas spirālveidā karsēšanas un dzesēšanas torņos.

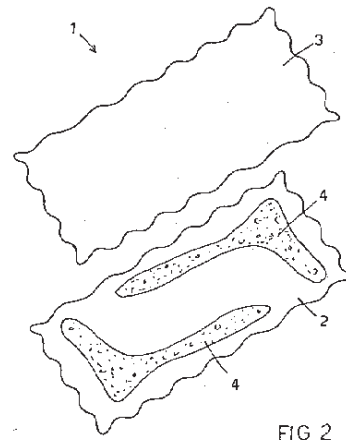


FIG 2

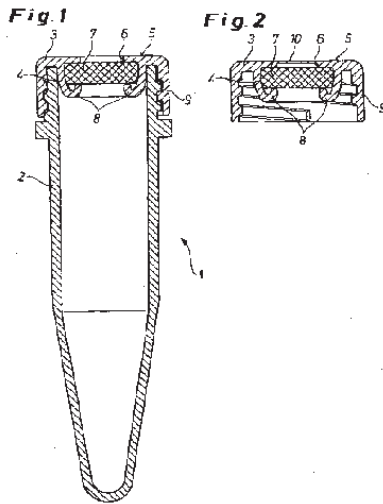
- (51) **A23L 1/16**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1980160**
 (21) 08006270.6 (22) 31.03.2008
 (43) 15.10.2008
 (45) 01.08.2012
 (31) MI20070673 (32) 02.04.2007 (33) IT
 (73) Pastificio Rana S.p.A., Via Pacinotti 25, 37057 San Giovanni Lupatoto (Verona), IT
 (72) RANA, Giovanni, IT
 (74) Lissandrini, Marco, Bugnion S.p.A., Via Pancaldo 68, 37138 Verona, IT
 Nīna DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV
- (54) **LAZANJAS UN CITU PĀRTIKAS PUSFABRIKĀTU PAGATAVOŠANAS PAŅĒMIENS METHOD FOR MAKING LASAGNE AND OTHER READY TO EAT FOOD PRODUCTS**

(57) 1. Lazānjas pusfabrikāta pagatavošanas paņēmiens no svaigiem, iepriekš nevārītiem makaroniem, pie kam minētais paņēmiens ietver sekojošus etapus: pirmā un otrā plānā makaronu slāņa, kura katra biezums ir mazāks par 1,2 milimetriem, sagatavošanu; ļoti mīksta, gandrīz šķidra materiāla un vesela gaļas gabala maisījuma dozēšanu uz pirmā makaronu slāņa būtībā kopējās augšējās virsmas; minētā pirmā makaronu slāņa pārklāšanu ar minēto otro makaronu slāni; minētā pildījuma maisījuma, kuru satur pirmais un otrais viens uz otra uzliktais makaronu slānis, noblīvēšanu tā četrās pusēs, lai iegūtu no diviem makaronu slāņiem sastāvošu, pildītu un noblīvētu bloku; minētā bloka pasterizēšanu un vairāku šādu bloku uzklāšanu vienu uz otra, vienlaicīgi karstā veidā starp katru uzklāto bloku pāri dozējot bešamela un/vai citu mērci.

- (51) **B01L 3/14**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **1981637**
B65D 1/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 07702363.8 (22) 18.01.2007
 (43) 22.10.2008
 (45) 25.04.2012
 (31) 202006001995 U (32) 07.02.2006 (33) DE
 (86) PCT/DE2007/000082 18.01.2007
 (87) WO2007/090362 16.08.2007
 (73) Sarstedt AG & Co., Rommelsdorfer Strasse, 51588 Nümbrecht, DE
 (72) SARSTEDT, Walter, DE
 (74) Grosse, Wolf-Dietrich Rüdiger, Patentanwälte Valentin-Gihske-Grosse, Eduard-Schloemann-Str. 55, 40237 Düsseldorf, DE
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
- (54) **PAŅĒMIENS KONTEINERA IZGATAVOŠANAI NELIELU ŠĶIDRUMA DAUDZUMU PAŅĒMŠANAI ANALĪZĒM METHOD FOR PRODUCING A SAMPLE VESSEL FOR ACCOMMODATING SMALL AMOUNTS OF LIQUID FOR ANALYSES**

(57) 1. Paņēmiens paraugu ņemšanas konteinera (1) izgatavošanai nelielu šķidruma daudzumu paņemšanai analīzēm, kas satur nelielu caurulīti (2), kura vienā tās galā ir noslēgta, un vāciņu (3), kurš hermētiski noslēdz caurulītes otru atvērto galu un kuram ir membrānas disks (7), kas ir pārdurams ar kanulas uzgali, pie kam membrānas disks (7) vāciņā (3) ir ievietots no apakšpusē un cieši pieguļ vāciņa (3) iekšējās virsmas ārēji plakanai un gludai gala sienīgai (5),

kas raksturīgs ar to, ka membrānas disku (7) piespiestā stāvoklī notur vāciņa (3) iekšējās manšetes (4) mala (8), kura tiek izveidota termiskās deformēšanas ceļā.



- (51) **C04B 35/48**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2006260**
C04B 35/109⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C04B 35/622⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C04B 35/66⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 08252089.1 (22) 18.06.2008
(43) 24.12.2008
(45) 28.03.2012
(31) 820389 (32) 19.06.2007 (33) US
(73) MAGNECO/METREL, INC., 223 Interstate Road, Addison, Illinois 60101, US
(72) CONNORS, Charles W., US
ANDERSON, Michael W., US
SHAH, Shirish, US
(74) Setna, Rohan P., Boulton Wade Tennant, Verulam Gardens, 70 Gray's Inn Road, London WC1X 8BT, GB
Artis KROMANIS, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV
- (54) **UGUNSDROŠA KOMPOZĪCIJA STIKLA KAUSĒŠANAS KRĀSNĪM**
REFRACTORY COMPOSITION FOR GLASS MELTING FURNACES

(57) 1. Paņēmiens ugunsdroša materiāla gatavošanai stikla kausēšanas krāsnij, kas ietver:
pirmā komponentu komplekta, kas satur alumīnija oksīdu un cirkonija dioksīdu, sagatavošanu;
koloidāla silīcija dioksīda saistvielas sagatavošanu daudzumā no 5 masas % līdz 20 masas % no pirmā komponentu komplekta sausās masas;
pirmā komponentu komplekta samaisīšanu ar koloidālā silīcija dioksīda saistvielu, lai veidotu ugunsdrošu kompozīciju, kas satur no 10 masas % līdz 45 masas % alumīnija oksīda, vismaz 35 masas % cirkonija dioksīda un vismaz 20 masas % silīcija dioksīda; un
ugunsdrošās kompozīcijas veidošanu uz krāsns virsmas.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam ugunsdroša kompozīcija satur no 15 masas % līdz 40 masas % alumīnija oksīda, no 40 masas % līdz 60 masas % cirkonija dioksīda un no 20 masas % līdz 40 masas % silīcija dioksīda.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam ugunsdroša kompozīcija satur no 15 masas % līdz 30 masas % alumīnija oksīda, no 40 masas % līdz 55 masas % cirkonija dioksīda un no 25 masas % līdz 35 masas % silīcija dioksīda.

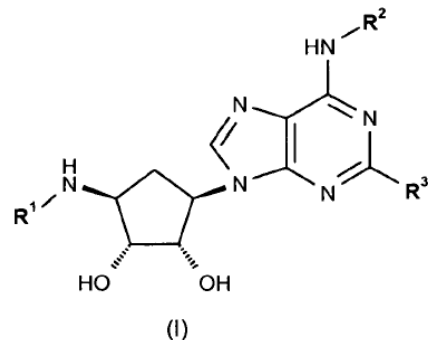
4. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam ugunsdroša kompozīcija satur vismaz 40 masas % cirkonija dioksīda.

5. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam pirmais komponentu komplekts satur no 10 masas % līdz 35 masas % alumīnija oksīda, no 60 masas % līdz 85 masas % cirkonija dioksīda un līdz 10 masas % silīcija dioksīda.

6. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam silīcija dioksīda saistviela sastāda no 6 masas % līdz 12 masas % pirmā komponentu komplekta sausās masas.

7. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam ugunsdroša kompozīcija tiek veidota ar paņēmienu, kas ir izvēlēts no liešanas, piesūknēšanas un torkretēšanas.

- (51) **C07D 473/16**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2013211**
C07D 473/18⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 473/34⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07H 19/167⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 29/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/52⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/7076⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 07724372.3 (22) 19.04.2007
(43) 14.01.2009
(45) 14.03.2012
(31) 0607947 (32) 21.04.2006 (33) GB
07101483 31.01.2007 EP
(86) PCT/EP2007/003435 19.04.2007
(87) WO2007/121920 01.11.2007
(73) Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH
(72) FAIRHURST, Robin, Alec, GB
TAYLOR, Roger, John, GB
COX, Brian, GB
(74) Vögeli-Lange, Regina, Novartis Pharma AG Patent Department, 4002 Basel, CH
Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
- (54) **PURĪNA ATVASINĀJUMI IZMANTOŠANAI PAR ADENOZĪNA A2A RECEPTORA AGONISTIEM**
PURINE DERIVATIVES FOR USE AS ADENOSIN A2A RECEPTOR AGONISTS
- (57) 1. Savienojums ar formulu (I) vai tā stereoizomēri vai farmaceitiski pieņemami sāļi,



kur R¹, R² un R³ ir

Ex.	R ¹	R ²	R ³
1			
2			
3			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
4			
5			
6			
7			
8			
9			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
17			
18			
19			
20			
21			
22			
23			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
10			
11			
12			
13			
14			
15			
16			

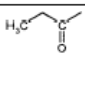
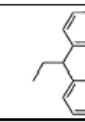
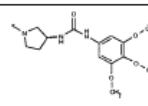
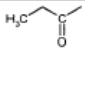
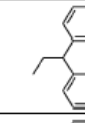
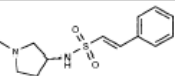
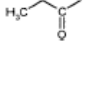
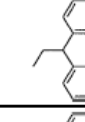
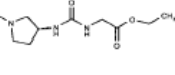
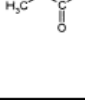
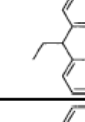
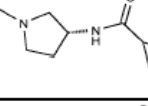

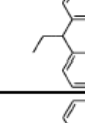
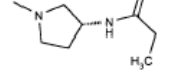
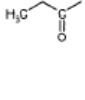
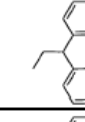
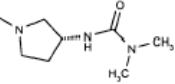
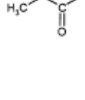
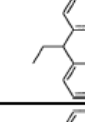
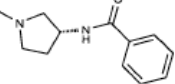
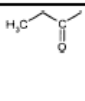
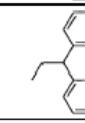
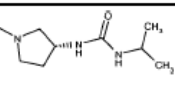
Ex.	R ¹	R ²	R ³
24			
25			
26			
27			
28			
29	H-		
30			


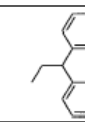
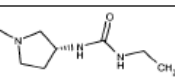

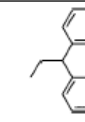
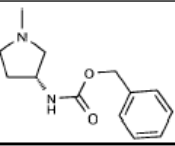
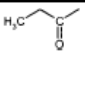
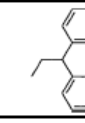
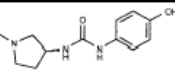
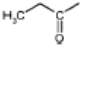
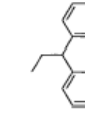
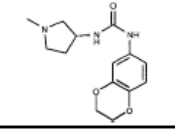
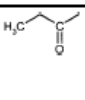
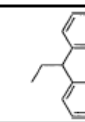
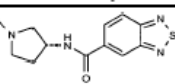
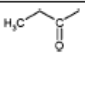
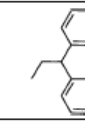
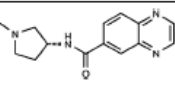
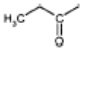
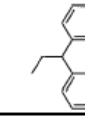
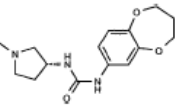
Ex.	R ¹	R ²	R ³
31			
32			
33			
34			
35			
36			
37			


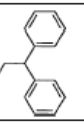
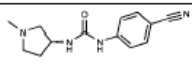
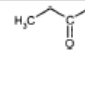
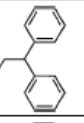
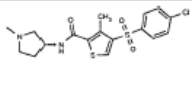

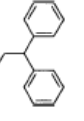
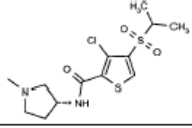
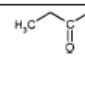
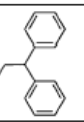
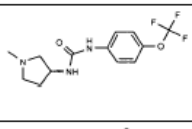
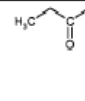
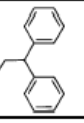
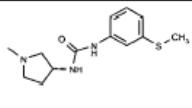
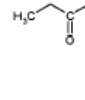
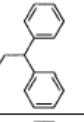
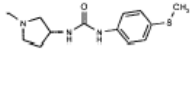
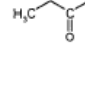
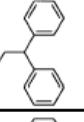
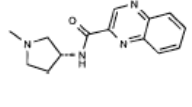
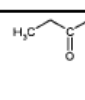
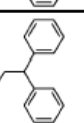
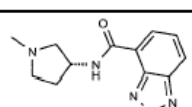
Ex.	R ¹	R ²	R ³
38			
39			
40			
41			
42			
43			
44		-H	


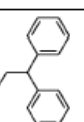
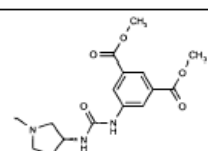
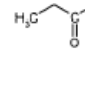
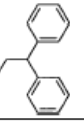
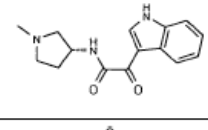
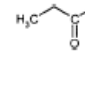
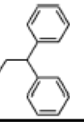
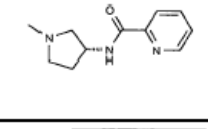
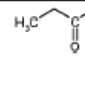
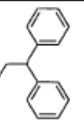
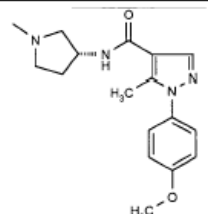
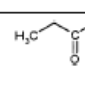
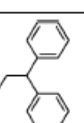
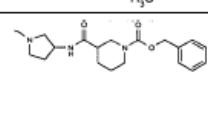
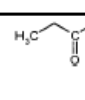
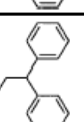
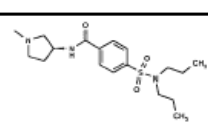
Ex.	R ¹	R ²	R ³
45			
46			
47			
48			
49			
50			
51			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
52			
53			
54			
55			
56			
57			
58			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
59			
60			
61			
62			
63			
64			
65			
66			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
67			
68			
69			
70			
71			
72			
73			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
74			
75			
76			
77			
78			
79			
80			
81			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
82			
83			
84			
85			
86			
87			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
88			
89			
90			
91			
92			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
99			
100			
101			
102			
103			
104			
105			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
93			
94			
95			
96			
97			
98			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
106			
107			
108			
109			
110			
111			
112			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
113			
114			
115			
116			
117			
118			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
127			
128			
129			
130			
131			
132			
133			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
119			
120			
121			
122			
123			
124			
125			
126			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
134			
135			
136			
137			
138			
139			
140			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
141			
142			
143			
144			
145			
146			
147			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
154			
155			
156			
157			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
148			
149			
150			
151			
152			
153			


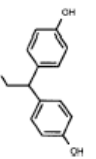
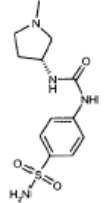

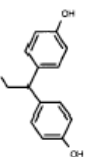
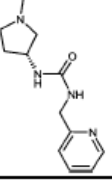

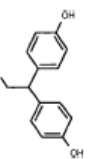
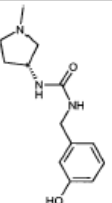

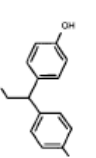
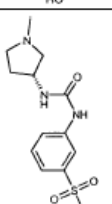
Ex.	R ¹	R ²	R ³
158			
159			
160			
161			
162			
163			


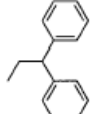
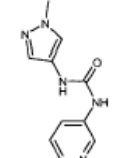

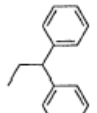
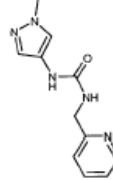

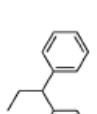
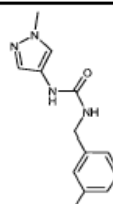

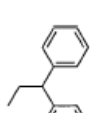
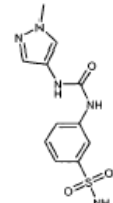
Ex.	R ¹	R ²	R ³
164			
165			
166			
167			
168		-H	
169			-Cl
170		-H	
171			


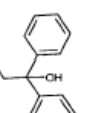
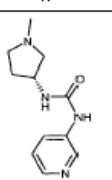

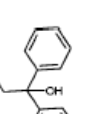
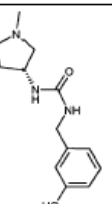

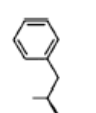
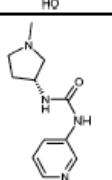

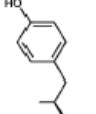
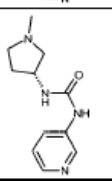

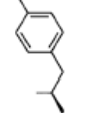
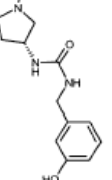
Ex.	R ¹	R ²	R ³
178			
179			
180			
181			
182			
183			


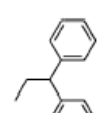
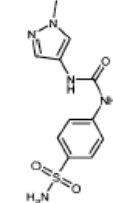

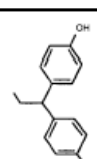
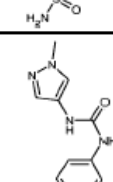

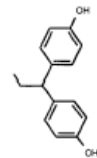
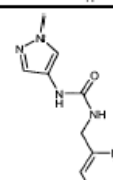

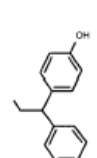
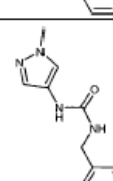
Ex.	R ¹	R ²	R ³
172			
173			
174		-H	
175			
176			
177			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
184			
185			
186			
187			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
188			
189			
190			
191			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
197			
198			
199			
200			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
192			
193			
194			
195			
196			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
201			
202			
203			
204			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
205			
206			
207			
208			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
213			
214			
215			
216			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
209			
210			
211			
212			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
217			
218			
219			
220			
221			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
222			
223			
224			
225			
226			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
227			
228			
229			
230			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
231			
232			
233			
234			
235			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
236			
237			
238			
239			
240			
241			

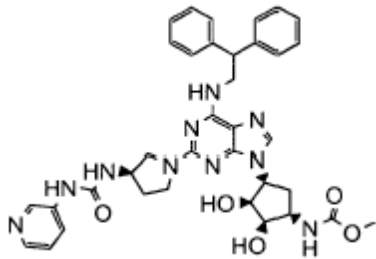
Ex.	R ¹	R ²	R ³
242			
243			
244			
245			
246			
247			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
248			
249			
250			
251			
252			
253			

Ex.	R ¹	R ²	R ³
254			
255			
256			
257			
258			
259			

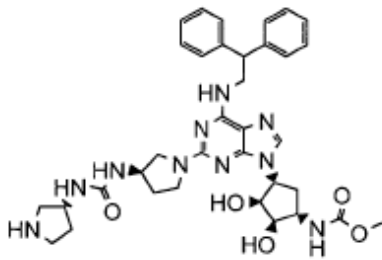
Ex.	R ¹	R ²	R ³
260			
261			
262			
263			
264			

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā stereoizomēri vai farmaceitiski pieņemami sāļi, kas attēloti ar ((1S,2R,3S,4R)-4-{6-(2,2-difenil-etilamino)-2-[(R)-3-(3-piridin-3-il-ureido)-pirolidin-1-il]-purin-9-il]-2,3-dihidroksi-ciklopentil)-karbamīnskābes metilesteri ar formulu



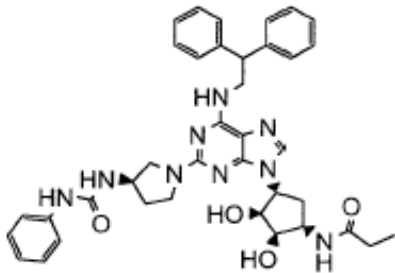
vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā stereozomēri vai farmaceutiski pieņemami sāļi, kas attēloti ar ((1S,2R,3S,4R)-4-{6-(2,2-difenil-etilamino)-2-[(R)-3-(R)-3-pirolidin-3-ilureido]-pirolidin-1-il]-purin-9-il}-2,3-dihidroksi-ciklopentil)-karbamīnskābes metil-esterei ar formulu



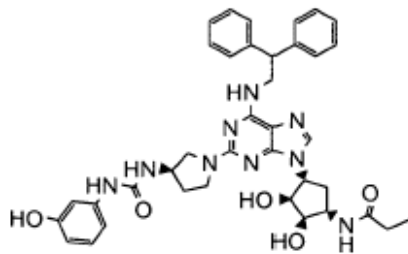
vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā stereozomēri vai farmaceutiski pieņemami sāļi, kas attēloti ar N-((1S,2R,3S,4R)-4-{6-(2,2-difenil-etilamino)-2-[(R)-3-(3-fenil-ureido)-pirolidin-1-il]-purin-9-il}-2,3-dihidroksi-ciklopentil)-propionamīdu ar formulu



vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli.

5. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā stereozomēri vai farmaceutiski pieņemami sāļi, kas attēloti ar N-((1S,2R,3S,4R)-4-{6-(2,2-difenil-etilamino)-2-[(R)-3-(3-hidroksi-fenil)-ureido]-pirolidin-1-il]-purin-9-il}-2,3-dihidroksi-ciklopentil)-propionamīdu ar formulu

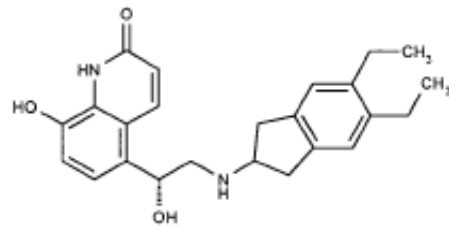


vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli.

6. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai vai tā stereozomēri vai farmaceutiski pieņemami sāļi izmantošanai par medikamentiem.

7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai vai tā stereozomēri vai farmaceutiski pieņemami sāļi kombinācijā ar pretiekaisuma, bronhus paplašinošām, antihistamīnu vai pretklepus zālēm, pie kam minētais savienojums un minētās zāles ir vienā vai dažādās farmaceutiskās kompozīcijās.

8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai vai tā stereozomēri vai farmaceutiski pieņemami sāļi kombinācijā ar savienojumu ar formulu



vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli.

9. Farmaceutiska kompozīcija, kas kā aktīvo vielu satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai vai tā stereozomērus vai farmaceutiski pieņemamus sāļus kopā ar farmaceutiski pieņemamu atšķaidītāju vai nesēju.

10. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai vai tā stereozomēri vai farmaceutiski pieņemami sāļi izmantošanai iekaisuma vai obstruktīvas elpošanas ceļu slimības ārstēšanā.

- (51) **C08G 18/62**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2024411**
B23K 20/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C08G 18/34⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C08G 18/79⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C08J 9/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C08J 9/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 07734818.3 (22) 05.06.2007
(43) 18.02.2009
(45) 07.03.2012
(31) MI20061107 (32) 08.06.2006 (33) IT
(86) PCT/IB2007/001547 05.06.2007
(87) WO2007/141647 13.12.2007
(73) Diab International AB, Repslagaregatan Sofiero Ind. OMR, 312 22 Laholm, SE
(72) LAURI, Leone, IT
ANG, Sam Shehyee, US
STIGSSON, Jan Jerry Christian, SE
BRESSAN, Raffaella, IT
(74) Martegani, Franco, et al, Franco Martegani S.r.l. Via Carlo Alberto, 41, 20052 Monza (Milano), IT
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
- (54) **SASTĀVI ŠŪNVEIDA STRUKTŪRAS PUTU POLIMĒRU PRODUKTIEM UZ POLIVINILHLORĪDA BĀZES, UZLABOTI ŠŪNVEIDA STRUKTŪRAS PUTU POLIMĒRU PRODUKTI UZ POLIVINILHLORĪDA BĀZES UN PAŅĒMIENS MINĒTO UZLABOTO ŠŪNVEIDA STRUKTŪRAS PUTU POLIMĒRU PRODUKTU IEGŪŠANAI**
FORMULATIONS FOR CELLULAR, FOAMED - POLYMER PRODUCTS BASED ON POLYVINYL CHLORIDE, IMPROVED CELLULAR, FOAMED-POLYMER PRODUCTS BASED ON POLYVINYL CHLORIDE AND A PROCESS FOR PRODUCING SAID IMPROVED CELLULAR FOAMED-POLYMER PRODUCTS
- (57) 1. Sastāvs šūnveida struktūras putupolimēra produktam uz polivinilhlorīda bāzes, kas satur:
- 35-60 % (mas.) polivinilhlorīda homopolimēra, rēķinot uz kopējo sastāva masu, kura K-vērtība ir no 60 līdz 85 un ūdens ekstrakta pH vērtība ir intervālā no 8 līdz 12;
- 20-50 % (mas.) vismaz viena izocianāta, rēķinot uz kopējo sastāva masu, kurš ir izvēlēts no difenilmetān-4,4'-diizocianāta un modificētu difenilmetān-4,4'-diizocianātu izomēriem un homoloģiem un to maisījumiem;
- 1-20 % (mas.) vismaz viena anhidrīda, rēķinot uz kopējo sastāva masu, kurš ir izvēlēts no dzintarskābes anhidrīda, tetrahidroftalskābes anhidrīda, heksahidroftalskābes anhidrīda, metiltetrahidroftalskābes anhidrīda, 4-metilheksahidroftalskābes anhidrīda, cikloheksān-1,2-dikarbonskābes anhidrīda, metilendometilēntetrahidroftalskābes anhidrīda, dodecenildzintarskābes anhidrīda, trimelītskābes anhidrīda un to maisījumiem;
- vismaz 0,08-0,8 % (mas.) virsmaktīvas vielas, rēķinot uz kopējo sastāva masu;
- vismaz 0,5-7 % (mas.) putas veidojoša līdzekļa, rēķinot uz kopējo sastāva masu.

2. Sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka polivinilhlorīds ir polivinilhlorīda homopolimērs, kura K-vērtība ir no 60 līdz 75 un ūdens ekstrakta pH vērtība ir intervālā no 9 līdz 11.

3. Sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka polivinilhlorīds ir polivinilhlorīda homopolimērs, kura K-vērtība ir 70 un ūdens ekstrakta pH vērtība ir 10.

4. Sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka izocianāts ir izvēlēts no modificētiem difenilmetān-4,4'-diizocianātiem (4,4'-MDI) un to maisījumiem.

5. Sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka izocianāts ir izvēlēts no 4,4'-MDI un 4,4'-MDI, kas reaģē ar karbodiimīdu, lai iegūtu ar uretonimīnu modificētu MDI, maisījumiem.

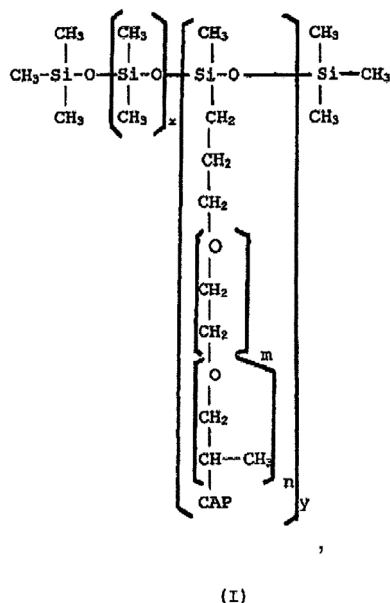
6. Sastāvs saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka maisījums sastāv no aptuveni 70 % 4,4'-MDI un aptuveni 30 % karbodiimīda/uretonimīna maisījuma.

7. Sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka anhidrīdi ir izvēlēti no metiltetrahidroftalskābes anhidrīda, 4-metilheksahidroftalskābes anhidrīda, cikloheksān-1,2-dikarbonskābes anhidrīda un to maisījumiem.

8. Sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka anhidrīds ir cikloheksān-1,2-dikarbonskābes anhidrīda un 4-metilheksahidroftalskābes anhidrīda attiecībā 70/30 maisījums.

9. Sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka virsmaktīvā viela ir izvēlēta no silikonpoliētera piepotētiem kopoliemēriem.

10. Sastāvs saskaņā ar 9. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka silikonpoliētera piepotēti kopolimēri atbilst formulai



kurā: x apzīmē dimetilsiloksāna vienības; Y apzīmē metilsiloksāna vienības; m apzīmē EO vienības; n apzīmē PO vienības un CAP apzīmē bloķēšanas grupas.

11. Sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka putas veidojoši līdzekļi ir izvēlēti no 2,2'-azobisisobutironitrila (AZDN) un azodikarbonamīda (ADC) un to maisījuma.

12. Sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tas satur arī katalizatoru, kas izvēlēts no N,N'-dimetilbenzilamīna vai ceturtdējā N-hidroksialkilamonija karboksilātiem un/vai to maisījuma.

13. Sastāvs saskaņā ar 12. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka ceturtdējā N-hidroksialkilamonija karboksilāts ir $((CH_3)_3N-CH_2-(CH_2)_3CH(OH))^*(HCOO)$.

14. Sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tas satur: polivinilhlorīda homopolimēru, kuram K-vērtība ir 70 un ūdens ekstrakta pH vērtība ir 10; 4,4'-MDI un 4,4'-MDI un kurš reaģē ar karbodiimīdu, lai iegūtu ar uretonimīnu modificētu MDI; cikloheksān-1,2-dikarbonskābes anhidrīda un 4-metilheksahidroftalskābes anhidrīda maisījumu attiecībā 70/30 maisījumu; silikonpoliētera piepotētus kopolimērus saskaņā ar formulu (I); 2,2'-azobisisobutironitrilu (AZDN) un azodikarbonamīdu (ADC).

15. Sastāvs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka sastāva komponentu daudzums, kas izteikti masas procentos, rēķinot uz kopējo sastāva masu, ir sekojošs: polivinilhlorīda daudzums ir intervālā no 40 līdz 55 %; vismaz viena anhidrīda daudzums ir robežās no 2 līdz 15 %; vismaz viena izocianāta daudzums ir robežās no 30 līdz 45 %; vismaz putas veidojoša līdzekļa daudzums ir robežās no 3 līdz 4,5 %; virsmaktīvās vielas daudzums ir vismaz robežās no 0,1 līdz 0,6 %.

16. Sastāvs saskaņā ar 12. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka katalizatora daudzums ir robežās no 0 līdz 0,1 %, vislabāk - no 0,02 līdz 0,05 %.

17. Šūnveida struktūras putupolimēra produkts uz polivinilhlorīda bāzes, kas ir iegūstams, sākot ar sastāvu, kurš sastāv no maisījuma, kas satur:

- 35-60 % (mas.) polivinilhlorīda homopolimēra, rēķinot uz kopējo sastāva masu, kuram K-vērtība ir no 60 līdz 85 un ūdens ekstrakta pH vērtība ir intervālā no 8 līdz 12;

- 20-50 % (mas.) vismaz viena izocianāta, rēķinot uz kopējo sastāva masu, kurš izvēlēts no difenilmetān-4,4'-diizocianāta un modificētu difenilmetān-4,4'-diizocianātu izomēriem un homoloģiem un to maisījumiem;

- 1-20 % (mas.) vismaz viena anhidrīda, rēķinot uz kopējo sastāva masu, kurš ir izvēlēts no dzintarskābes anhidrīda, tetrahidroftalskābes anhidrīda, heksahidroftalskābes anhidrīda, metiltetrahidroftalskābes anhidrīda, 4-metilheksahidroftalskābes anhidrīda, cikloheksān-1,2-dikarbonskābes anhidrīda, metilendometilēntetrahidroftalskābes anhidrīda, dodecenildzintarskābes anhidrīda, trimelītskābes anhidrīda un to maisījumiem;

- vismaz 0,08-0,8 % (mas.) virsmaktīvās vielas, rēķinot uz kopējo sastāva masu;

- vismaz 0,5-7 % (mas.) putas veidojoša līdzekļa, rēķinot uz kopējo sastāva masu.

18. Šūnveida struktūras putupolimēra produkts uz polivinilhlorīda bāzes, kurš ir iegūstams, sākot ar sastāvu saskaņā ar jebkuru no 2. līdz 16. pretenzijai.

19. Paņēmiens šūnveida struktūras putupolimēra produkta iegūšanai, sākot ar sastāvu, kurš sastāv no maisījuma, kas satur:

- 35-60 % (mas.) polivinilhlorīda homopolimēra ekstrakta, kura pH vērtība ir intervālā no 8 līdz 12;

- 20-50 % (mas.) vismaz viena izocianāta, rēķinot uz kopējo sastāva masu, kurš izvēlēts no difenilmetān-4,4'-diizocianāta un modificētu difenilmetān-4,4'-diizocianātu izomēriem un homoloģiem un to maisījumiem;

- 1-20 % (mas.) vismaz viena anhidrīda, rēķinot uz kopējo sastāva masu, kurš izvēlēts no dzintarskābes anhidrīda, tetrahidroftalskābes anhidrīda, heksahidroftalskābes anhidrīda, metiltetrahidroftalskābes anhidrīda, 4-metilheksahidroftalskābes anhidrīda, cikloheksān-1,2-dikarbonskābes anhidrīda, metilendometilēntetrahidroftalskābes anhidrīda, dodecenildzintarskābes anhidrīda, trimelītskābes anhidrīda un to maisījumiem;

- vismaz 0,08-0,8 % (mas.) virsmaktīvās vielas, rēķinot uz kopējo sastāva masu;

- vismaz 0,5-7 % (mas.) putas veidojoša līdzekļa, rēķinot uz kopējo sastāva masu;

pie tam minētajā paņēmienā ietilpst šādas stadijas:

a) maisījuma pagatavošana, sajaucot komponentus maisītājā vakuuma apstākļos, labāk - pie 0,7 līdz 0,99 bāriem, vislabāk - pie 0,8 līdz 0,9 bāriem, lai iegūtu pastveida produktu;

b) stadijā a) iegūtā pastveida produkta ieliešana veidnē un želatīnēšana temperatūras un spiediena ietekmē laika periodā, kas svārstās no 40 sekundēm līdz 1 minūtei, rēķinot uz katru milimetru no pastveida produkta augstuma veidnē, lai iegūtu daļēji uzputotu formētu produktu (embriju);

c) daļēji uzputotā formētā produkta (embrija) dzesēšana līdz istabas temperatūrai;

d) stadijā c) atdzesētā produkta pakļaušana tvaika (80-100°C) iedarbībai gadījumā, ja produktu gala blīvums ir mazāks par 80 kg/m³, lai izplestu līdz gala blīvumam aptuveni 24 stundu laikā, vai

e) stadijā c) atdzesētā produkta pakļaušana karstā ūdens un/vai tvaika (80-100°C) iedarbībai gadījumā, ja produktu gala blīvums ir lielāks par 80 kg/m³, lai izplestu līdz gala blīvumam laika periodā, kas svārstās no 50 minūtēm līdz 2 stundām, pie kam tādā veidā iegūtos izplestus produktus atdzesē līdz istabas temperatūrai un

pēc tam apstrādā ar ūdens aerosolu un/vai tvaiku (40-70°C) līdz izreaģē jebkurš atlikušais izocianāts (sacietēšana), iegūstot sacietējušus blokus vai paneļus.

20. Paņēmiens saskaņā ar 19. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka stadijā b) želatīnēšanu veic temperatūrā, kas ir tipiska PVC želatīnēšanai un svārstās robežās no 150 līdz 200°C, vislabāk - no 160 līdz 180°C, zem spiediena, kas svārstās robežās no 200 līdz 400 bāriem uz cm².

21. Paņēmiens saskaņā ar 19. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka stadijā c) iegūto produktu pirms pakļaušanas stadijai d) vai stadijai e) pakļauj sausas izplešanās stadijai laika periodā, kas svārstās robežās no 1 līdz 2 stundām, temperatūras intervālā no 75 līdz 100°C bezūdens atmosfērā.

22. Bloki vai paneļi, kas ir iegūstami saskaņā ar paņēmienu pēc 19., 20. vai 21. pretenzijas.

- | | | |
|--|---------------------|---------|
| (51) C12C 7/00 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | (11) 2027244 | |
| C12C 7/04 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| C12C 7/14 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| C12C 7/175 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| C12C 7/20 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| C12C 11/00 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| C12H 1/065 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| C12H 1/07 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| C12H 1/06 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| (21) 07747439.3 | (22) 14.05.2007 | |
| (43) 25.02.2009 | | |
| (45) 09.05.2012 | | |
| (31) 06114242 | (32) 19.05.2006 | (33) EP |
| 06114264 | 19.05.2006 | EP |
| (86) PCT/NL2007/050215 | 14.05.2007 | |
| (87) WO2007/136254 | 29.11.2007 | |
| (73) Heineken Supply Chain B.V., Burgemeester Smeetsweg 1, 2382 PH Zoeterwoude, NL | | |
| (72) MULDER, Hendrikus, NL | | |
| (74) Swinkels, Bart Willem, Nederlandsch Octrooibureau, P.O. Box 29720, 2502 LS Den Haag, NL | | |
| Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV | | |
| (54) GAIŠA, AR RAUGU RAUDZĒTA DZĒRIENA RAŽOŠANAS PAŅĒMIENS | | |
| A METHOD OF PRODUCING A BRIGHT, YEAST FERMENTED BEVERAGE | | |

(57) 1. Paņēmiens gaiša, ar raugu raudzēta dzēriena ražošanai, pie kam minētais paņēmiens ietver:

a) daļiņveida, cieti saturoša un eventuāli iesalota izejmateriāla iejavošanu ar ūdeni, iegūtās iejavas karsēšanu un cietes fermentatīvu hidrolizēšanu par fermentējamiem cukuriem;

b) nepārtrauktu raudzējamās misas iegūšanu no izkarsētās iejavas, nepārtrauktā veidā veicot šādus soļus: drabiņu aizvākšanu no izkarsētās iejavas, lai iegūtu iejavas ekstraktu;

iejavas ekstrakta pārvēršanu misā, minēto iejavas ekstraktu karsējot līdz 60-140°C temperatūrai 5-120 minūtes;

gaisīgo organisko vielu aizvākšanu no karstās misas, pazeminot spiedienu un/vai pūšot tai cauri gāzi vai tvaiku;

nogulsniņu aizvākšanu no misas centrifugēšanas ceļā centrifūgā, kas tiek darbināta ar centrālās spēku ar teorētisko caurlaides spējas izmantošanas koeficientu (Σ) vismaz 1,000 m² pie plūsmas ātruma 1 m³/h; un

c) misas ievadīšanu raudzēšanas tvertnē, lai raudzētu misu ar bioloģiski aktīva rauga palīdzību;

d) raudzēšanas produkta pārvietošanu no raudzēšanas tvertnes uz nosēdināšanas tvertni, lai no raudzēšanas produkta nosēdināšanas ceļā aizvāktu raugu; un

e) raudzēšanas produkta ar zemu rauga saturu dzidrināšanu, lai iegūtu gaišu, ar raugu raudzētu dzērienu:

apstrādājot raudzēšanas produktu ar zemu rauga saturu pirms filtrēšanas vienā vai vairākos separatoros, lai aizvāktu suspendēto materiālu, pie kam minētais viens vai vairāki separatori ir izvēlēti(-i) no grupas, kas sastāv no centrifūgām un dekantercentrifūgām, pie tam minētā apstrāde tiek veikta ar teorētisko caurlaides spējas

izmantošanas koeficientu (Σ vērtība) vismaz 1,000 m² pie plūsmas ātruma 1 m³/h; un

filtrējot apstrādāto raudzēšanas produktu;

pie kam vismaz daļa rauga, kas tiek aizvākta no raudzēšanas produkta nosēdināšanas ceļā, tiek recirkulēta uz raudzēšanas tvertni.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam soļos c) un d) izmantotais bioloģiski aktīvais raugs tiek imobilizēts pašagregācijas ceļā.

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam starp 10 un 100 % rauga nogulsniņu, kas tiek aizvāktas no nosēdināšanas tvertnes, tiek recirkulētas uz misas raudzēšanu.

4. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam misa tiek raudzēta nepārtrauktā veidā:

padodot misu pavairošanas tvertnē, kurā tiek pievadīts skābeklis, lai iniciētu rauga augšanu, un

pārvietojot misu no pavairošanas tvertnes uz vienu vai vairākām secīgām raudzēšanas tvertnēm, kurās raugs tiek turēts suspendētā stāvoklī ar maisīšanas, recirkulācijas un/vai oglekļa dioksīda rašanās palīdzību.

5. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam sedimentācijas ceļā tiek aizvākti vismaz 80 masas % un vislabāk - vismaz 90 masas % raudzēšanas produktā esošā rauga.

6. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam nogulsnes tiek aizvāktas centrifūgā, kas tiek darbināta ar centrālās spēku ar teorētisko caurlaides spējas izmantošanas koeficientu (Σ) vismaz 2,500 m², labāk - vismaz 5,000 m² un vislabāk - vismaz 10,000 m² pie plūsmas ātruma 1 m³/h.

7. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam raudzēšanas produkts ar zemu rauga saturu pirms filtrēšanas tiek apstrādāts vienā vai vairākām centrifūgās, pie kam centrifugēšana vismaz vienā no vienas vai vairākām centrifūgām tiek veikta pie Σ vērtības vismaz 2,500 m², labāk - vismaz 5,000 m² pie plūsmas ātruma 1 m³/h.

8. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam raudzēšanas produkta ar zemu rauga saturu dzidrināšana ietver filtrāciju caur porainu slāni vai šķērsplūsmas membrānu filtrāciju.

9. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam raudzēšanas produkts ar būtībā zemu rauga saturu tiek dzidrināts pie caurlaides, kas ir lielāka par 4 hl/h/m², ar spiediena paaugstināšanu ne vairāk par 0,2 bar/h.

10. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam misa tiek raudzēta nepārtrauktā veidā:

padodot misu pavairošanas tvertnē, kurā tā tiek apvienota ar noraudzētās, raugu saturošās misas recirkulēto plūsmu un kurā tiek pievadīts skābeklis, lai iniciētu rauga augšanu; un

pārvietojot misu no pavairošanas tvertnes uz vienu vai vairākām secīgām raudzēšanas tvertnēm, kurās raugs tiek turēts suspendētā stāvoklī ar maisīšanas, recirkulācijas un/vai oglekļa dioksīda rašanās palīdzību;

padodot noraudzēto misu vienā vai vairākās nosēdināšanas tvertnēs, lai aizvāktu raugu saturošās nogulsnes;

recirkulējot vismaz daļu raugu saturošo nogulsniņu uz pavairošanas tvertni un/vai vienu vai vairākām raudzēšanas tvertnēm, un pārvēršot noraudzētās misas atlikumu gaišā, ar raugu raudzētā dzērienā.

11. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam soļi no b) līdz d) tiek izpildīti nepārtrauktā veidā.

12. Paņēmiens saskaņā ar 11. pretenziju, pie kam soļi no a) līdz d) tiek izpildīti nepārtrauktā veidā.

13. Paņēmiens saskaņā ar 11. vai 12. pretenziju, pie kam visi soļi, kas tiek izpildīti nepārtrauktā veidā, tiek realizēti nepārtraukti vismaz 2 nedēļas, labāk - vismaz 4 nedēļas.

14. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam drabiņas tiek aizvāktas no uzkarstās iejavas ar vienu vai vairāku separatoru palīdzību, kas ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no centrifūgām un dekanteriem.

15. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam iejavai vai misai tiek pievienota glikanāze.

16. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, pie kam raudzēšanas produkts ar zemu rauga saturu tiek dzidrināts pie plūsmas ātruma vismaz 40 hl/h.

- (51) **H02K 9/18**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2030308**
H02K 1/32⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 07718509.8 (22) 20.06.2007
 (43) 04.03.2009
 (45) 02.05.2012
 (31) 10612006 (32) 22.06.2006 (33) AT
 (86) PCT/AT2007/000300 20.06.2007
 (87) WO2007/147187 27.12.2007
 (73) Andritz Hydro GmbH, Penzinger Straße 76, 1141 Wien, AT
 (72) HARB, Walter, AT
 ERHARD, Johannes, AT
 FARNLEITNER, Ernst, AT

- (74) Schweinzer, Friedrich, Stattegger Strasse 18, 8045 Graz, AT

Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV

(54) **IEGREMDĒTA HIDROĢENERATORA DZESĒŠANAS PAŅĒMIENS UN IEGREMDĒTAIS HIDROĢENERATORS METHOD FOR COOLING A SUBMERGED HYDRAULIC TURBINE-GENERATOR AND SUBMERGED HYDRAULIC TURBINE-GENERATOR**

(57) 1. Paņēmiens kapsulas tipa hidroturbīnas ģeneratorā (1) esošā statora (4) un rotora (3) ar izvīrtu polu tinumu (5) dzesēšanai, kurā gāzveida dzesētājaģents cirkulē kapsulas tipa hidroturbīnas ģeneratora (1) ķēdē, ar vismaz vienu ārēji piedzenamu ventilatoru (10), pie kam dzesētājaģents tiek izvadīts no kapsulas tipa hidroturbīnas ģeneratora (1) ar ventilatoru (10) un tiek nogādāts uz statoru (4), to ievadot starp statoru (4) un korpusu (2) tādā veidā, ka dzesētājaģents tiek atdzesēts ar aukstā ūdens padevi, kas plūst pāri kapsulas tipa hidroturbīnas ģeneratora (1) korpusa (2) ārpusē,

kas raksturīgs ar to, ka dzesētājaģents ar ventilatoru (10) tiek aizvadīts uz dzesēšanas ierīci (12), kurā siltais dzesētājaģents tiek atdzesēts, tad atdzesētais dzesētājaģents tiek aizvadīts uz statoru (4), to ievadot starp statoru (4) un korpusu (2), no kurienes tiek virzīts radiāli uz iekšu caur radiālām statora spraugām (28) statora serdenī (25), kur tiek sasildīts, pie tam dzesētājaģenta daļa tiek izvadīta ārā aksiāli caur gaisa spraugu (23) starp statoru (4) un rotoru (3) un turpmākajā procesā tiek sasildīta, bez tam dzesētājaģenta daļa, kas izplūst no statora (4), tiek iespiesta rotora (3) polu spraugās (20) un caur polu spraugām (20) aksiāli tiek izvadīta ārā.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka dzesētājaģents, kas izplūst no dzesēšanas ierīces (12), tiek aizvadīts uz statoru (4) pa padeves kanālu (13).

3. Paņēmiens saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka dzesētājaģenta daļa, kas izplūst aksiāli no gaisa spraugas (23) un, iespējams, no polu spraugām (20), tiek virzīta pāri statora (4) gala tinumam (6).

4. Paņēmiens saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka dzesētājaģents, kas izplūst aksiāli no gaisa spraugas (23) un, iespējams, no polu spraugām (20), tiek virzīts pāri statora (4) gala tinumam (6).

5. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka dzesētājaģenta daļa, kas izplūst aksiāli no gaisa spraugas (23) un, iespējams, no polu spraugām (20), izplūst caur rotora (3) krusteņa (8) atverēm (11) no rotora (3) vienas puses uz otru.

6. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka dzesētājaģenta daļa, kas izplūst cauri statora spraugai (28), tiek aizvadīta caur radiāliem kanāliem rotorā (3).

7. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka dzesētājaģenta daļa, kas izplūst no dzesēšanas ierīces (12), tiek aizvadīta tieši uz statora tinumu vienu galu (6).

8. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka siltais dzesētājaģents, kas izplūst no gaisa spraugas (23) un, iespējams, no polu spraugām (20), tiek izvadīts uz katru elektroģeneratora (1) pusi ar vismaz vienu ārēji piedzenamu ventilatoru (10).

9. Kapsulas tipa hidroturbīnas ģenerators (1), kas satur: statoru (4); rotoru (3) ar izvīrtu polu tinumiem (5) un polu spraugām (20); korpusu (2) ar aukstā ūdens, kas tam plūst pāri, padevi; vismaz vienu ārēji piedzenamu ventilatoru (10), lai gāzveida dzesētājaģentu cirkulētu korpusa (2) ķēdē, pie kam: ventilators (10) ir

piemērots silta dzesētājaģenta aksiālai izvadei no gaisa spraugas (23) starp statoru (4) un rotoru (3); stators (4) ir izveidots ar radiālu atstarpi no kapsulas tipa hidroturbīnas ģeneratora (1) korpusa (2); kapsulas tipa hidroturbīnas ģeneratora (1) rotors (3) un stators (4) ir izvietoti ventilatora (10) ieklūdes pusē,

kas ir raksturīgs ar dzesēšanas ierīci (12), kura ir izveidota siltā dzesētājaģenta atdzesēšanai, pie kam: dzesētājaģents, kas izplūst no dzesēšanas ierīces (12), ir piemērots izplūdei starp statoru (4) un korpusu (2); dzesēšanas ierīce (12) ir uzstādīta ventilatora (12) spiediena pusē; dzesētājaģents, kas polu spraugās (20) ir ieklūdis caur radiālām statora spraugām (28), ir piemērots, lai ar ventilatoru (10) to aksiāli izvadītu no polu spraugām (20).

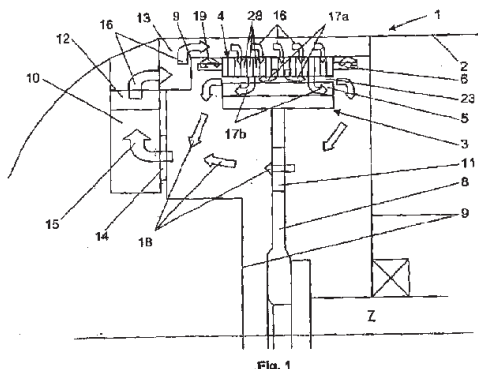
10. Kapsulas tipa hidroturbīnas ģenerators saskaņā ar 9. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka padeves kanāls (13) ir izveidots starp dzesēšanas ierīci (12) un statoru (4).

11. Kapsulas tipa hidroturbīnas ģenerators saskaņā ar 9. vai 10. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka ir aprīkots ar līdzekļiem, ar kuriem virzīt auksto dzesētājaģentu, kas izplūst no dzesēšanas ierīces (12), tieši uz statora tinumu vienu galu (6).

12. Kapsulas tipa hidroturbīnas ģenerators saskaņā ar 9., 10. vai 11. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka rotorā (3) dzesētājaģenta plūsmā ir izveidoti radiāli kanāli.

13. Kapsulas tipa hidroturbīnas ģenerators saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 12. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka uz rotora (3) krusteņa (8) ir izvietoti rotora tinumi (5), un ar to, ka uz krusteņa (8) ir izveidota atvere (11), kas ir piemērota aksiālas plūsmas vadīšanai.

14. Kapsulas tipa hidroturbīnas ģenerators saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 13. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka katrā elektroģeneratora (1) pusē ir uzstādīts vismaz viens ārēji piedzenams ventilators (10).



- (51) **B62K 23/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2032423**
B60L 7/16⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
G01D 5/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 07798430.0 (22) 12.06.2007
 (43) 11.03.2009
 (45) 28.03.2012
 (31) 813364 P (32) 14.06.2006 (33) US
 (86) PCT/US2007/070980 12.06.2007
 (87) WO2007/146927 21.12.2007
 (73) Vectrix International Limited, 2/F Gold Peak Building, 30 Kwai Wing Road, Kwai Chung, New Territories Hong Kong, CN
 (72) DUGAS, David, US
 BLISS, Craig, US
 HUGHES, Peter S., US
 (74) Grünecker, Kinkeldey, Stockmair & Schwanhäusser Anwaltssozietāt, Leopoldstrasse 4, 80802 München, DE
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
 (54) **TRANSPORTLĪDZEKĻA JAUDAS REGULĒŠANAS IERĪCE VEHICLE POWER CONTROL DEVICE**
 (57) 1. Transportlīdzekļa jaudas regulēšanas ierīce (70), kas satur:
 - droseles montāžas aprīkojumu (69);

- droseļi (30), kas kustīgi uzstādīti uz droseles montāžas aprīkojuma (69) un ir konfigurēti tā, ka braucējs ar to var manipulēt un veikt operācijas;

- sensoru (35), kas ir uzstādīts uz vienas no droseļiem (30), un droseles montāžas aprīkojuma (69), kas ir bezkontakta mijiedarbībā ar kādu citu droseļi (30) un ar droseles montāžas aprīkojumu (69), uz kura sensors (35) nav uzstādīts, pie kam sensors (35) ir konfigurēts droseles (30) pozīcijas uzraudzīšanai attiecībā pret montāžas aprīkojumu (69) bezkontakta mijiedarbības ceļā un signāla radīšanai, kurš pamatojas uz uzraudzīto pozīciju, transportlīdzekļa dzinējspēka regulēšanai, pie kam: sensors (35) ir izveidots droseles (30) absolūtās pozīcijas uzraudzīšanai attiecībā pret droseles montāžas aprīkojumu (69) un droseļiem (30) nav nepieciešams veikt relatīvu kustību attiecībā pret droseles montāžas aprīkojumu (69);

- magnētisko elementu (28), kuram ir magnētiskais lauks un kurš mijiedarbojas ar kādu citu droseļi (30) un droseles montāžas aprīkojumu (69), uz kura sensors (35) nav uzstādīts, pie kam sensors (35) ir konfigurēts magnētiskā lauka uzraudzīšanai un droseles (30) pozīcijas uzraudzīšanai, kā arī sensors (35) ir konfigurēts magnētiskā lauka orientācijas uzraudzīšanai un droseles (30) pozīcijas uzraudzīšanai;

- atbalsta elementu (26), kas balsta vienu no magnētiskajiem elementiem un sensoru iepriekšminētā pirmā elementa darbināšanai attiecībā pret otro, lai magnētisko lauku pie sensora orientētu iepriekš noteiktā orientācijā, kad drosele (30) ir iepriekš noteiktā pozīcijā;

kas raksturīga ar to, ka jaudas regulēšanas ierīce papildus satur:

- bloķēšanas līdzekli, kas ir izveidots atbalsta elementa (26) bloķēšanai minētajā iepriekš noteiktajā pozīcijā, kad šāda pozīcija ir sasniegta, lai minēto magnētiskā elementa (28) orientāciju attiecībā pret sensoru (35) ar droseļi (30) saglabātu minētajā iepriekš noteiktajā pozīcijā sensora (35) kalibrēšanai; un vītņotu elementu (22), kuram ir vītnes un kas ir piestiprināts droselei (30), pie kam:

- atbalsta elements (26) ar vītņiem mijiedarbojas ar vītņoto elementu (22) tā, ka tas atbalsta elementā var griezties, un atbalsta elements (26) satur pirmo un otro vītņotās daļas, kuras viena attiecībā pret otru ir kustīgas un kuras ir vītņveidā saistītas;

- bloķēšanas līdzeklis ir konfigurēts, lai noliektu pirmo lokano daļu attiecībā pret otro lokano daļu un lai bloķētu atbalsta elementu (26) attiecībā pret vītņoto elementu (22), ar pagriešanu aptverot vītņotā elementa (22) vītnes.

2. Jaudas regulēšanas ierīce saskaņā ar 1. pretenziju, kurā:

- drosele (30) var griezties ap asi (71);
 - magnētiskajam elementam (28) ir magnētiskie poli, kuri ir novietoti atšķirīgās radiālās un perimetra vietās attiecībā pret asi (71) tā, ka magnētiskais lauks pie sensora maina orientāciju atkarībā no tā, kā tiek pārvietota drosele.

3. Jaudas regulēšanas ierīce saskaņā ar 2. pretenziju, kurā sensors (35) satur diferenciālo Holla efekta sensoru, kas ir konfigurēts magnētiskā lauka absolūtās orientācijas uzraudzīšanai, pie kam droselei (30) nav nepieciešams veikt relatīvu kustību attiecībā pret droseles montāžas aprīkojumu (69).

4. Jaudas regulēšanas ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā signāls ir impulsu platuma modulācijas signāls, pie kam impulsa platums ir saistīts ar uzraudzīto droseles pozīciju.

5. Jaudas regulēšanas ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas papildus satur droseles nobīdes bloku (55), lai droseļi (30) elastīgi nobīdītu uz neitrālu pozīciju attiecībā pret sensoru (35), pie kam nobīdes bloks ir izveidots mazākās nobīdes piemērošanai droselei (30) neitrālās pozīcijas virzienā, ja drosele (30) ir pārvietota no neitrālās pozīcijas uz tās vienu sānu, salīdzinot ar nobīdi, ja drosele ir pārvietota no neitrālās pozīcijas uz tās otra sānu.

6. Jaudas regulēšanas ierīce saskaņā ar 5. pretenziju, kurā droseles (30) griešanās nodrošināšanai no neitrālās pozīcijas pirmajā pusē ir nepieciešams paātrinājums, bet griešanās nodrošināšanai otrā pusē ir nepieciešama reģeneratīvā bremzēšana vai virzienmaiņa.

7. Jaudas regulēšanas ierīce saskaņā ar 5. vai 6. pretenziju, kurā nobīdes bloks satur:

- vienu nobīdes elementu (44, 46), kas ir izveidots droseles (30) nobīdei vienā virzienā no pirmās puses virzienā uz neitrālo pozīciju, un

- otru nobīdes elementu (50, 52), kas ir izveidots droseles (30) nobīdei otrā virzienā, kas ir pretējs pirmajam virzienam, lai nodrošinātu lielāku nobīdi, kad drosele ir otrā pusē, nekā tad, kad tā ir pirmajā pusē.

8. Jaudas regulēšanas ierīce saskaņā ar jebkuru no 5. līdz 6. pretenzijai, kurā nobīdes bloks ir izveidots tā, ka viens nobīdes elements (44, 46) ir nobīdes mijiedarbībā ar droseļi (30), kad drosele ir abās pusēs – gan pirmajā, gan otrajā pusē, bet otrais nobīdes elements (50, 52) ir nobīdes mijiedarbībā ar droseļi (30), kad drosele ir otrajā pusē, un nav saistīts ar droseļi, kad drosele ir pirmajā pusē.

9. Jaudas regulēšanas ierīce saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā sensors (35) ir uzstādīts uz droseles montāžas aprīkojuma (69) un ir bezkontakta mijiedarbībā ar droseļi (30).

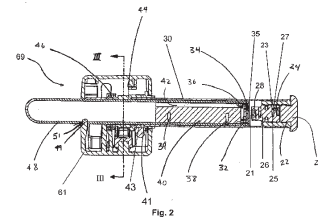
10. Transportlīdzeklis (130), kas satur:

- transportlīdzekļa jaudas regulēšanas ierīci (70) saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām;

- motoru (100), kas ir izveidots dzinējspēka nodrošināšanai transportlīdzeklī;

- kontrolleri (118), kas ir pievienots, lai uztvertu signālu no sensora (35) un iedarbinātu motoru (100) ar jaudu, kas atkarīga no droseles (30) pozīcijas;

- roksviras (48), kuras ir izveidotas transportlīdzekļa vadīšanai, pie kam sensors (35) ir saistīts ar roksvirām (48), un drosele (30) ir pagriežama drosele, kas ir uzstādīta uz roksvirām (48) un kuras lietotājs var satvert, lai darbinātu droseļi un grozītu roksviras.

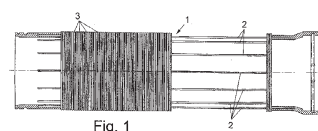


- (51) **B01D 29/46**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2033701**
- (21) 08162963.6 (22) 26.08.2008
- (43) 11.03.2009
- (45) 21.03.2012
- (31) 202007012613 U (32) 08.09.2007 (33) DE
- (73) Stüwa Konrad Stükerjürgen GmbH, Hemmersweg 80, 33397 Rietberg, DE
- (72) STÜKERJÜRGEN, Ralf, DE
- Izgudrotājs ir atteicies no tiesībām tikt uzraudzītam
- (74) Dantz, Jan Henning, et al, Loesenbeck - Specht - Dantz Patent- und Rechtsanwälte, Am Zwinger 2, 33602 Bielefeld, DE
- ANDA BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
- (54) **AKAS FILTRS**
FOUNTAIN FILTER

(57) 1. Akas filtrs (1), kas ietver vairākus gredzenveida plastmasas filtra diskus (3), kuri ir uzmaukti uz savienotājstieniem (2), kas vērsti akas filtra (1) ass virzienā, kas raksturīgs ar to, ka filtra diski (3) ir izgatavoti no caurspīdīga stirola akrilonitrila (SAN).

2. Akas filtrs saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka filtra diski (3) ir izgatavoti, izmantojot spiedienliešanas metodi.

3. Akas filtrs saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka filtra diskus (3) ir izveidota sevišķi gluda virsma, pielietojot zināmās šim nolūkam piemērotas metodes, piemēram, ar nanotehniku.



- (51) **B01J 23/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2038054**
 (21) 07786800.8 (22) 22.06.2007
 (43) 25.03.2009
 (45) 21.03.2012
 (31) 06115928 (32) 23.06.2006 (33) EP
 (86) PCT/EP2007/056228 22.06.2007
 (87) WO2007/147881 27.12.2007
 (73) YARA International ASA, P.O. Box 2464, Solli, 0202 Oslo, NO

(72) PÉREZ RAMÍREZ, Javier, ES
 ABELLÓ CROS, Sonia, ES
 SANTIAGO REDONDO, Marta, ES
 SCHELVER, Morten, NO
 WALLER, David, NO

(74) Onsagers AS, Universitetsgaten 7, P.O. Box 6963, St. Olavs plass, 0130 Oslo, NO
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV

(54) **PAŅĒMIENS VIENDABĪGU NANOIZMĒRA CIETU VIELU IEGŪŠANAI, IZMANTOJOT NEPĀRTRAUKTU IZGULSNĒŠANU**
A PROCESS FOR THE PREPARATION OF UNIFORM NANO-SIZED SOLID MATERIALS BY CONTINUOUS PRECIPITATION

(57) 1. Nanoizmēra cietu vielu iegūšanas paņēmieni, veicot nepārtrauktu izgulsnēšanu konstantā temperatūrā un konstantā pH, pie kam paņēmieni satur sekojošas stadijas:

- vismaz divu šķīdumu padeve zem atmosfēras spiediena mazā reaktorā ar tilpumu no 0,5 līdz 100 ml, kontrolējot padeves ātrumu, lai iegūtu iepriekš izvēlētu uzturēšanas laiku mazajā reaktorā, ne lielāku par 36 s,
- šķīdumu maisīšana mazajā reaktorā ar rotējošu elementu, lai iegūtu lāpstīgrīteņa Reinoldsa skaitļus, lielākus par 10^4 , un
- maisījuma konstanta pH uzturēšana, izmantojot *in-line* pH zondi, kas atrodas mazā reaktora izplūdes līnijā, kas atbilstoši regulē šķīdumu padeves ātrumu.

2. Paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju atšķiras ar to, ka nanoizmēra cietās vielas ir izvēlētas no grupas, kas sastāv no katalizatoriem, katalizatoru prekursoriem, katalizatoru nesējiem un katalizatoru nesēju prekursoriem.

3. Paņēmieni saskaņā ar 2. pretenziju atšķiras ar to, ka nanoizmēra cietās vielas ir izvēlētas no grupas, kas sastāv no oksīdu katalizatoriem, metālu hidroksīdiem, hidratētiem oksīdiem, hidroksikarbonātiem un oksihidroksīdiem, oksoperoksohidroksīdiem, nitrīdiem, karbīdiem, sulfīdiem.

4. Paņēmieni saskaņā ar 2. vai 3. pretenziju, kurā papildus ietilpst aktivācijas stadija, kas izvēlēta no grupas, kas ietver parastu uzturēšanu, apstarošanu ar mikroviļņiem, apstrādi ar ultraskaņu, termisko apstrādi vai to kombināciju.

5. Paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju, kurā:

- šķīdumi, kurus ievada mazajā reaktorā, ir $Mg(NO_3)_2$ ūdens šķīduma un $Al(NO_3)_3$ ūdens šķīduma maisījums un otrs šķīdums ir izgulsnējošā reaģenta ($NaOH + Na_2CO_3$) ūdens šķīdums istabas temperatūrā,

- maisīšanas ātrums ir diapazonā no 300 līdz 24000 apgr./min.,
- uzturēšanās laiks reaktorā ir mazāks par 4,5 s, vislabāk - mazāks par 1 s, un

- pH uztur pH 10 līmenī, lai iegūtu hidrotalcīta vielu ar molāro Mg/Al attiecību diapazonā no 1 līdz 5, kurā ietilpst kristalīti ar izmēru no 3 nm līdz 4 nm, kuri ir apvienoti kristālos ar izmēru no 20 nm līdz 45 nm, ir praktiski ar gludām virsmām un kuru virsmas laukums ir no 0,1 līdz $3\text{ m}^2\text{g}^{-1}$.

6. Paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju, kurā:

- šķīdumi, kurus ievada mazajā reaktorā, ir $Mg(NO_3)_2$ ūdens šķīduma un $Al(NO_3)_3$ ūdens šķīduma maisījums un otrs šķīdums ir izgulsnējošā reaģenta ($NaOH + Na_2CO_3$) ūdens šķīdums istabas temperatūrā,

- maisīšanas ātrums ir diapazonā no 300 līdz 24000 apgr./min.,
- uzturēšanās laiks reaktorā ir no 12 līdz 18 s, un

- pH uztur pie pH 10 līmenī, lai iegūtu hidrotalcīta vielu ar molāro Mg/Al attiecību diapazonā no 1 līdz 5, kurā ietilpst kristalīti ar izmēru no 5 nm līdz 11 nm, kuri ir apvienoti plakanās daļiņās, kuru izmērs ir no 20 līdz 30 nm garš un no 10 līdz 20 nm biezs ar poru izmēra sadalījumu no 5 līdz 200 nm, virsmas laukumiem diapazonā no 85 līdz $130\text{ m}^2\text{g}^{-1}$ un kopējo poru tilpumu no 0,30 līdz $0,78\text{ cm}^3\text{g}^{-1}$.

7. Paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju, kurā:

- šķīdumi, kurus ievada mazajā reaktorā, ir $Al(NO_3)_3$ ūdens šķīdums, M-nitrāta un/vai N-nitrāta ūdens šķīdums, kur M ir divvērtīgu metālu jons, kas ir izvēlēts no: Ni^{2+} , Co^{2+} , Mn^{2+} , Cu^{2+} , un N ir trīsvērtīgu metālu jons, kas ir izvēlēts no: La^{3+} , Fe^{3+} , un $(NH_4)_2CO_3$ ir ūdens šķīdums ar temperatūru 333K,

- maisīšanas ātrums ir 13500 apgr./min.,
- uzturēšanas laiks ir 18 s, un

- pH uztur līmenī no pH 7,5 līdz 8, lai iegūtu dauzonīta vielu ar vispārējo formulu $NH_4^+M_xN_yAl_{1-x-y}(CO_3)(OH)_z$, kur x un y neatkarīgi ir no 0 līdz 1, kurā ietilpst kristalīti ar izmēru no 8 nm līdz 12 nm, kuri ir apvienoti daļiņās ar izmēru no 20 nm līdz 30 nm ar poru izmēra sadalījumu no 4 līdz 20 nm, virsmas laukumu vismaz $650\text{ m}^2\text{g}^{-1}$ un kopējo poru tilpumu vismaz $1,7\text{ cm}^3\text{g}^{-1}$.

8. Paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju, kurā:

- šķīdumi, kurus ievada mazajā reaktorā, ir $Al(NO_3)_3$ ūdens šķīdums, M-nitrāta un/vai N-nitrāta ūdens šķīdums, kur M ir divvērtīgu metālu jons, kas ir izvēlēts no: Ni^{2+} , Co^{2+} , Mn^{2+} , Cu^{2+} , un N ir trīsvērtīgu metālu jons, kas ir izvēlēts no: La^{3+} , Fe^{3+} , un $(NH_4)_2CO_3$ ūdens šķīdums ar temperatūru 333K,

- maisīšanas ātrums ir 13000 apgr./min.,
- uzturēšanas laiks ir 18 s, un

- pH uztur līmenī no pH 7,5 līdz 8, lai iegūtu alumīnija oksīda vielu, kas, iespējams, ir modificēta ar vismaz vienu metālu, ar virsmas laukumu no 350 līdz $550\text{ m}^2\text{g}^{-1}$ un kopējo poru tilpumu no 0,9 līdz $1,6\text{ cm}^3\text{g}^{-1}$, kurā ietilpst kristalīti ar izmēru, mazāku par 2 nm, kuri ir apvienoti ultrasmalkās daļiņās ar vienādu vidējo izmēru, mazāku par 10 nm.

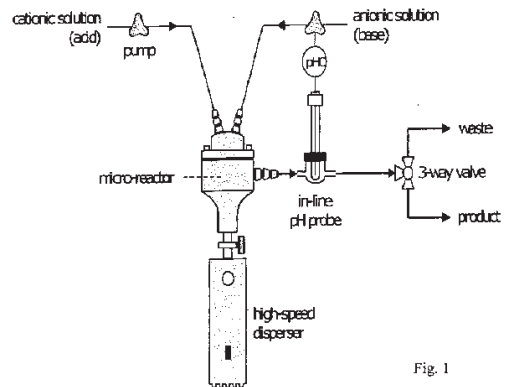
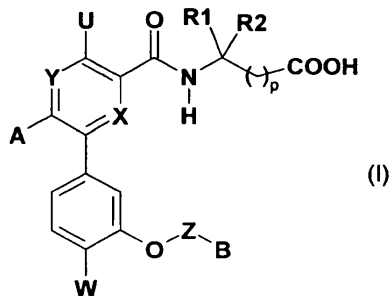


Fig. 1

- (51) **C07D 213/60**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2059508**
C07D 241/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 401/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/435⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 9/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 07823409.3 (22) 09.08.2007
 (43) 20.05.2009
 (45) 11.04.2012
 (31) 0607283 (32) 11.08.2006 (33) FR
 (86) PCT/FR2007/001357 09.08.2007
 (87) WO2008/020124 21.02.2008
 (73) SANOFI, 174, Avenue de France, 75013 Paris, FR
 (72) ALTENBURGER, Jean-Michel, FR
 FOSSEY, Valerie, FR
 LASSALLE, Gilbert, FR
 PETIT, Frédéric, FR
 VERNIERES, Jean-Claude, FR
 JANIAC, Philip, FR
 (74) Fischer, Hans-Jürgen, et al, Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, Patents Germany, Industriepark Höchst, Gebäude K 801, 65926 Frankfurt am Main, DE
 Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
 (54) **5,6-BISARIL-2-PIRIDĪN-KARBOKSAMĪDA ATVASINĀJUMI, TO IEGŪŠANA UN IZMANTOŠANA TERAPIJĀ PAR UROTENŽĪNA II RECEPTORA ANTAGONISTIEM**

5,6-BISARYL-2-PYRIDINE-CARBOXAMIDE DERIVATIVES, PREPARATION AND APPLICATION THEREOF IN THERAPEUTICS AS UROTENSIN II RECEPTOR ANTAGONISTS

(57) 1. Savienojumi, kas atbilst formulai (I):



kur:

X un Y neatkarīgi viens no otra attēlo slāpekļa atomu vai -CR3- grupu, kur R3 attēlo ūdeņraža atomu vai halogēna atomu, vai alkilgrupu, vai alkoksigrupu;

U attēlo ūdeņraža atomu vai NHR7 grupu, kur R7 ir ūdeņraža atoms vai alkilgrupa;

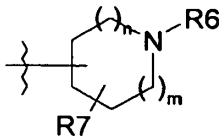
A attēlo arilgrupu, heteroarilgrupu vai heterocikloalkilgrupu, neobligāti aizvietotu;

W attēlo halogēna atomu, alkilgrupu vai halogēnalkilgrupu;

Z attēlo saiti, cikloalkilēngrupu vai alkilēngrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākām grupām, kas izvēlētas no halogēna atoma un alkilgrupas, hidroksilgrupas un alkoksigrupas;

B attēlo:

vai nu -NR4R5 grupu, kur R4 un R5 attēlo neatkarīgi viens no otra alkilgrupu, cikloalkilgrupu, hidroksilalkilgrupu vai fluoralkilgrupu, vai alternatīvi R4 un R5 ar slāpekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido 5- vai 6-locekļu gredzenu, tādu kā piperidīnā un piperidīnā grupas gredzenu, neobligāti aizvietotu ar alkilgrupu, vai heterociklu ar šādu formulu:



kur m un n attēlo neatkarīgi viens no otra 0, 1 vai 2 un kur R6 un R7 attēlo neatkarīgi viens no otra ūdeņraža atomu vai alkilgrupu, vai cikloalkilgrupu;

R1 un R2 attēlo:

vai nu neatkarīgi viens no otra ūdeņraža atomu, vai alkilgrupu, cikloalkilgrupu, fenilgrupu, benzilgrupu vai -CH2-indolilgrupu, pie kam šīs grupas ir neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām grupām, kas izvēlētas no halogēna atomiem un alkilgrupas, fluoralkilgrupas, alkoksigrupas, hidroksilgrupas un -O-CO-alkilgrupas, vismaz viens no R1 vai R2 nav ūdeņraža atoms,

vai R1 un R2 kopā ar oglekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido mono- vai policiklisku sistēmu, kas izvēlēta no: cikloalkilgrupas, indanilgrupas, tetrahidropiranilgrupas, piperidīna, tetrahidronaftilgrupas, biciklo[2.2.1]heptilgrupas, biciklo[3.3.1]nonilgrupas un adamantilgrupas, pie kam minētā mono- vai policikliskā sistēma ir neobligāti aizvietota jebkurā pozīcijā (ieskaitot pie slāpekļa atoma, ja piemērots) ar vienu vai vairākām grupām, kas izvēlētas no alkilgrupas, fluoralkilgrupas, hidroksilgrupas, alkoksigrupas, -O-CO-alkilgrupas un acilgrupas;

p attēlo veselu skaitli, vienādu ar 0 vai 1;

to sāji, to hidrāti vai solvāti, kā arī to enantiomēri un diastereoizomēri, ieskaitot to racēmiskos maisījumus.

2. Savienojumi saskaņā ar 1. pretenziju, kur X un Y neatkarīgi viens no otra attēlo slāpekļa atomu vai -CR3-grupu, kur R3 attēlo ūdeņraža atomu vai halogēna atomu, vai alkilgrupu, vai alkoksigrupu;

to sāji, to hidrāti vai solvāti, kā arī to enantiomēri un diastereoizomēri, ieskaitot to racēmiskos maisījumus.

3. Savienojumi saskaņā ar 1. pretenziju, kur U attēlo ūdeņraža atomu vai NHR7 grupu, kur R7 ir ūdeņraža atoms vai alkilgrupa;

to sāji, to hidrāti vai solvāti, kā arī to enantiomēri un diastereoizomēri, ieskaitot to racēmiskos maisījumus.

4. Savienojumi saskaņā ar 1. pretenziju, kur A attēlo arilgrupu, heteroarilgrupu vai heterocikloalkilgrupu, kas izvēlēta no fenilgrupas, benzodioksolilgrupas, tienilgrupas, tiazolilgrupas, piperidilgrupas, pirimidinilgrupas, piridazinilgrupas, pirazinilgrupas, pirazolilgrupas un pirolidinongrupas, pie kam minētā arilgrupa, heteroarilgrupa vai heterocikloalkilgrupa ir neobligāti aizvietota jebkurā pozīcijā ar vienu vai vairākām grupām, kas izvēlētas no halogēna atoma un ciāngrupas, alkilgrupas, halogēnalkilgrupas, hidroksilgrupas, alkoksigrupas, -O-(CH2)p-O-alkilgrupas, halogēnalkoksigrupas, -NRR', -NR-CO-alkilgrupas, -SO- un -SO2-alkilgrupām, kur R un R' attēlo neatkarīgi viens no otra ūdeņraža atomu vai alkilgrupu un p ir vesels skaitlis no 1 līdz 5;

to sāji, to hidrāti vai solvāti, kā arī to enantiomēri un diastereoizomēri, ieskaitot to racēmiskos maisījumus.

5. Savienojumi saskaņā ar 1. pretenziju, kur W attēlo halogēna atomu, alkilgrupu vai halogēnalkilgrupu;

to sāji, to hidrāti vai solvāti, kā arī to enantiomēri un diastereoizomēri, ieskaitot to racēmiskos maisījumus.

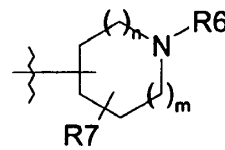
6. Savienojumi saskaņā ar 1. pretenziju, kur Z attēlo saiti, cikloalkilēngrupu vai alkilēngrupu, neobligāti aizvietotu ar vienu vai vairākām grupām, kas izvēlētas no halogēna atoma un alkilgrupas, hidroksilgrupas un alkoksigrupas;

to sāji, to hidrāti vai solvāti, kā arī to enantiomēri un diastereoizomēri, ieskaitot to racēmiskos maisījumus.

7. Savienojumi saskaņā ar 1. pretenziju, kur B attēlo -NR4R5 grupu, kur R4 un R5 attēlo, neatkarīgi viens no otra, alkilgrupu, cikloalkilgrupu, hidroksilalkilgrupu vai fluoralkilgrupu, vai alternatīvi R4 un R5 ar slāpekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido 5- vai 6-locekļu gredzenu, tādu kā piperidīnā un piperidīnā grupas gredzenu, neobligāti aizvietotu ar alkilgrupu,

to sāji, to hidrāti vai solvāti, kā arī to enantiomēri un diastereoizomēri, ieskaitot to racēmiskos maisījumus.

8. Savienojumi saskaņā ar 1. pretenziju, kur B attēlo heterociklu ar šādu formulu:



kur m un n attēlo, neatkarīgi viens no otra, 0, 1 vai 2 un kur R6 un R7 attēlo, neatkarīgi viens no otra, ūdeņraža atomu vai alkilgrupu, vai cikloalkilgrupu;

to sāji, to hidrāti vai solvāti, kā arī to enantiomēri un diastereoizomēri, ieskaitot to racēmiskos maisījumus.

9. Savienojumi saskaņā ar 1. pretenziju, kur R1 un R2 attēlo, neatkarīgi viens no otra, ūdeņraža atomu vai alkilgrupu, cikloalkilgrupu, fenilgrupu, benzilgrupu vai -CH2-indolilgrupu, pie kam šīs grupas ir neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām grupām, kas izvēlētas no halogēna atomiem un alkilgrupas, fluoralkilgrupas, alkoksigrupas, hidroksilgrupas un -O-CO-alkilgrupas, vismaz viens no R1 vai R2 nav ūdeņraža atoms,

to sāji, to hidrāti vai solvāti, kā arī to enantiomēri un diastereoizomēri, ieskaitot to racēmiskos maisījumus.

10. Savienojumi saskaņā ar 1. pretenziju, kur R1 un R2 kopā ar oglekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido mono- vai policiklisku sistēmu, kas izvēlēta no: cikloalkilgrupas, indanilgrupas, tetrahidropiranilgrupas, piperidīna, tetrahidronaftilgrupas, biciklo[2.2.1]heptilgrupas, biciklo[3.3.1]nonilgrupas un adamantilgrupas, minētā mono- vai policikliskā sistēma ir neobligāti aizvietota jebkurā pozīcijā (ieskaitot pie slāpekļa atoma, ja piemērots) ar vienu vai vairākām grupām, kas izvēlētas no halogēna atoma un alkilgrupas, fluoralkilgrupas, hidroksilgrupas, alkoksigrupas, -O-CO-alkilgrupas un acilgrupas;

to sāji, to hidrāti vai solvāti, kā arī to enantiomēri un diastereoizomēri, ieskaitot to racēmiskos maisījumus.

11. Savienojumi saskaņā ar 1. pretenziju, kur:

X un Y attēlo, neatkarīgi viens no otra, slāpekļa atomu vai -CR3- grupu, kur R3 attēlo ūdeņraža atomu vai alkoksigrupu;

U attēlo ūdeņraža atomu vai NHR7 grupu, kur R7 ir ūdeņraža atoms vai alkilgrupa;

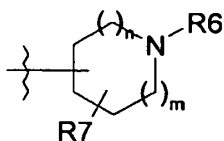
A attēlo arilgrupu, heteroarilgrupu vai heterocikloalkilgrupu, izvēlētu no fenilgrupas, benzodioksolilgrupas, tienilgrupas, tiazolilgrupas, piridīnilgrupas, pirazolilgrupas un pirolidinogrupas, minētā arilgrupa vai heteroarilgrupa ir neobligāti aizvietota jebkurā pozīcijā ar vienu vai vairākām grupām, kas izvēlētas no halogēna atoma un ciāngrupas, alkilgrupas, halogēnalkilgrupas, hidroksilgrupas, alkoksigrupas, $-O-(CH_2)_p-O$ -alkilgrupas, halogēnalkoksigrupas, $-NRR'$, $-NR-CO$ -alkilgrupas un $-SO_2$ -alkilgrupas, kur R un R' attēlo, neatkarīgi viens no otra, ūdeņraža atomu vai alkilgrupu un p ir vesels skaitlis no 1 līdz 5;

W attēlo halogēna atomu, alkilgrupu vai halogēnalkilgrupu;

Z attēlo saiti vai alkilēngrupu, neobligāti aizvietotu ar vismaz vienu grupu, kas izvēlēta no halogēna atoma un alkilgrupas, un hidroksilgrupas;

B attēlo:

vai nu $-NR_4R_5$ grupu, kur R4 un R5 attēlo, neatkarīgi viens no otra, alkilgrupu, cikloalkilgrupu, hidroksialkilgrupu, vai alternatīvi R4 un R5 ar slāpekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido 5- vai 6-locekļu gredzenu, tādu kā pirolidīnilgrupas vai piperidīnilgrupas gredzenu, vai heterociklu ar šādu formulu:



kur m un n attēlo, neatkarīgi viens no otra, 0, 1 vai 2 un kur R6 un R7 attēlo, neatkarīgi viens no otra, ūdeņraža atomu vai alkilgrupu, vai cikloalkilgrupu;

R1 un R2 attēlo:

vai nu, neatkarīgi viens no otra, ūdeņraža atomu, vai alkilgrupu, cikloalkilgrupu, fenilgrupu, benzilgrupu vai $-CH_2$ -indolilgrupu, pie kam šīs grupas ir neobligāti aizvietotas ar vienu vai vairākām hidroksilgrupām, vismaz viens no R1 vai R2 nav ūdeņraža atoms, vai R1 un R2 kopā ar oglekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido mono- vai policiklisku sistēmu, kas izvēlēta no: cikloalkilgrupas, indanilgrupas, tetrahidropirānilgrupas, piperidīna, tetrahidronaftilgrupas, biciklo[2.2.1]heptilgrupas, biciklo[3.3.1]nonilgrupas un adamantilgrupas, pie kam minētā mono- vai policikliskā sistēma ir neobligāti aizvietota jebkurā pozīcijā (ieskaitot pie slāpekļa atoma, ja piemērots) ar vienu vai vairākām grupām, kas izvēlētas no alkilgrupas, hidroksilgrupas un alkoksigrupas; p attēlo veselu skaitli, vienādu ar 0 vai 1; to sāji, to hidratī vai solvāti, kā arī to enantiomēri un diastereoizomēri, ieskaitot to racēmiskos maisījumus.

12. Savienojumi saskaņā ar 1. pretenziju, kur:

X un Y attēlo, neatkarīgi viens no otra, slāpekļa atomu vai CH grupu;

A attēlo fenilgrupu, piridīnilgrupu vai pirolidinogrupu, kas aizvietota jebkurā pozīcijā ar 1 līdz 2 grupām, kas izvēlētas no halogēna atoma un alkilgrupas, trifluormetilgrupas, metoksigrupas un N,N-dimetilamīngrupas;

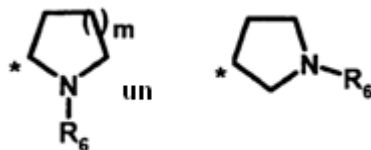
U attēlo ūdeņraža atomu vai NHR7 grupu, kur R7 ir ūdeņraža atoms;

W attēlo hlora atomu vai trifluormetilgrupu;

Z attēlo saiti vai alkilēngrupu, neobligāti aizvietotu ar metilgrupu;

B attēlo:

vai nu $-NR_4R_5$ grupu, kur R4 un R5 attēlo, neatkarīgi viens no otra, alkilgrupu, vai alternatīvi R4 un R5 ar slāpekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido 5- vai 6-locekļu gredzenu, vai heterociklu ar šādu formulu:



kur m ir 1 vai 2 un R6 attēlo etilgrupu vai metilgrupu;

R1 un R2 attēlo:

vai nu, neatkarīgi viens no otra, ūdeņraža atomu vai izopropilgrupu, *tert*-butilgrupu, vai R1 un R2 kopā ar oglekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido

mono- vai policiklisku sistēmu, kas izvēlēta no: cikloalkilgrupas, tetrahidropirānilgrupas, biciklo[2.2.1]heptilgrupas, biciklo[3.3.1]nonilgrupas un adamantilgrupas, pie kam minētā cikloalkilgrupa ir neobligāti aizvietota 3. un 4. pozīcijā ar metilgrupu, hidroksilgrupu vai metoksigrupu, vai vienu vai diviem halogēna atomiem, p attēlo 0 vai 1;

to sāji, to hidratī vai solvāti, kā arī to enantiomēri un diastereoizomēri, ieskaitot to racēmiskos maisījumus.

13. Savienojumi saskaņā ar vismaz vienu no iepriekšējām pretenzijām, kur:

X attēlo slāpekļa atomu un Y attēlo CH grupu;

A attēlo fenilgrupu vai piridīnilgrupu, aizvietotu 2., 4., 5. un 6. pozīcijā ar vienu vai divām grupām, kas izvēlētas no halogēna atoma, tāda kā hlora atoms vai fluora atoms, un alkilgrupas, tādas kā metilgrupa, etilgrupa vai izopropilgrupa, trifluormetilgrupas, metoksigrupas un N,N-dimetilamīngrupas;

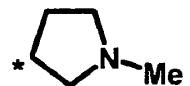
U attēlo ūdeņraža atomu vai NHR7 grupu, kur R7 ir ūdeņraža atoms;

W attēlo hlora atomu vai trifluormetilgrupu;

Z attēlo saiti vai etilēngrupu, propilēngrupu vai metilpropilēngrupu;

B attēlo:

vai nu $-NR_4R_5$ grupu, kur R4 un R5 attēlo, neatkarīgi viens no otra, metilgrupu, etilgrupu vai propilgrupu, vai kopā ar slāpekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido 5- vai 6-locekļu gredzenu, vai heterociklu ar šādu formulu:



R1 un R2 attēlo:

vai nu R1 ir ūdeņraža atoms un R2 izopropilgrupa, *tert*-butilgrupa, pie kam oglekļa atoms, kuram ir grupas R1 un R2, pieņem pilnīgu S konfigurāciju,

vai R1 un R2 kopā ar oglekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido cikloalkilgrupu un adamantilgrupu, pie kam minētā cikloalkilgrupa ir neobligāti aizvietota 3. un 4. pozīcijā ar metilgrupu, hidroksilgrupu vai metoksigrupu;

p attēlo 0 vai 1;

to sāji, to hidratī vai solvāti, kā arī to enantiomēri un diastereoizomēri, ieskaitot to racēmiskos maisījumus.

14. Savienojumi saskaņā ar vismaz vienu no iepriekšējām pretenzijām, kur:

X attēlo slāpekļa atomu un Y attēlo CH grupu;

A attēlo fenilgrupu vai piridīnilgrupu, aizvietotu 2., 4., 5. un 6. pozīcijā ar vienu vai divām grupām, kas izvēlētas no halogēna atoma, tāda kā hlora atoms vai fluora atoms, un alkilgrupām, tādām kā metilgrupa, etilgrupa vai izopropilgrupa, trifluormetilgrupas, metoksigrupas un N,N-dimetilamīngrupas;

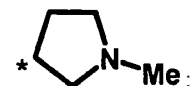
U attēlo ūdeņraža atomu vai NHR7 grupu, kur R7 ir ūdeņraža atoms;

W attēlo hlora atomu vai trifluormetilgrupu;

Z attēlo saiti vai etilēngrupu, propilēngrupu vai metilpropilēngrupu;

B attēlo:

vai nu $-NR_4R_5$ grupu, kur R4 un R5 attēlo, neatkarīgi viens no otra, metilgrupu, etilgrupu vai propilgrupu, vai kopā ar slāpekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido 5- vai 6-locekļu gredzenu, vai heterociklu ar šādu formulu:



R1 un R2 attēlo:

vai R1 un R2 kopā ar oglekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido C_{3-8} cikloalkilgrupu un adamantilgrupu, pie kam minētā cikloalkilgrupa ir neobligāti aizvietota 3. un 4. pozīcijā ar metilgrupu, hidroksilgrupu vai metoksigrupu;

p attēlo 0 vai 1;

to sāji, to hidratī vai solvāti, kā arī to enantiomēri un diastereoizomēri, ieskaitot to racēmiskos maisījumus.

15. Savienojumi saskaņā ar vismaz vienu no iepriekšējām pretenzijām, kur:

X attēlo slāpekļa atomu un Y attēlo CH grupu;

A attēlo fenilgrupu vai piridīnilgrupu, aizvietotu 2., 4., 5. un 6. pozīcijā ar vienu vai divām grupām, kas izvēlētas no halogēna atoma,

tāda kā hlora atoms vai fluora atoms, un alkilgrupām, tādām kā metilgrupa, etilgrupa vai izopropilgrupa, trifluormetilgrupas, metoksigrupas un N,N-dimetilamīngrupas;

U attēlo ūdeņraža atomu vai NHR7 grupu, kur R7 ir ūdeņraža atoms;

W attēlo hlora atomu vai trifluormetilgrupu;

Z attēlo saiti vai etilēngrupu, propilēngrupu vai metilpropilēngrupu;

B attēlo:

-NR4R5 grupu, kur R4 un R5 attēlo, neatkarīgi viens no otra, metilgrupu, etilgrupu vai propilgrupu, vai kopā ar slāpekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido 5- vai 6-locekļu gredzenu,

R1 un R2 attēlo:

vai nu R1 ir ūdeņraža atoms un R2 izopropilgrupa, *tert*-butilgrupa, pie kam oglekļa atoms, kuram ir grupas R1 un R2, pieņem pilnīgu S konfigurāciju,

vai R1 un R2 kopā ar oglekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido C₃₋₈ cikloalkilgrupu un adamantilgrupu, pie kam minētā cikloalkilgrupa ir neobligāti aizvietota 3. un 4. pozīcijā ar metilgrupu, hidroksilgrupu vai metoksigrupu;

p attēlo 0 vai 1;

to sāļi, to hidrāti vai solvāti, kā arī to enantiomēri un diastereoizomēri, ieskaitot to racēmiskos maisījumus.

16. Savienojums saskaņā ar vismaz vienu no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka tas ir hidrohlorīda formā.

17. Savienojums saskaņā ar vismaz vienu no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka tas ir izvēlēts no:

2-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-4-metoksi-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

(3S)-3-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,4-dimetilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4,4-dimetilpentānskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,6-difluorfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(5-etoksi-2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,6-dihlorfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2-fluor-6-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-[2-metil-5-(1-metiletil)fenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-[2-hlor-5-(2-metoksietoksi)fenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,4-dimetilfenil)pirazin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

(3S)-3-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2-hlor-5-etoksifenil)pirazin-2-il]karbonil]amino)-4,4-dimetilpentānskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-[2-(metoksietil)fenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-[2-hlor-5-(1-metiletoksi)fenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2-hlor-5-etoksifenil)pirazin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((5-[2-hlor-5-(dimetilamino)fenil]-6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2-etil-6-fluorfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2-metil-5-propilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-[2-(difluorometil)-4-metilfenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((3-hlor-2'-(4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-6-etoksi-2,3'-bipiridin-6'-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((3-amino-6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2-hlor-5-etoksifenil)pirazin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)-2-fluorpropoksi]fenil]-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

2-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2-hlorfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-[2-(difluorometil)-5-metilfenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-[5-(2-metoksietoksi)-2-metilfenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-[5-(metoksietil)-2-metilfenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-[2-metil-5-(1-metiletoksi)fenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-[2-metil-5-(2-metilpropoksi)fenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-[5-(ciklopropilmetoksi)-2-metilfenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2-metil-5-propoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

2-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-2,3-dihidro-1H-indēn-2-karbonskābes,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)ciklopentānkarbonskābes,

2-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)biciklo[2.2.1]heptān-2-karbonskābes hidrohlorīda,

N-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]fenilalanīna,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

3-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-metilpentānskābes,

3-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-fenilbutānskābes,

3-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-(1H-indol-3-il)butānskābes,

((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)(fenil)etiķskābes,

3-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-3-cikloheksilpropānskābes,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes,

N-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]-alfa-metilfenilalanīna,

N-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]-3-metilizovalīna,

2-(((6-{4-hlor-3-[(1-metilpirolidin-3-il)oksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,

2-(((6-{4-hlor-3-[(1-metilpiperidin-4-il)oksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,

2-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2-metoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,

2-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,

2-(((6-{4-hlor-3-[2-(dimetilamino)etoksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,

2-(((6-{4-hlor-3-[(1-etilpirolidin-3-il)oksi]fenil]-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,

2-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-fenilpiridin-2-il)karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-okspiroolidin-1-il)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda
 9-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)biciklo[3.3.1]nonān-9-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-[3-(diethylamino)propoksi]fenil}-5-(2,6-dimetoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((2-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-3,4'-bipiridin-6-il)karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((2-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-2,3'-bipiridin-6-il)karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 3-(((4'-hlor-3'-[3-(dimetilamino)propoksi]-2,6-dimetoksi-1,1':2',1"-terfenil-4'-il)karbonil]amino)-4-metilpentānskābes,
 3-(((5-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-6-(2-metilfenil)piridin-3-il]karbonil]amino)-4-metilpentānskābes hidrohlorīda,
 N-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]-3-hidroksifenilalanīna hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-[2-(1-metilpirolidin-2-il)etoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-[2-(1-metilpiperidin-2-il)etoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{3-[3-(dimetilamino)propoksi]-4-(trifluormetil)fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-etilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-[2-(difluormetil)fenil]piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-[3-[ciklopropil(metil)amino]propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-[2-(dimetilamino)fenil]piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((3,5-dihlor-2'-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-2,3'-bipiridin-6-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2,4-dimetilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 4-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)tetrahidro-2H-piran-4-karbonskābes hidrohlorīda,
 (3R)-3-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-metilpentānskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-[3-piperidin-1-il]propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)butoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-[2-piperidin-1-iletoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 (3S)-3-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-metilpentānskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-[2-pirolidin-1-iletoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-[3-pirolidin-1-il]propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((2'-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-3-metil-2,3'-bipiridin-6-il)karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-metilcikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)-1-metilpropoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlor-4-fluorfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlor-4-metoksifenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 (3S)-3-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlorfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-metilpentānskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlorfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-(((2R)-3-(dimetilamino)-2-hidroksipropil]oksi]fenil)-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-(((2S)-3-(dimetilamino)-2-hidroksipropil]oksi]fenil)-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 4-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)piperidīn-4-karbonskābes hidrohlorīda,
 2-(((6-{4-hlor-3-[2-(diethylamino)etoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-[2-(difluormetil)fenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 [1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksil]etiķskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlorfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((3-hlor-2'-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-2,3'-bipiridin-6-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-amino-2'-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-2,3'-bipiridin-6-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-3-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-3-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 cis-1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlorfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-metoksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 trans-1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlorfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-metoksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 trans-1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-[2-(metilsulfonil)fenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-[2-(metilsulfonil)fenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((2'-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-3-metil-2,3'-bipiridin-6-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((5-[2-(acetilamino)fenil]-6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]piridin-2-il]karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 N-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlorfenil)piridin-2-il]karbonil]-D-valīna hidrohlorīda,
 1-(((2'-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-2'-metil-3,3'-bipiridin-6-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((2-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-4'-metil-3,3'-bipiridin-6-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[2-pirolidin-1-iletoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-etil(metil)amino]propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(diethylamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[4-(dimetilamino)butoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-[2-(1-metiletil)fenil]piridin-2-il]karbonil]amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-etilfenil)piridin-2-il]karbonil]amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(5-hlor-2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2,4-dimetilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2,5-dimetilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(etil(metil)amino)propoksi]fenil}-5-(2,4-dimetilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(4-fluor-2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(metil(propil)amino)propoksi]fenil}-5-(2-etilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(diethylamino)propoksi]fenil}-5-(2,4-dimetilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(etil(metil)amino)propoksi]fenil}-5-(2-etilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-etilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)-2-metilpropoksi]fenil}-5-(2-etilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-3-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-propilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((3-hlor-2'-(4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-fluor-2,3'-bipiridin-6'-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlor-5-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-4-hidroksicikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((3-hlor-2'-(4-hlor-3-[3-(etil(metil)amino)propoksi]fenil)-2,3'-bipiridin-6'-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2,5-dimetilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheptānkarbonskābes hidrohlorīda,
 (3S)-3-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlor-5-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-4-metilpentānskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlor-5-fluorfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(3,5-dimetil-1H-pirazol-1-il)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlor-5-metoksi)fenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{3-[3-(dimetilamino)propoksi]-4-etilfenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 3-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlor-5-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-3-ciklobutilpropānskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metiltofen-3-il)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 3-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlor-5-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-3-ciklopropilpropānskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)pirazin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlor-4-hidroksifenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlor-4,5-dimetilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(5-metil-1,3-tiazol-4-il)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

4-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)oksepān-4-karbonskābes hidrohlorīda,
 3-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlorfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-4,4-dimetilpentānskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-ciānfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(4-hidroksi-2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(3-fluor-2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(5-hidroksi-2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlor-6-fluorfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(2-hidroksietil)(metil)amino]propoksi]fenil}-5-(2,4-dimetilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(3-hidroksi-2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(4,5-difluor-2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(6-metil-1,3-benzodioksol-5-il)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(3,5-dietil-1H-pirazol-1-il)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlor-5-etoksi)fenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((5-hlor-2'-(4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil)-3-(difluorometil)-2,3'-bipiridin-6'-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-[2-metilfenil]piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-[2-metilfenil]-3-[metilamino]piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(5-etil-3-metil-1H-pirazol-1-il)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((5-[2-hlor-4-(dimetilamino)fenil]-6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil]piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 (3S)-3-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlorfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-4,4-dimetilpentānskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-[2-hlor-5-(trifluorometoksi)fenil]piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((3-amino-6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)pirazin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2,4-dihlorfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-S-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)-4,4-difluorcikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-3-(metilamino)-5-(2-metilfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlor-4-fluorfenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlor-4-metoksi)fenil)piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,
 1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-[2-(difluorometil)fenil]piridin-2-il]karbonil}amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda.

18. Savienojums saskaņā ar vismaz vienu no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka tas ir izvēlēts no:

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-[2-metil-5-(1-metiletil)fenil]piridin-2-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

2-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il)karbonil]amino)adamantān-2-karbonskābes hidrohlorīda,

1-(((3,5-dihlor-2'-(4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil)-2,3'-bipiridin-6'-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2,4-dimetilfenil)piridin-2-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

(3S)-3-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il)karbonil]amino)-4-metilpentānskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-hlor-4-metoksifenil)piridin-2-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((2'-(4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil)-3-metil-2,3'-bipiridin-6'-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((2-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-2'-metil-3,3'-bipiridin-6-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-etilfenil)piridin-2-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2,5-dimetilfenil)piridin-2-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

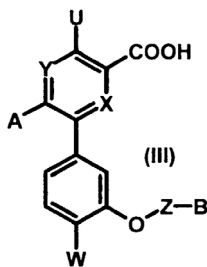
1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)piridin-2-il)karbonil]amino)cikloheptānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(3,5-dimetil-1H-pirazol-1-il)piridin-2-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

1-(((6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-[2-metilfenil]piridin-2-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda,

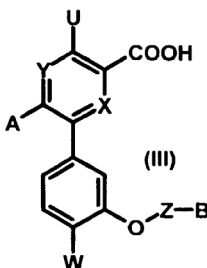
1-(((3-amino-6-{4-hlor-3-[3-(dimetilamino)propoksi]fenil}-5-(2-metilfenil)pirazin-2-il)karbonil]amino)cikloheksānkarbonskābes hidrohlorīda.

19. Savienojums ar formulu (III):

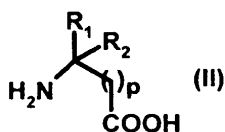


kur U, X, Y, Z, W, A un B ir, kā definēts 1. pretenzijā.

20. Paņēmiens savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 18. pretenzijai iegūšanai, kas raksturīgs ar to, ka savienojums ar formulu (III)



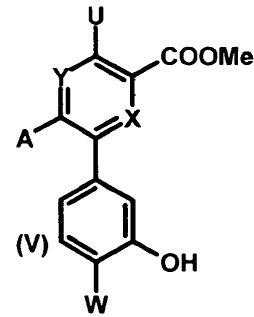
kur U, X, Y, Z, W, A un B ir, kā definēts 1. pretenzijā, reaģē ar savienojumu ar formulu (II)



kur p, R₁ un R₂ ir, kā definēts 1. pretenzijā, saites veidošanas līdzekļa, vājas organiskas bāzes un polāra aprotona šķīdinātāja klātbūtnē istabas temperatūrā.

21. Paņēmiens savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 18. pretenzijai iegūšanai, kas ietver šādas stadijas:

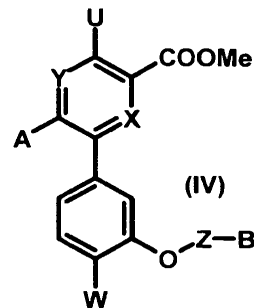
a) savienojuma ar formulu (V)



kur U, X, Y, W un A ir, kā definēts 1. pretenzijā, reakcija

- vai nu ar hlora atoma atvasinājumu Cl-Z-B, vājas neorganiskas bāzes polārā aprotanā šķīdinātājā klātbūtnē, temperatūrā no 80°C līdz 100°C,

- vai ar spirtu ar formulu HO-Z-B, trifetilfosfīna, diizopropilazodikarboksilāta (DIAD) un katalītiska vājas organiskas bāzes daudzuma klātbūtnē, 0°C aprotanā šķīdinātājā, kur Z un B ir, kā definēts 1. pretenzijā, lai iegūtu savienojumu ar formulu (IV)



kur U, X, Y, W, A, Z un B ir, kā definēts 1. pretenzijā,

b) minētā savienojuma ar formulu (IV) pārziņošana ar stipras neorganiskas bāzes ūdenī/metanolā maisījumu, uzturot istabas temperatūrā vai karsējot pie atceses, pēc tam paskābināšana, lai iegūtu savienojumu ar formulu (III), kā definēts 20. pretenzijā;

c) minētā savienojuma (III) reakcija ar savienojumu ar formulu (II), kā definēts 20. pretenzijā.

22. Ārstniecisks produkts, kas raksturīgs ar to, ka tas ietver savienojumu ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 18. pretenzijai vai šī savienojuma farmaceutiski pieņemamas skābes pievienošanās sāli, vai hidrātu, vai solvātu.

23. Farmaceutiska kompozīcija, kas raksturīga ar to, ka tā ietver savienojumu ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 18. pretenzijai vai šī savienojuma farmaceutiski pieņemamas skābes pievienošanās sāli, vai hidrātu, vai solvātu, kā arī vismaz vienu farmaceutiski pieņemamu palīgvielu.

24. Savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 18. pretenzijai izmantošana ārstnieciska produkta iegūšanai, kas paredzēts sastrēguma sirds mazspējas, išēmiskas sirds slimības, miokarda infarkta, sirds hipertrofijas un fibrozes, koronāro slimību un aterosklerozes, sistēmiskas un plaušu arteriālas hipertensijas, pēc angioplastijas restenozes, akūta un hroniska diabēta un/vai hipertensijas izcelsmes nieru bojājuma, diabēta, iekaisuma, fibrožu un aneirismu, centrālās nervu sistēmas traucējumu, ieskaitot neurodeģeneratīvās slimības, cerebrovaskulārus saslimšanas gadījumus, stresu, nemieru, agresivitāti, depresiju, šizofrēniju vai miega traucējumus, un vēžu vai elpošanas ceļu slimību, astmas ārstēšanai un/vai profilaksei.

25. Savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 18. pretenzijai izmantošana ārstnieciska produkta iegūšanai, kas paredzēts akūta un hroniska diabēta izcelsmes nieru bojājuma ārstēšanai un/vai profilaksei.

26. Savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 18. pretenzijai izmantošana ārstnieciska produkta iegūšanai, kas paredzēts diabēta ārstēšanai un/vai profilaksei.

27. Savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 18. pretenzijai izmantošana ārstnieciska produkta iegūšanai, kas paredzēts vemšanas ārstēšanai un/vai profilaksei.

28. Urotenzīna II antagonista izmantošana ārstnieciska produkta iegūšanai, kas paredzēts vemšanas ārstēšanai un/vai profilaksei.

- (51) **A61K 39/395⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2059534**
C07K 16/24⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07K 14/52⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 37/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07K 14/54⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 08714211.3 (22) 21.02.2008
(43) 20.05.2009
(45) 25.04.2012
(31) 891409 P (32) 23.02.2007 (33) US
(86) PCT/US2008/002333 21.02.2008
(87) WO2008/103432 28.08.2008
(73) Schering Corporation, 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, NJ 07033, US
(72) PRESTA, Leonard, G., US
BEYER, Brian, M., US
INGRAM, Richard, N., US
ORTH, Peter, US
LIU, Yan-Hui, US
(74) Böhles, Elena, et al, Merck & Co., Inc., Hertford Road, Hoddesdon, Hertfordshire EN11 9BU, GB
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
- (54) **MODELĒTAS ANTI-IL-23P19 ANTIVIELAS ENGINEERED ANTI-IL-23P19 ANTIBODIES**

(57) 1. Antiviela vai tās antigēnu saistošs fragments, kas saistās ar cilvēka IL-23, kas satur:
a) vieglās ķēdes variablo domēnu vai tā antigēnu saistošo fragmentu, kas satur CDRL1, CDRL2 un CDRL3, kur:
CDRL1 satur sekvenci SEQ ID Nr. 36;
CDRL2 satur sekvenci SEQ ID Nr. 41; un
CDRL3 satur sekvenci SEQ ID Nr. 46; un
b) smagās ķēdes variablo domēnu vai tā antigēnu saistošo fragmentu, kas satur CDRH1, CDRH2 un CDRH3, kur:
CDRH1 satur sekvenci SEQ ID Nr. 19;
CDRH2 satur sekvenci SEQ ID Nr. 25; un
CDRH3 satur sekvenci SEQ ID Nr. 31.

2. Antiviela vai tās antigēnu saistošais fragments saskaņā ar 1. pretenziju, kur vieglās ķēdes variablais domēns satur SEQ ID Nr. 14 1. līdz 108. atlikumu.

3. Antiviela vai tās antigēnu saistošais fragments saskaņā ar 1. pretenziju, kur smagās ķēdes variablais domēns satur SEQ ID Nr. 7 1. līdz 116. atlikumu.

4. Antiviela vai tās antigēnu saistošais fragments saskaņā ar 1. pretenziju, kas satur: antivielas vieglās ķēdes variablo domēnu saskaņā ar 2. pretenziju; un antivielas smagās ķēdes variablo domēnu saskaņā ar 3. pretenziju.

5. Antiviela vai tās antigēnu saistošais fragments saskaņā ar 4. pretenziju, kas satur vieglo ķēdi un smago ķēdi, kur: vieglā ķēde satur sekvenci SEQ ID Nr. 14; un smagā ķēde satur sekvenci SEQ ID Nr. 7.

6. Izolēta nukleīnskābe, kas kodē antivielas vai tās antigēnu saistošā fragmenta saskaņā ar 1. pretenziju vieglās ķēdes variablo domēnu un smagās ķēdes variablo domēnu.

7. Ekspresijas vektors, kas satur nukleīnskābi saskaņā ar 6. pretenziju, kas ir funkcionāli saistīta, lai kontrolētu sekvences, kuras atpazīst saimniekšūna, kad saimniekšūna ir transficēta ar vektoru.

8. Saimniekšūna, kas satur ekspresijas vektoru saskaņā ar 7. pretenziju.

9. Paņēmiens antivielas vai tās antigēnu saistošā fragmenta producēšanai, kas satur: saimniekšūnas saskaņā ar 8. pretenziju audzēšanu kultūras vidē apstākļos, kuros tiek ekspresēta nukleīnskābes sekvence, tādējādi producējot polipeptīdus, kas satur antivielas vai tās antigēnu saistošā fragmenta vieglās un smagās ķēdes variablos domēnus; un antivielas vai tās antigēnu saistošā fragmenta reģenerāciju no saimniekšūnas vai kultūras vides.

10. Antiviela vai tās antigēnu saistošais fragments saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur smagās ķēdes konstanto zonu, kura satur γ1 cilvēka smagās ķēdes konstanto zonu vai tās variantu, kur konstantās zonas variants satur līdz 20 konservatīvi modificētas aizvietotas aminoskābes.

11. Antiviela vai tās antigēnu saistošais fragments saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur smagās ķēdes konstanto zonu, kura satur γ4 cilvēka smagās ķēdes konstanto zonu vai tās variantu, kur konstantās zonas variants satur līdz 20 konservatīvi modificētas aizvietotas aminoskābes.

12. Antiviela vai tās antigēnu saistošais fragments saskaņā ar 1. pretenziju, kur antiviela vai tās antigēnu saistošais fragments ir antivielas fragments, izvēloties no rindas, kas sastāv no: Fab, Fab', Fab'-SH, Fv, scFv, F(ab')₂ un diavielas.

13. Antiviela vai tās antigēnu saistošais fragments saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai par medikamentu.

14. Antiviela vai tās antigēnu saistošais fragments saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai, ārstējot traucējumu, kas izvēlēts no rindas, kas sastāv no artrīta, psoriāzes un iekaisīgu zarnu slimības.

15. Antiviela vai tās antigēnu saistošais fragments saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai, ārstējot traucējumu, kas izvēlēts no rindas, kas sastāv no multiplās sklerozes, sistēmiskās sarkanās vilkēdes un diabēta.

16. Antiviela vai tās antigēnu saistošais fragments saskaņā ar 1. pretenziju izmantošanai, ārstējot vēzi.

17. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur antivielu vai tās antigēnu saistošo fragmentu saskaņā ar 1. pretenziju, kombinācijā ar farmaceutiski pieņemamu nesēju vai atšķaidītāju.

18. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 17. pretenziju, kas papildus satur imūnsupresantu vai pretiekaisuma līdzekli.

19. Saimniekšūna, kas satur:

a) ekspresijas vektoru, kas satur nukleīnskābes sekvenci, kura kodē antivielas vai tās antigēnu saistošā fragmenta saskaņā ar 1. pretenziju vieglās ķēdes variablo domēnu; un

b) ekspresijas vektoru, kas satur nukleīnskābes sekvenci, kura kodē antivielas vai tās antigēnu saistošā fragmenta saskaņā ar 1. pretenziju smagās ķēdes variablo domēnu.

20. Paņēmiens antivielas vai tās antigēnu saistošā fragmenta producēšanai, kas satur:

saimniekšūnas saskaņā ar 19. pretenziju audzēšanu kultūras vidē apstākļos, kuros tiek ekspresētas nukleīnskābes sekvences, tādējādi producējot polipeptīdus, kas satur antivielas vai tās antigēnu saistošā fragmenta vieglās un smagās ķēdes variablos domēnus; un

antivielas vai tās antigēnu saistošā fragmenta reģenerāciju no saimniekšūnas vai kultūras vides.

- (51) **A61K 39/395⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2066349**
C07K 16/18⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07K 16/28⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C12N 15/13⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C12N 5/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 07842083.3 (22) 07.09.2007
(43) 10.06.2009
(45) 28.03.2012
(31) 842935 P (32) 08.09.2006 (33) US
866917 P 22.11.2006 US
911397 P 12.04.2007 US
915309 P 01.05.2007 US
939429 P 22.05.2007 US
(86) PCT/US2007/077916 07.09.2007
(87) WO2008/031056 13.03.2008
(73) MedImmune, LLC, One MedImmune Way, Gaithersburg, MD 20878, US
(72) DAMSCHRODER, Melissa, US
KIENER, Peter, US
WU, Herren, US
DALL'ACQUA, William, US
HERBST, Ronald, US
COYLE, Anthony, US
(74) Walton, Seán Malcolm, Mewburn Ellis LLP, 33 Gutter Lane, London EC2V 8AS, GB

Svetlana MAKEJEVA, SIA Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, a/k 274, Rīga LV-1084, LV

(54) **HUMANIZĒTAS ANTI-CD19 ANTIVIELAS UN TO IZMANĒŠANA AUDZĒJU ĀRSTĒŠANĀ, TRANSPLANTĀCIJĀ UN AUTOIMŪNU SLIMĪBU ĀRSTĒŠANĀ**
HUMANIZED ANTI-CD19 ANTIBODIES AND THEIR USE IN TREATMENT OF TUMORS, TRANSPLANTATION AND AUTOIMMUNE DISEASES

(57) 1. Izolēta attīrīta humanizēta monoklonālā antivielā vai tās fragments, kas satur VH saturošu aminoskābju sekvenci SEQ ID Nr. 106, un VL domēnu, saturošu aminoskābju sekvenci SEQ ID Nr. 111, kur minētā antivielā saista cilvēka CD19 antigēnu.

2. Antivielā saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētajai antivielai ir kompleksas ar N-glikozīdu saistītas cukura ķēdes, savienotas ar Fc apgabalu, kurā fukoze nav savienota ar N-acetilglikozamīnu cukura ķēdes reducējošajā galā.

3. Antivielā saskaņā ar 2. pretenziju, kur minētā antivielā efektīvi sekmē ADCC aktivitāti pret Karpas-422, Karpas-1106P un DB šūnu līnijām, bet ne pret Granta-519 šūnu līniju.

4. Antivielā saskaņā ar 2. pretenziju, kur minētā antivielā ir spējīga noārdīt B šūnas dzīvnieku modelī, kur minētās B šūnas ir atlasītas no grupas, kas sastāv no: cirkulējošām B šūnām, asins B šūnām, liesas B šūnām, marginālās zonas B šūnām, folikulārām B šūnām, peritoneālām B šūnām un/vai kaulu smadzeņu B šūnām, kur minētā noārdīšana samazina B šūnu līmeņus vismaz par 50 % septiņu dienu laikā pēc 2,5 mg/kg minētās antivielas devas ievadīšanas.

5. Antivielā saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētā antivielā ir Fc variants, kur minētajam Fc variantam ir mainīta afinitāte pret vienu vai vairākiem Fc ligandiem, atlasītiem no grupas, kas sastāv no C1q, FcγRI, FcγRIIA, FcγRIIB, FcγRIIIA un FcγRIV.

6. Antivielā saskaņā ar 5. pretenziju, kur minētajam Fc variantam ir afinitāte pret Fc receptoru FcγRIIIA, kas ir vismaz 5 reizes zemāka nekā salīdzinājuma molekulai, un kur minētajam Fc variantam ir afinitāte pret Fc receptoru FcγRIIB, kas ir apmēram 2 reizes lielāka nekā salīdzinājuma molekulai.

7. Antivielā saskaņā ar 6. pretenziju, kur minētais Fc variants satur mutācijas, kas rezultātā dod pastiprinātu ADCC aktivitāti.

8. Izolēta nukleīnskābe, kas kodē polipeptīdu, kurš satur aminoskābju sekvenci SEQ ID Nr. 106 vai SEQ ID Nr. 111.

9. Izolēta šūna, kas izdala antivielu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai.

10. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur antivielu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai farmaceutiski pieņemamā veidā.

11. Terapeitiski iedarbīgs daudzums antivielas saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai izmantošanai B šūnu slimības vai traucējuma ārstēšanai cilvēkiem, kur minētā slimība vai traucējums ir atlasīts no grupas, kas satur: B šūnu ļaundabīgu audzēju, autoimūnu slimību, autoimūnu traucējumu, humorālu atgrūšanas reakciju pacientam ar cilvēka transplantātu, slimību „transplantāts pret saimnieku” (GVHD) un pēctransplantācijas limfoproliferatīvu traucējumu recipientam ar cilvēka transplantātu.

12. Terapeitiski iedarbīgais daudzums antivielas saskaņā ar 11. pretenziju, kur minētā ārstēšana satur B šūnu noārdīšanu, kur B šūnas atlasītas no grupas, kas satur cirkulējošās B šūnas, asins B šūnas, liesas B šūnas, marginālās zonas B šūnas, folikulārās B šūnas, peritoneālās B šūnas, kaulu smadzeņu B šūnas, priekšteču B šūnas, agrās pro-B šūnas, vēlās pro-B šūnas, lielās pre-B šūnas, mazās pre-B šūnas, nenobriedušās B šūnas, nobriedušās B šūnas, antigēna stimulētās B šūnas un/vai plazmas šūnas.

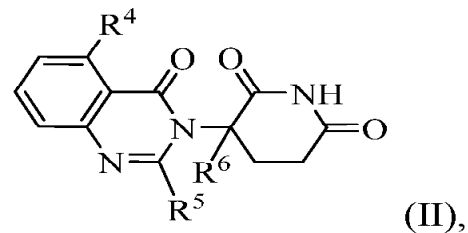
13. Terapeitiski iedarbīgais daudzums antivielas saskaņā ar 12. pretenziju, kur minētā noārdīšana samazina B šūnu līmeņus vismaz līdz aptuveni 20 % un kur minētā noārdīšana pastāv vismaz 1 nedēļu ilgu laiku periodu.

(21) 07838876.6 (22) 25.09.2007
 (43) 10.06.2009
 (45) 25.04.2012
 (31) 847471 P (32) 26.09.2006 (33) US
 (86) PCT/US2007/020765 25.09.2007
 (87) WO2008/039489 03.04.2008
 (73) CELGENE CORPORATION, 86 Morris Avenue, Summit, NJ 07901, US

(72) MULLER, George W., US
 MAN, Hon-Wah, US
 (74) Ritter, Thomas Kurt, Jones Day, Prinzregentenstraße 11, 80538 München, DE
 Svetlana MAKEJEVA, SIA Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, a/k 274, Rīga LV-1084, LV

(54) **5-AIZVIETOTI HINAZOLINONA ATVASINĀJUMI KĀ PRETAUDZĒJU LĪDZEKĻI**
5-SUBSTITUTED QUINAZOLINONE DERIVATIVES AS ANTITUMOR AGENTS

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



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, solvāts vai stereozomērs, kur:

R⁴ ir: halogēns; -(CH₂)_nOH; (C₁-C₆)alkilgrupa, pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem; vai

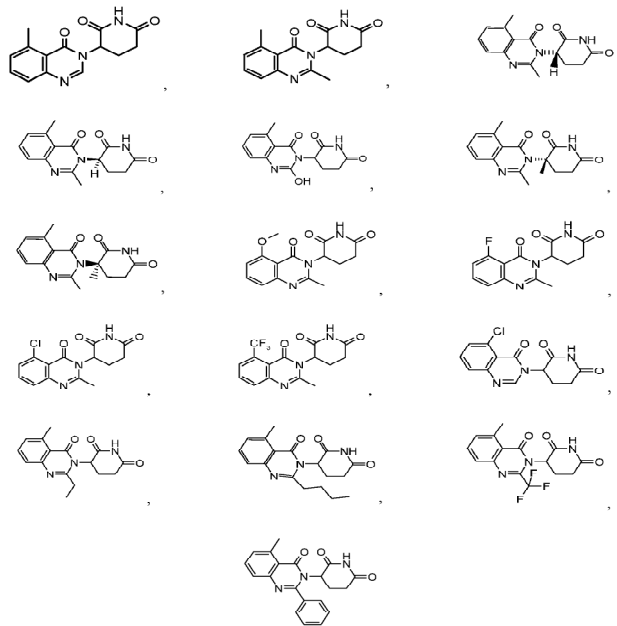
(C₁-C₆)alkoksigrupa, pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem;

R⁵ ir: ūdeņradis; -(CH₂)_nOH; fenilgrupa; -O-(C₁-C₆)alkilgrupa vai (C₁-C₆)alkilgrupa, pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem;

R⁶ ir: ūdeņradis vai (C₁-C₆)alkilgrupa, pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem; un n ir 0, 1 vai 2.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, solvāts vai stereozomērs, kur R⁴ ir metilgrupa vai metoksigrupa; vai kur R⁴ ir F vai Cl; vai kur R⁴ ir -CF₃.

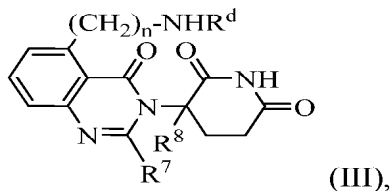
3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir:



(51) **C07D 401/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2066656**
C07D 401/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/45⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/517⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, solvāts vai stereozomērs.

4. Savienojums ar formulu (III):



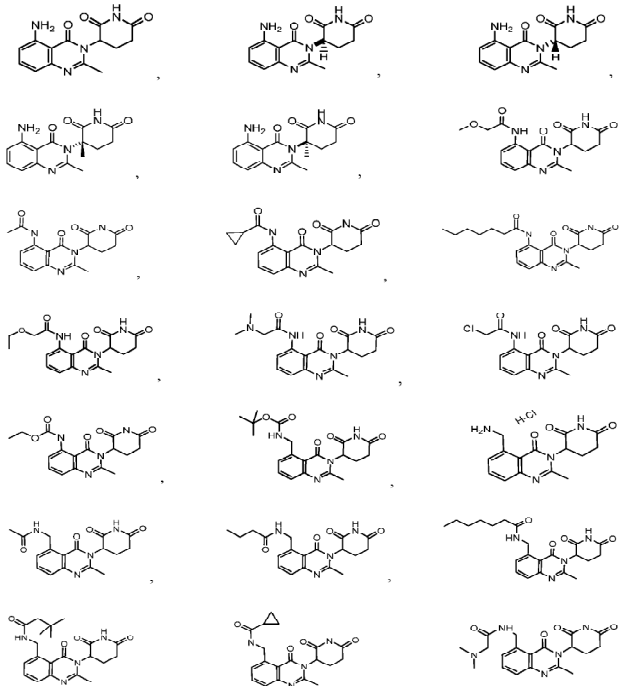
vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, solvāts vai stereozomērs, kur:

- R^d ir:
 ūdeņradis;
 (C₁-C₆)alkilgrupa, pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem;
 -C(O)-(C₁-C₆)alkilgrupa, kur alkilgrupa ir pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem;
 -C(O)-(CH₂)_n-((C₃-C₁₀)cikloalkilgrupa);
 -C(O)-(CH₂)_n-NR^eR^f, kur R^e un R^f neatkarīgi viens no otra ir:
 ūdeņradis;
 (C₁-C₆)alkilgrupa, pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem; vai
 (C₁-C₆)alkoksigrupa, pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem; vai -C(O)-(CH₂)_n-O-(C₁-C₆)alkilgrupa;
 R⁷ ir: ūdeņradis; -(CH₂)_nOH; fenilgrupa; -O-(C₁-C₆)alkilgrupa; vai (C₁-C₆)alkilgrupa, pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem;
 R⁸ ir: ūdeņradis vai (C₁-C₆)alkilgrupa, pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem; un n ir 0, 1 vai 2.

5. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, solvāts vai stereozomērs, kur R⁷ ir metilgrupa.

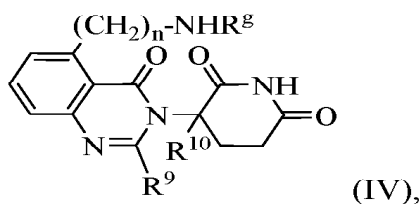
6. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, solvāts vai stereozomērs, kur R^d ir -C(O)-(C₁-C₆)alkilgrupa; vai kur R^d ir -C(O)-CH₂-O-(C₁-C₆)alkilgrupa.

7. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kas ir:



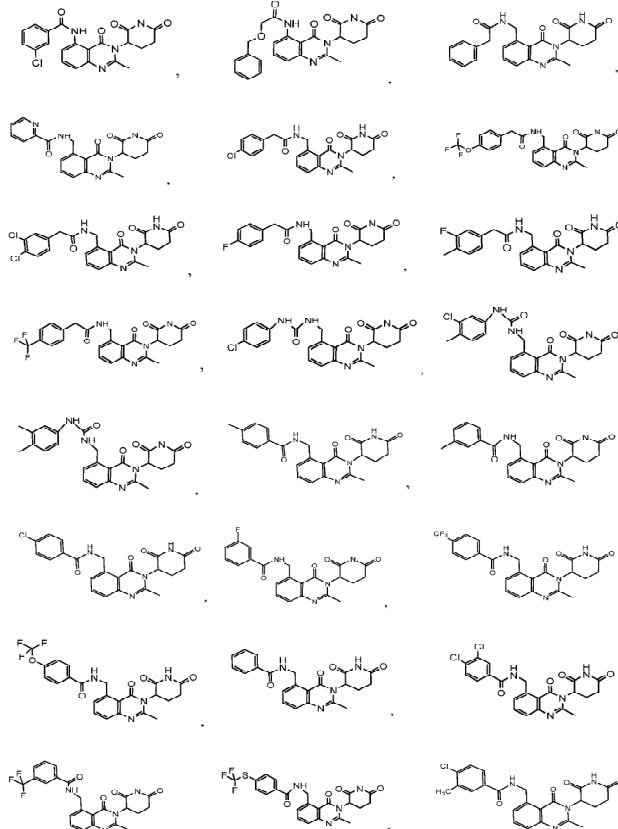
vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, solvāts vai stereozomērs.

8. Savienojums ar formulu (IV):



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, solvāts vai stereozomērs, kur:

- R^g ir:
 -(CH₂)_n- (6 līdz 10 locekļu arilgrupa);
 -C(O)-(CH₂)_n- (6 līdz 10 locekļu arilgrupa) vai -C(O)-(CH₂)_n- (6 līdz 10 locekļu heteroarilgrupa), kur arilgrupa vai heteroarilgrupa pēc izvēles ir aizvietota ar vienu vai vairākiem no šīs grupas: halogēnu atomiem; -SCF₃; (C₁-C₆)alkilgrupu, kas pati pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem; vai (C₁-C₆)alkoksigrupu, kas pati pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem;
 -C(O)-(CH₂)_n-NHR^h, kur R^h ir:
 6 līdz 10 locekļu arilgrupa, pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem no šīs grupas: halogēnu atomiem; (C₁-C₆)alkilgrupu, kas pati pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem; vai (C₁-C₆)alkoksigrupu, kas pati pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem; vai
 -C(O)-(CH₂)_n-O-(CH₂)_n- (6 līdz 10 locekļu arilgrupu);
 R⁹ ir: ūdeņradis; -(CH₂)_nOH; fenilgrupa; -O-(C₁-C₆)alkilgrupa vai (C₁-C₆)alkilgrupa, pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem;
 R¹⁰ ir: ūdeņradis vai (C₁-C₆)alkilgrupa, pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēnu atomiem; un n ir 0, 1 vai 2.
9. Savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, kur R⁹ ir metilgrupa.
10. Savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, kur R⁹ ir -C(O)-fenilgrupa, -C(O)-CH₂-fenilgrupa vai -C(O)-NH-fenilgrupa; kur pēc izvēles fenilgrupa ir aizvietota ar vienu vai vairākām metilgrupām, -CF₃-grupām vai halogēnu atomiem.
11. Savienojums saskaņā ar 8. pretenziju, kas ir:



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, solvāts vai stereozomērs.

12. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru pretenziju no 1. līdz 11. vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli, solvātu vai stereozomēru.

13. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, solvāts vai stereozomērs izmantošanai slimības vai traucējuma ārstēšanā, cīņā pret to vai profilaksē, kur slimība vai traucējums ir vēzis, ar angiogēnēzi asociēta slimība, sāpes, makulas deģenerācija vai ar to saistīts sindroms,

ādas slimība, plaušu funkcijas traucējums, ar azbestu saistīts traucējums, parazitiska slimība, imūndeficīta traucējums, CNS traucējums, CNS bojājums, ateroskleroze vai ar to saistīts traucējums, traucēts miegs vai ar to saistīts traucējums, hemoglobīnopātija vai ar to saistīts traucējums, vai ar TNF α saistīts traucējums.

14. Savienojums saskaņā ar 13. pretenziju, kas sagatavots ievadīšanai papildus otrai aktīvai vielai.

- (51) **A61K 9/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2068822**
A61K 47/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 47/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 47/26⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 07842914.9 (22) 20.09.2007
(43) 17.06.2009
(45) 02.11.2011
(31) 826529 P (32) 21.09.2006 (33) US
827411 P 28.09.2006 US
(86) PCT/US2007/079082 20.09.2007
(87) WO2008/036847 27.03.2008
(73) Alcon Research, Ltd., 6201 South Freeway, Mail Code TB4-9, Fort Worth, TX 76134-2099, US
(72) KABRA, Bhagwati P., US
CHOWHAN, Masood A., US
SCHNEIDER, L. Wayne, US
HAN, Wesley Wehsin, US
(74) Teipel, Stephan, et al, Lederer & Keller Patentanwälte, Unsöldstrasse 2, 80538 München, DE
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
(54) **PAŠKONSERVĒJOŠAS ŪDENI SATUROŠAS FARMA-CEITISKAS KOMPOZĪCIJAS**
SELF PRESERVED AQUEOUS PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS

(57) 1. Paškonservējoša multidevu acu kompozīcija, kas satur cinka jonus koncentrācijā no 0,04 līdz 0,4 mM, kur kompozīcijā esošo anjonu daļiņu koncentrācija ir mazāka nekā 15 mM.

2. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju atšķiras ar to, ka kompozīcija papildus satur borāta, kam piemīt antimikrobiāla iedarbība, efektīvu daudzumu.

3. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju atšķiras ar to, ka kompozīcija papildus satur borāta/poliola kompleksu.

4. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju atšķiras ar to, ka poliols, kuru izmanto borāta/poliola kompleksā, ir propilēnglikols.

5. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju atšķiras ar to, ka poliols, kuru izmanto borāta/poliola kompleksā, ir propilēnglikols un sorbīts.

6. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju atšķiras ar to, ka buferšķīdumu veidojošu anjonu koncentrācija kompozīcijā ir mazāka nekā 5 mM.

7. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju atšķiras ar to, ka daudzvērtīgu metālu katjonu, izņemot cinku, koncentrācija kompozīcijā ir mazāka nekā 5 mM.

8. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju atšķiras ar to, ka jonizētu sāļu koncentrācija kompozīcijā ir mazāka nekā 50 mM.

9. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju atšķiras ar to, ka:
(i) cinka jonu koncentrācija kompozīcijā ir no 0,1 līdz 0,4 mM;
(ii) daudzvērtīgu buferšķīdumu veidojošu anjonu koncentrācija kompozīcijā ir mazāka nekā 5 mM;
(iii) daudzvērtīgu metālu katjonu koncentrācija kompozīcijā ir mazāka nekā 5 mM; un
(iv) jonizētu sāļu koncentrācija kompozīcijā ir mazāka nekā 50 mM.

10. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur travoprostu kā terapeitiski aktīvo līdzekli.

11. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus satur vienu vai vairākus borātus daudzumā no 0,1 līdz 2,0 % (masa/tilp.).

12. Kompozīcija saskaņā ar 2. pretenziju, kas papildus satur vienu vai vairākus poliols kopējā koncentrācijā no 0,25 līdz 2,5 % (masa/tilp.).

13. Ūdeni saturošas acu kompozīcijas antimikrobiālās aktivitātes pastiprināšanas metode, iekļaujot cinka jonus minētajā kompozīcijā, ar uzlabojumu, kurā ietilpst cinka jonu izmantošana kompozīcijā ar koncentrāciju no 0,04 līdz 0,4 mM, un buferšķīdumu

veidojošu anjonu koncentrācijas kompozīcijā ierobežošana, kas ir mazāka nekā 15 mM.

14. Metode saskaņā ar 13. pretenziju atšķiras ar to, ka uzlabojums papildus ietver borāta/poliola kompleksa iekļaušanu minētajā kompozīcijā.

15. Metode saskaņā ar 14. pretenziju atšķiras ar to, ka poliols, kuru izmanto borāta/poliola kompleksā, ir propilēnglikols.

16. Metode saskaņā ar 13. pretenziju atšķiras ar to, ka buferšķīdumu veidojošu anjonu koncentrācija ir mazāka nekā 5 mM.

17. Metode saskaņā ar 13. pretenziju atšķiras ar to, ka uzlabojums papildus ietver daudzvērtīgu katjonu, izņemot cinku, koncentrācijas ierobežošanu kompozīcijā, kas ir mazāka nekā 5 mM.

18. Metode saskaņā ar 13. pretenziju atšķiras ar to, ka uzlabojums papildus ietver jonizētu sāļu koncentrācijas ierobežošanu kompozīcijā, kas ir mazāka nekā 50 mM.

19. Metode saskaņā ar 13. pretenziju atšķiras ar to, ka cinka jonus izmanto koncentrācijā no 0,1 līdz 0,4 mM; daudzvērtīgu buferšķīdumu veidojošu anjonu koncentrāciju kompozīcijā ierobežo līdz koncentrācijai, kas ir mazāka nekā 5 mM; daudzvērtīgu metālu katjonu, izņemot cinku, koncentrāciju kompozīcijā ierobežo līdz koncentrācijai, kas ir mazāka nekā 5 mM; un jonizētu sāļu koncentrāciju kompozīcijā ierobežo līdz koncentrācijai, kas ir mazāka nekā 50 mM.

20. Metode saskaņā ar 13. pretenziju atšķiras ar to, ka kompozīcija papildus satur travoprostu kā terapeitiski aktīvo līdzekli.

- (51) **G01N 33/53**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2073008**
G01N 33/564⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
G01N 33/574⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 09004778.8 (22) 26.05.2006
(43) 24.06.2009
(45) 18.04.2012
(31) 0510943 (32) 27.05.2005 (33) GB
685422 P 27.05.2005 US
(62) 06744011.5 / 1 889 059
(73) ONCIMMUNE LIMITED, Clinical Sciences Building, City Hospital, Hucknall Road, Nottingham NG5 1PB, GB
(72) ROBERTSON, John Forsyth Russell, GB
BARNES, Tony, US
MURRAY, Andrea, GB
CHAPMAN, Caroline, GB
(74) White, Nina Louise, Boulton Wade Tennant, Verulam Gardens, 70 Gray's Inn Road, London WC1X 8BT, GB
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV
(54) **UZLABOTAS IMUNOLOĢISKO ANALĪZU METODES**
IMPROVED IMMUNOASSAY METHODS

(57) 1. Metode antivielas noteikšanai analizējamā paraugā, kas satur zīdītāja ķermeņa šķidrumu, pie kam minētā anti viela ir vērsta pret svešu vielu, kas ir ievadīta minētajam zīdītājam, pie tam metode ietver:

(a) analizējamā parauga pakļaušanu kontaktam ar minētajai antivielai specifiska antigēna vairākiem dažādiem daudzumiem,

(b) specifiskās saistīšanās pakāpes starp minēto antivielu un minēto antigēnu noteikšanu pie katras izmantotās atšķirīgās antigēna koncentrācijas un

(c) līknes "minētā specifiskās saistīšanās pakāpe atkarībā no antigēna daudzuma" veidošanu vai aprēķināšanu katram (a) solī izmantotajam antigēna daudzumam, pie kam uz antivielas, kas reaģē ar metodē izmantoto antigēnu, klātbūtni analizējamajā paraugā norāda S-formas vai sigmoidāla līkne.

2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam minētās antivielas klātbūtnes noteikšana ir balstīta uz specifiskās saistīšanās pakāpi kopējām vērtībām visām analizētajām antigēna koncentrācijām.

3. Metode saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, pie kam minētās zīdītājs ir cilvēks.

4. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, pie kam svešā viela ir terapeitisks līdzeklis.

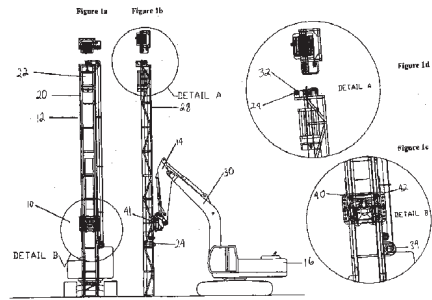
5. Metode saskaņā ar 4. pretenziju, pie kam terapeitiskais līdzeklis ir zāles, zāļu priekštečviela vai antivielu terapijas līdzeklis.

6. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, pie kam svešā viela ir vakcīna.

7. Metode saskaņā ar 5. vai 6. pretenziju, pie kam svešā viela ir terapeitiskā līdzekļa vai vakcīnas nemērķa daļa.

8. Metode saskaņā ar 7. pretenziju, pie kam nemērķa daļa ir biotīns.

9. Metode saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, pie kam svešā viela ir infekcijs aģents, tāds kā sēnes, baktērijas, vīrusi vai parazīti.



- (51) **E02D 7/02**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2084332**
E02D 7/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
E21B 7/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
E02D 7/16⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 07816127.0 (22) 02.11.2007
 (43) 05.08.2009
 (45) 11.01.2012
 (31) 856337 P (32) 03.11.2006 (33) US
 (86) PCT/CA2007/001977 02.11.2007
 (87) WO2008/052353 08.05.2008
 (73) Gunnarson, Jay, Box 23264, Grand Prairie, Alberta T8V 6X2, CA
 (72) GUNNARSON, Jay, CA
 (74) KIPA, Krahbichler Intellectual Property Advisors AB, P.O. Box 1065, 251 10 Helsingborg, SE
 Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV

(54) **SISTĒMA PĀLDZIŅA MONTĀŽAI**
SYSTEM FOR MOUNTING A PILE DRIVER

(57) 1. Sistēma virzošās rāmjeida ierīces montāžai uz būvmašīnas, kas satur:

- (a) virzošo rāmju komplektu ar pāldzini, kas ir uzstādīts tādā veidā, lai var slīdēt gar virzošo rāmju komplektu;
 (b) vismaz vienu cēlēj mehānismu, kas nodrošina pāldziņa aizkabināšanu un pāldziņa pārvietošanos gar virzošo rāmju komplektu;
 (c) pagriežamu montāžas mezglu, kas ir uzstādīts uz virzošo rāmju komplekta un ir pielāgots virzošo rāmju komplekta stāvokļa regulēšanai;
 (d) ātrās savienošanas mezglu, kas ir piemērots pagriežamā montāžas mezgla un būvmašīnas sakabināšanai ar mērķi nodrošināt būvmašīnas ātru sakabināšanu ar virzošo rāmju komplektu un tās atvienošanu no būvmašīnas, pie kam ātrās savienošanas mezgla ir pirmais dobums pirmajā virzienā un otrais dobums otrajā virzienā, un pirmais virziens ir vērsts perpendikulāri pret otro virzienu.

2. Sistēma virzošās rāmjeida ierīces montāžai uz būvmašīnas saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam pāldzinis ir sitnis, urbšanas galva vai gliemežurbis.

3. Sistēma virzošās rāmjeida ierīces montāžai uz būvmašīnas saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam pagriežamā montāžas mezgls papildus ietver montāžas galvu, kas ir aprīkota ar pagriežēj mehānismu, kas ļauj virzošajai rāmjeida ierīcei pagriezties.

4. Sistēma virzošās rāmjeida ierīces montāžai uz būvmašīnas saskaņā ar 3. pretenziju, pie kam pagriežēj mehānisms ļauj virzošo rāmjeida ierīci pagriezt vertikālā plaknē pa kreisi vai pa labi maksimāli 20° leņķī.

5. Sistēma virzošās rāmjeida ierīces montāžai uz būvmašīnas saskaņā ar 4. pretenziju, pie kam ātrās savienošanas mezgls papildus ietver ātri nomaināmu adapteri, kas ir uzstādīts uz montāžas galvas.

6. Sistēma virzošās rāmjeida ierīces montāžai uz būvmašīnas saskaņā ar 5. pretenziju, pie kam ātri nomaināmais adapteris ir pielāgots sakabināšanai ar būvmašīnu un to ir iespējams montēt uz būvmašīnas priekšējā stieņa vai izlīces.

7. Sistēma virzošās rāmjeida ierīces montāžai uz būvmašīnas saskaņā ar 6. pretenziju, pie kam cēlēj mehānisms papildus ietver pirmo cēlējmezglu, kurš, paceļot objektu, ievieto objektu virzošajā rāmjeida ierīcē, un otru cēlējmezglu, kurš paceļ un nolaiž pāldzini.

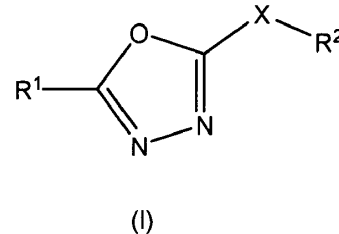
8. Sistēma virzošās rāmjeida ierīces montāžai uz būvmašīnas saskaņā ar 7. pretenziju, pie kam pirmais un otrais cēlējmezgls var būt hidrauliskās viņčas.

- (51) **C07D 413/04**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2091948**
A61K 31/4184⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/4245⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 07847471.5 (22) 28.11.2007
 (43) 26.08.2009
 (45) 18.04.2012
 (31) 867845 P (32) 30.11.2006 (33) US
 (86) PCT/EP2007/062953 28.11.2007
 (87) WO2008/065141 05.06.2008
 (73) Probiodrug AG, Weinbergweg 22, 06120 Halle/Saale, DE
 (72) BUCHHOLZ, Mirko, DE
 NIESTROJ, André J., DE
 HEISER, Ulrich, DE
 RAMSBECK, Daniel, DE
 SCHILLING, Stephan, DE

(74) Hoffmann, Matthias, et al, Probiodrug AG, Weinbergweg 22, 06120 Halle/Saale, DE
 Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV

(54) **GLUTAMINILCIKLĀZES JAUNIE INHIBITORI**
NOVEL INHIBITORS OF GLUTAMINYL CYCLASE

(57) 1. Savienojums ar formulu (I)



kur

R¹ ir 1H-benzoimidazol-5-ilgrupa;

R² ir C₁₋₁₀alkilgrupa; C₂₋₆alkenilgrupa, kur C₂₋₆alkinilgrupa, kas ir ar priekšnoteikumu, ka trīskāršā saite nav blakus X; C₁₋₄alkilarylgrupa, kur arilgrupa ir fenilgrupa vai naftilgrupa, kas neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no C₁₋₄alkilgrupas, C₁₋₄fluoralkilgrupas, C₁₋₄alkoksigrupas, halogēna un hidroksilgrupas;

C₁₋₄alkilheteroarylgrupa, kur heteroarylgrupa ir piridinilgrupa, kas neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no C₁₋₄alkilgrupas, C₁₋₄fluoralkilgrupas, C₁₋₄alkoksigrupas, halogēna atoma un hidroksilgrupas;

arylgrupa, kur arilgrupa ir fenilgrupa vai naftilgrupa, kas neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no C₁₋₄alkilgrupas, C₁₋₄fluoralkilgrupas, C₁₋₄alkoksigrupas, halogēna atoma un hidroksilgrupas; vai H;
 X ir S vai NR³;

R³ ir H vai C₁₋₄alkilgrupa;

vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, polimorfs vai solvāts, tai skaitā tā visi tautomēri un stereoizomēri;

ar nosacījumu, ka sekojošie savienojumi tiek izslēgti no formulas (I):

- (a) 5-[5-(metiltio)-1,3,4-oksodiazol-2-il]-1H-benzimidazols;
 (b) 5-[5-[(fenilmetil)tio]-1,3,4-oksodiazol-2-il]-1H-benzimidazols;
 (c) 5-[5-[(piridin-3-ilmetil)tio]-1,3,4-oksodiazol-2-il]-1H-benzimidazols;
 (d) 5-[5-[(piridin-4-ilmetil)tio]-1,3,4-oksodiazol-2-il]-1H-benzimidazols un

(e) 5-(1H-benzo[d]imidazol-5-il)-1,3,4-oksadiazol-2-iols.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R² ir C₁₋₁₀alkilgrupa; C₂₋₆alkenilgrupa; C₁₋₄alkilarylgrupa, kur arilgrupa ir, kā definēta 1. pretenzijā, C₁₋₄alkilheteroarilgrupa, kur heteroarilgrupa ir, kā definēta 1. pretenzijā, fenilgrupa vai naftilgrupa, kas neobligāti aizvietota ar vienu vai vairākiem aizvietotājiem, kas izvēlēti no C₁₋₄alkilgrupas, C₁₋₄fluoralkilgrupas, C₁₋₄alkoksigrupas, halogēna atoma un hidroksilgrupas; vai H.

3. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, kurā R² ir C₂₋₆alkenilgrupa, C₁₋₄alkilarylgrupa, kur arilgrupa ir, kā definēta 1. pretenzijā, vai H.

4. Savienojums saskaņā ar 3. pretenziju, kurā R² ir C₁₋₄alkilarylgrupa, kur arilgrupa ir, kā definēta 1. pretenzijā.

5. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā arilgrupa ir fenilgrupa, kas aizvietota ar vienu vai vairākām grupām, kas izvēlētas no halogēna, C₁₋₄alkilgrupas un C₁₋₄alkoksigrupas.

6. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kur R² ir benzilgrupa.

7. Savienojums saskaņā ar 3. pretenziju, kur R² ir H.

8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kur X ir NH.

9. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kur X ir S.

10. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas izvēlēts no:
 5-(5-(feniltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(5-(3-fenilpropiltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(5-(naftalen-2-il)metiltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(5-(alliltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(5-(etiltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(5-(oktltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(5-(4-*terc*-butilbenziltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(5-(4-hlorobenziltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(5-(4-fluorbenziltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(5-(3,4,5-trifluorbenziltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(5-(pentafluorbenziltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(5-(2,4,6-trimetilbenziltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(5-(2,3,4,5,6-pentametilbenziltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(5-(3,4,5-trimetoksibeniltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(5-(piridin-2-il)metiltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(1H-benzo[d]imidazol-5-il)-N-(3,4-dimetoksifenil)-1,3,4-oksadiazol-2-amīna;
 5-(1H-benzo[d]imidazol-5-il)-N-(4-hlorfenil)-1,3,4-oksadiazol-2-amīna;
 5-(1H-benzo[d]imidazol-5-il)-N-(4-fluorfenil)-1,3,4-oksadiazol-2-amīna;
 N-(4-fluorbenzil)-5-(1H-benzo[d]imidazol-5-il)-1,3,4-oksadiazol-2-amīna;
 5-(5-(4-metilbenziltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola;
 5-(1H-benzo[d]imidazol-5-il)-N-benzil-1,3,4-oksadiazol-2-amīna;
 vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, polimorfs vai solvāts.

11. Savienojums saskaņā ar 10. pretenziju, kas izvēlēts no:
 5-(5-(feniltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola,
 5-(5-(3-fenilpropiltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola,
 5-(5-(naftalen-2-il)metiltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola,
 5-(5-(alliltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola,
 5-(5-(4-*terc*-butilbenziltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola,
 5-(5-(4-hlorobenziltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola,
 5-(5-(4-fluorbenziltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola,
 5-(5-(pentafluorbenziltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola,
 5-(5-(2,4,6-trimetilbenziltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1H-benzo[d]imidazola,
 vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, polimorfs vai solvāts.

12. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai vai savienojums, kas izvēlēts no:

(a) 5-[5-(metiltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il]-1H-benzimidazola,
 (b) 5-[5-[(fenilmetil)tio]-1,3,4-oksadiazol-2-il]-1H-benzimidazola,
 (c) 5-[5-[(piridin-3-ilmetil)tio]-1,3,4-oksadiazol-2-il]-1H-benzimidazola,

(d) 5-[5-[(piridin-4-ilmetil)tio]-1,3,4-oksadiazol-2-il]-1H-benzimidazola un

(e) 5-(1H-benzo[d]imidazol-5-il)-1,3,4-oksadiazol-2-iola vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, polimorfs vai solvāts, izmantošanai par medikamentu.

13. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur savienojumu ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai vai savienojumu, kas izvēlēts no:

(a) 5-[5-(metiltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il]-1H-benzimidazola,

(b) 5-[5-[(fenilmetil)tio]-1,3,4-oksadiazol-2-il]-1H-benzimidazola,

(c) 5-[5-[(piridin-3-ilmetil)tio]-1,3,4-oksadiazol-2-il]-1H-benzimidazola,

(d) 5-[5-[(piridin-4-ilmetil)tio]-1,3,4-oksadiazol-2-il]-1H-benzimidazola un

(e) 5-(1H-benzo[d]imidazol-5-il)-1,3,4-oksadiazol-2-iola, vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, polimorfs vai solvāts, neobligāti kombinācijā ar vienu vai vairākiem terapeitiski pieņemamiem šķīdinātājiem vai nesējiem.

14. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 13. pretenziju, kas papildus satur vismaz vienu savienojumu, kas izvēlēts no rindas, kura sastāv no neiroprotektantiem, antiparkinsona līdzekļiem, amiloīda proteīna depoziācijas inhibitoriem, beta amiloīda sintēzes inhibitoriem, antidepresantiem, anksiolītiskiem līdzekļiem, antipsihotiskiem līdzekļiem un līdzekļiem multiplās sklerozes ārstēšanai.

15. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 13. vai 14. pretenziju, kas papildus satur vismaz vienu savienojumu, kas izvēlēts no rindas, kura sastāv no PEP inhibitoriem, LiCl, dipeptidilaminopeptidāzes inhibitoriem, vēlams DP IV vai DP IV tipa enzīmu inhibitoriem, acetilholinesterāzes (ACE) inhibitoriem, PIMT pastiprinātājiem, beta sekretāzes inhibitoriem, gamma sekretāzes inhibitoriem, neitrālas endopeptidāzes inhibitoriem, fosfodiesterāzes-4 (PDE-4) inhibitoriem, TNFalfa inhibitoriem, muskarīna M1 receptoru antagonistiem, NMDA receptoru antagonistiem, sigma-1 receptoru inhibitoriem, histamīna H3 antagonistiem, imūnmodulatoriem, imūnsupresīviem līdzekļiem; beta-amiloīda antivielām, cisteīna proteāzes inhibitoriem, MCP-1 antagonistiem vai līdzekļiem, kas izvēlēti no grupas, kura sastāv no integrīna (natalizumaba), *Neurelan* (fampridīna-SR), *campath* (alemuzumaba), IR 208, NBI 5788/MSP 771 (tiplimotīda), paklitaksela, Anergix.MS (AG 284), SH636, Diferīna (CD 271, adapalēna), BAY 361677 (interleikīna-4), matricas metālproteināzes inhibitoriem (piem., BB 76163), tau interferona (trofoblastīna) un SAIK-MS.

16. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai vai savienojums, kas izvēlēts no:

(a) 5-[5-(metiltio)-1,3,4-oksadiazol-2-il]-1H-benzimidazola,

(b) 5-[5-[(fenilmetil)tio]-1,3,4-oksadiazol-2-il]-1H-benzimidazola,

(c) 5-[5-[(piridin-3-ilmetil)tio]-1,3,4-oksadiazol-2-il]-1H-benzimidazola,

(d) 5-[5-[(piridin-4-ilmetil)tio]-1,3,4-oksadiazol-2-il]-1H-benzimidazola un

(e) 5-(1H-benzo[d]imidazol-5-il)-1,3,4-oksadiazol-2-iola; vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, polimorfs vai solvāts, vai farmaceitiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 13. līdz 15. pretenzijai izmantošanai slimības, kas izvēlēta no rindas, kura sastāv no Kenedija slimības, divpadsmitpirkstu zarnas vēža ar vai bez *Helicobacter pilori* infekcijas, kolorektālā vēža, Zolindžera-Elisona sindroma, kuņģa vēža ar vai bez *Helicobacter pilori* infekcijas, psihiskām saslimšanām, šizofrēnijas, neauglības, neoplāzijas, saimnieka iekaisuma reakcijām, vēža ļaundabīgām metastāzēm, melanomas, psoriāzes, humorālo un šūnu mediēto imūnreakciju traucējumiem, leikocītu adhēzijas un migrācijas procesu traucējumiem endotēlijā, barības uzņemšanas traucējumiem, miega un atmošanās traucējumiem, enerģijas metabolisma homeostatiskās regulācijas traucējumiem, autonomās nervu sistēmas funkciju traucējumiem, hormonālā līdzsvara vai ķermeņa šķidrums regulācijas traucējumiem, multiplās sklerozes, Gijēna Barē sindroma un hroniska iekaisuma demielinizējošas poliradikuloneiropātijas, ārstēšanā.

17. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai vai savienojums, kas izvēlēts no:

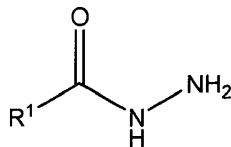
- (a) 5-[5-(metiltio)-1,3,4-oksodiazol-2-il]-1H-benzimidazola,
- (b) 5-[5-[(fenilmetil)tio]-1,3,4-oksodiazol-2-il]-1H-benzimidazola,
- (c) 5-[5-[(piridin-3-ilmetil)tio]-1,3,4-oksodiazol-2-il]-1H-benzimidazola,
- (d) 5-[5-[(piridin-4-ilmetil)tio]-1,3,4-oksodiazol-2-il]-1H-benzimidazola un
- (e) 5-(1H-benzo[d]imidazol-5-il)-1,3,4-oksodiazol-2-tiola, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, polimorfs vai solvāts, vai farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 13. līdz 15. pretenzijai izmantošanai slimības, kas izvēlēta no rindas, kura sastāv no viegliem kognitīviem traucējumiem, Alzheimeras slimības, pārmantotās britu demences (*Familial British Dementia*), pārmantotās dāņu demences (*Familial Danish Dementia*), Dauna sindroma un Hantingtona slimības, ārstēšanā.

18. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai vai savienojums, kas izvēlēts no:

- (a) 5-[5-(metiltio)-1,3,4-oksodiazol-2-il]-1H-benzimidazola,
- (b) 5-[5-[(fenilmetil)tio]-1,3,4-oksodiazol-2-il]-1H-benzimidazola,
- (c) 5-[5-[(piridin-3-ilmetil)tio]-1,3,4-oksodiazol-2-il]-1H-benzimidazola,
- (d) 5-[5-[(piridin-4-ilmetil)tio]-1,3,4-oksodiazol-2-il]-1H-benzimidazola un
- (e) 5-(1H-benzo[d]imidazol-5-il)-1,3,4-oksodiazol-2-tiola, vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, polimorfs vai solvāts, vai farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 13. līdz 15. pretenzijai izmantošanai slimības, kas izvēlēta no reimatoīdā artrīta, aterosklerozes, restenozes vai pankreatīta, ārstēšanā.

19. Paņēmiens savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai iegūšanai, kas ietver:

- (a) savienojuma ar formulu (I), kurā X ir S un R² ir ūdeņraža atoms, iegūšanu ar paņēmienu, kas satur savienojuma ar formulu (II)



(II)

kur R¹ ir, kā definēts jebkurā no 1. līdz 11. pretenzijai, reakciju ar oglekļa disulfīdu;

- (b) savienojuma ar formulu (I), kurā X ir S un R² nav ūdeņraža atoms vai arilgrupa, iegūšanu ar paņēmienu, kas satur savienojuma ar formulu (I), kurā X ir S un R² ir ūdeņraža atoms, reakciju ar savienojumu ar formulu (III),



kur R² nav ūdeņraža atoms vai arilgrupa un ir, kā definēts jebkurā no 1. līdz 11. pretenzijai, kur L ir aizejošā grupa;

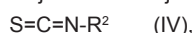
- (c) savienojuma ar formulu (I), kurā X ir S un R² ir arilgrupa, iegūšanu ar paņēmienu, kas satur savienojuma ar formulu (I), kurā X ir S un R² ir ūdeņraža atoms, reakciju ar savienojumu ar formulu (III')



kur R² ir arilgrupa un ir, kā definēts jebkurā no 1. līdz 11. pretenzijai, Cul klātbūtnē;

- (d) savienojuma ar formulu (I), kurā X ir S un R² ir -CH=CH₂ vai tā homologs ar garāku oglekļa ķēdi, iegūšanu ar savienojuma ar formulu (I), kurā X ir S un R² ir H, reakciju ar piemērotu vinilhalogenīdu vai

- (e) savienojuma ar formulu (I), kurā X ir NH, iegūšanu savienojuma ar formulu (II) reakcijā ar savienojumu ar formulu (IV)



kur R² ir, kā definēts jebkurā no 1. līdz 11. pretenzijai, ar sekojošu reaģenta pievienošanu, kas atvieglo gredzena slēgšanu.

- (21) 07862940.9 (22) 14.12.2007
- (43) 11.11.2009
- (45) 06.06.2012
- (31) 874922 P (32) 14.12.2006 (33) US
- 916415 P 07.05.2007 US
- 985323 P 05.11.2007 US
- (86) PCT/US2007/025653 14.12.2007
- (87) WO2008/076379 26.06.2008
- (73) Regeneron Pharmaceuticals, Inc., 777 Old Saw Mill River Road, Tarrytown, NY 10591, US
- (72) PAPADOPOULOS, Nicholas J., US
- MARTIN, Joel H., US
- SMITH, Eric, US
- NOGUERA-TROISE, Irene, US
- THURSTON, Gavin, US
- (74) Bentham, Andrew, et al, J A Kemp, 14 South Square, Gray's Inn, London WC1R 5JJ, GB
- Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV

(54) **CILVĒKA ANTIVIELAS PRET CILVĒKA DELTA-LĪDZĪGU LIGANDU 4 HUMAN ANTIBODIES TO HUMAN DELTA LIKE LIGAND 4**

(57) 1. Cilvēka antivielai vai antivielas fragments, kurš specifiski saista cilvēka delta-līdzīgo ligandu 4 (hD114), pie kam minētā antivielai vai antivielas fragments ietver smagās ķēdes variablo rajonu/vieglās ķēdes variablo rajonu (HCVR/LCVR), kas izvēlēts no aminoskābes sekvences pāriem SEQ ID Nr. 429/437 un 901/903.

2. Cilvēka antivielai vai antivielas fragments saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus ietver konstantu rajonu, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no SEQ ID Nr. 950, 951 un 952.

3. Izdalīta nukleīnskābes molekula, kas kodē antivielu vai antigēna saistīto fragmentu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju.

4. Vektors, kas ietver nukleīnskābes molekulu saskaņā ar 3. pretenziju.

5. Saimniekšūna, kas ietver vektoru saskaņā ar 4. pretenziju.

6. Saimniekšūna saskaņā ar 5. pretenziju, kura ir prokariotiska vai eikariotiska šūna, kas izvēlēta no vienas no *E. coli* vai CHO šūnas.

7. Paņēmiens anti-cilvēka D114 antivielas vai tās antigēna saistītā fragmenta iegūšanai, kas ietver saimniekšūnu saskaņā ar 5. vai 6. pretenziju audzēšanu apstākļos, kas pieļauj antivielas vai tās fragmenta iegūšanu, un tādā veidā producēto antivielu vai fragmentu reģenerēšanu.

8. Antivielas vai antivielas antigēna saistītā fragmenta saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošana medikamenta ražošanā vēža ārstēšanai cilvēkam.

9. Antivielai vai antivielas fragments saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju izmantošanai vēža ārstēšanas paņēmienā cilvēkam.

10. Kompozīcija, kas ietver antivielu vai antivielas fragmentu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju un pieņemamu nesēju.

- (51) **C07D 215/26**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2121615**
- (21) 08707620.4 (22) 08.02.2008
- (43) 25.11.2009
- (45) 28.03.2012
- (31) 200700362 (32) 09.02.2007 (33) ES
- (86) PCT/EP2008/000975 08.02.2008
- (87) WO2008/095720 14.08.2008
- (73) Almirall, S.A., Ronda General Mitre 151, 08022 Barcelona, ES
- (72) PUIG DURAN, Carlos, ES
- MOYES VALLS, Enrique, ES
- (74) Srinivasan, Ravi Chandran, J.A. Kemp & Co. 14 South Square Gray's Inn, London WC1R 5JJ, GB
- Svetlana MAKEJEVA, SIA Intelektuālā īpašuma juridiskā firma LATISS, a/k 274, Rīga LV-1084, LV

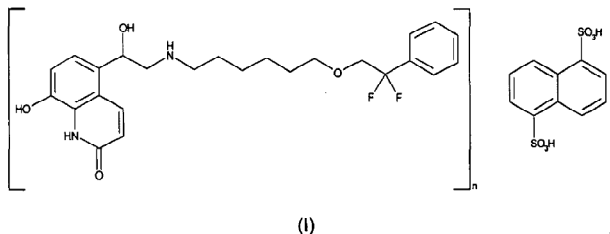
(54) **5-(2-[6-(2,2-DIFLUOR-2-FENILETOKSI)HEKSIL]AMINO-1-HIDROKSJETIL)-8-HIDROKSIHINOLIN-2(1H)-ONA NAPADISILĀTA SĀLS KĀ BETA-2-ADRENERĢISKO RECEPTORU AGONISTS**

- (51) **C07K 16/22**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2115003**
- A61K 39/395**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- A61P 35/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

NAPADISYLATE SALT OF 5-(2-[6-(2,2-DIFLUORO-2-PHENYLETHOXY)HEXYL]AMINO-1-HYDROXYETHYL)-8-HYDROXYQUINOLIN-2(1H)-ONE AS AGONIST OF THE BETA 2 ADRENERGIC RECEPTOR

(57) 1. Kristālais 5-(2-[[6-(2,2-difluor-2-feniletoksi)heksil]amino]-1-hidroksietil)-8-hidroksihinolin-2(1H)-ona mononapadisilāta un/vai heminapadisilāta sāls un tā farmaceitiski pieņemami solvāti.

2. Sāls saskaņā ar 1. pretenziju, kam ir formula (I):



kur n vērtība ir 1 vai 2, un tā farmaceitiski pieņemami solvāti.

3. Sāls saskaņā ar 2. pretenziju, kur n vērtība ir 2.

4. Sāls saskaņā ar 1. pretenziju, atlasīts no grupas, kas sastāv no:

(R,S)5-(2-[[6-(2,2-difluor-2-feniletoksi)heksil]amino]-1-hidroksietil)-8-hidroksihinolin-2(1H)-ona napadisilāta,

5-(2-[[6-(2,2-difluor-2-feniletoksi)heksil]amino]-1(R)-hidroksietil)-8-hidroksihinolin-2(1H)-ona napadisilāta,

(R,S)5-(2-[[6-(2,2-difluor-2-feniletoksi)heksil]amino]-1-hidroksietil)-8-hidroksihinolin-2(1H)-ona heminapadisilāta un

5-(2-[[6-(2,2-difluor-2-feniletoksi)heksil]amino]-1(R)-hidroksietil)-8-hidroksihinolin-2(1H)-ona heminapadisilāta, un to farmaceitiski pieņemamiem solvātiem.

5. Sāls saskaņā ar 4. pretenziju, kas atlasīts no grupas, kas sastāv no:

(R,S)5-(2-[[6-(2,2-difluor-2-feniletoksi)heksil]amino]-1-hidroksietil)-8-hidroksihinolin-2(1H)-ona heminapadisilāta,

5-(2-[[6-(2,2-difluor-2-feniletoksi)heksil]amino]-1(R)-hidroksietil)-8-hidroksihinolin-2(1H)-ona heminapadisilāta un to farmaceitiski pieņemamiem solvātiem.

6. Sāls saskaņā ar 5. pretenziju, kas ir 5-(2-[[6-(2,2-difluor-2-feniletoksi)heksil]amino]-1(R)-hidroksietil)-8-hidroksihinolin-2(1H)-ona heminapadisilāts vai tā farmaceitiski pieņemams solvāts.

7. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar satur terapeitiski efektīvu daudzumu sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai un farmaceitiski pieņemamu nesēju.

8. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 7. pretenziju, kur kompozīcija ir sagatavota ievadīšanai inhalācijas ceļā.

9. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 7. vai 8. pretenziju, kur kompozīcija papildus satur vienu vai vairāku citu terapeitisku līdzekļu terapeitiski efektīvu daudzumu.

10. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 9. pretenziju, kur cits terapeitiskais līdzeklis ir kortikosteroīds, antiholīnērgisks līdzeklis un/vai PDE4 inhibitors.

11. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kur cits terapeitiskais līdzeklis ir kortikosteroīds, kas atlasīts no grupas, kas satur prednizolonu, metilprednizolonu, deksametazonu, deksametazona cipecilātu, naflokortu, deflazakortu, halopredona acetātu, budezonīdu, beklometazona dipropionātu, hidrokortizonu, triamcinolona acetonīdu, flucinolona acetonīdu, flucinonīdu, klorokortolona pivalātu, metilprednizolona aceponātu, deksametazona palmitātu, tipredānu, hidrokortizona aceponātu, prednikarbātu, alkometazona dipropionātu, halometazonu, metilprednizolona suleptanātu, mometazona furoātu, rimeksolonu, prednizolona farnezilātu, ciklezonīdu, butiksokorta propionātu, RPR-106541, deprodona propionātu, flutikazona propionātu, flutikazona furoātu, halobetazona propionātu, loteprednola etabonātu, betametazona butirāta propionātu, flunizolidu, prednizonu, deksametazona nātrija fosfātu, triamcinolonu, betametazona 17-valerātu, betametazonu, betametazona dipropionātu, hidrokortizona acetātu, hidrokortizona nātrija sukcinātu, prednizolona nātrija fosfātu un hidrokortizona probutātu.

12. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kur cits terapeitiskais līdzeklis ir antiholīnērgisks līdzeklis, kas atlasīts no grupas, kas satur tiotropija sāļus, oksitropija sāļus, flutropija sāļus, ipratropija sāļus, glikopironija sāļus, tropija sāļus,

revatropātu, espatropātu, 3-[2-hidroksi-2,2-bis(2-tienil)acetoksi]-1-(3-fenoksipropil)-1-azonijbiciklo[2.2.2]oktāna sāļus, 1-(2-feniletil)-3-(9H-ksanten-9-ilkarboniloksi)-1-azonijbiciklo[2.2.2]oktāna sāļus, 2-okso-1,2,3,4-tetrahidrohinazolīn-3-karbonskābes endo-8-metil-8-azabicyclo[3.2.1]okt-3-ilestera sāļus (DAU-5884), 3-(4-benzilpiperazin-1-il)-1-ciklobutil-1-hidroksi-1-fenilpropan-2-onu (NPC-14695), N-[1-(6-aminopiridin-2-ilmetil)piperidin-4-il]-2(R)-[3,3-difluor-1(R)-ciklopentil]-2-hidroksi-2-fenilacetamīdu (J-104135), 2(R)-ciklopentil-2-hidroksi-N-[1-[4(S)-metilheksil]piperidin-4-il]-2-fenilacetamīdu (J-106366), 2(R)-ciklopentil-2-hidroksi-N-[1-(4-metil-3-pentenil)-4-piperidinil]-2-fenilacetamīdu (J-104129), 1-[4-(2-aminoetil)piperidin-1-il]-2(R)-[3,3-difluorociklopent-1(R)-il]-2-hidroksi-2-feniletan-1-onu (Banyu-280634), N-[N-[2-[N-[1-(cikloheksilmetil)piperidin-3(R)-ilmetil]karbamoil]etil]karbamoilmetil]-3,3,3-trifenilpropionamīdu (Banyu CPTP), 2(R)-ciklopentil-2-hidroksi-2-feniletikskābes 4-(3-azabicyclo[3.1.0]heks-3-il)-2-butinilesteri (Ranbaxy 364057), UCB-101333, Merck OrM3, 7-endo-(2-hidroksi-2,2-difenilacetoksi)-9,9-dimetil-3-oksā-9-azoniatriciklo[3.3.1.0(2,4)]nonāna sāļus, 7-(2,2-difenilpropioniloksi)-7,9,9-trimetil-3-oksā-9-azoniatriciklo[3.3.1.0*2,4*]nonāna sāļus, 7-hidroksi-7,9,9-trimetil-3-oksā-9-azoniatriciklo[3.3.1.0*2,4*]nonāna 9-metil-9H-fluoren-9-karbonskābes estera sāļus, tos visus pēc izvēles to racemātu, enantiomēru, diastereomēru un to maisījumu formā, un pēc izvēles to farmakoloģiski saderīgu skābes pievienošanas sāļu formā.

13. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 10. pretenziju, kur cits terapeitiskais līdzeklis ir PDE4 inhibitors, kas atlasīts no grupas, kas sastāv no denbufilīna, roliprama, cipamfilīna, arofilīna, filaminasta, piklamilasta, mezoprama, drotaverīna hidrohlorīda, lirimilasta, roflumilasta, cilomilasta, oglemilasta, apremilasta, 6-[2-(3,4-dietoksifenil)tiazol-4-il]piridīn-2-karbonskābes (tetomilasta), (R)-(+)-4-[2-(3-ciklopentiloksi-4-metoksifenil)-2-feniletil]piridīna, N-(3,5-dihlor-4-piridinil)-2-[1-(4-fluorbenzil)-5-hidroksi-1H-indol-3-il]-2-oksacetamīda (GSK-842470), 9-(2-fluorbenzil)-N6-metil-2-(trifluormetil)adenīna, N-(3,5-dihlor-4-piridinil)-8-metoksihinolīn-5-karboksamīda, N-[9-metil-4-okso-1-fenil-3,4,6,7-tetrahidropirrol[3,2,1-jk][1,4]benzodiazepin-3(R)-il]piridīn-4-karboksamīda, 3-[3-(ciklopentiloksi)-4-metoksibenzil]-6-(etilamino)-8-izopropil-3H-purīna hidrohlorīda, 4-[6,7-dietoksi-2,3-bis(hidroksimetil)naftalen-1-il]-1-(2-metoksietil)piridīn-2(1H)-ona, 2-karbometoksi-4-ciān-4-(3-ciklopropilmetoksi-4-difluormetoksifenil)cikloheksan-1-ona, cis-[4-ciān-4-(3-ciklopropilmetoksi-4-difluormetoksifenil)cikloheksan-1-ola] un ONO-6126 (Eur. Respir. J. 2003, 22 (Suppl. 45): Abst. 2557).

14. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 13. pretenzijai, kur cits terapeitiskais līdzeklis ir atlasīts no grupas, kas sastāv no mometazona furoāta, ciklezonīda, budezonīda, flutikazona propionāta, flutikazona furoāta, tiotropija sāļiem, glikopirrolija sāļiem, 3-[2-hidroksi-2,2-bis(2-tienil)acetoksi]-1-(3-fenoksipropil)-1-azonijbiciklo[2.2.2]oktāna sāļiem, 1-(2-feniletil)-3-(9H-ksanten-9-ilkarboniloksi)-1-azonijbiciklo[2.2.2]oktāna sāļiem, roliprama, roflumilasta un cilomilasta.

15. Kombinācija, kas satur sāli, kā definēts jebkurā no 1. līdz 6. pretenzijai, un vienu vai vairākus citus terapeitiskus līdzekļus, kā definēts jebkurā no 9. līdz 14. pretenzijai.

16. Sāls saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai vai farmaceitiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 7. līdz 14. pretenzijai izmantošanai astmas vai hroniskas obstruktīvas plaušu slimības ārstēšanā zīdītājiem.

17. Sāls vai farmaceitiska kompozīcija izmantošanai astmas vai hroniskas obstruktīvas plaušu slimības ārstēšanā saskaņā ar 16. pretenziju, kur sāls vai farmaceitiskā kompozīcija tiek ievadīti kopā ar vienu vai vairākiem citiem terapeitiskiem līdzekļiem, kā definēts jebkurā no 9. līdz 14. pretenzijai.

(51) **A61K 31/136**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 31/166⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 31/196⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 31/343⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 31/357⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 31/4439⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 31/47⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 31/606⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

A61K 31/609⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾

(11) **2131829**

- G01N 33/94⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**
A61P 1/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 1/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 1/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 11/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 17/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 08717161.7 (22) 27.02.2008
(43) 16.12.2009
(45) 18.04.2012
(31) 20070129 (32) 28.02.2007 (33) IE
(86) PCT/EP2008/052354 27.02.2008
(87) WO2008/104557 04.09.2008
(73) Giuliani International Limited, 33 Sir John Rogerson's Quay, Dublin 2, IE
- (72) BARONI, Sergio, IT
DESREUMAUX, Pierre, FR
BELLINVIA, Salvatore, IT
- (74) Gates, Marie Christina Esther, et al, Tomkins & Co., 5 Dartmouth Road, Dublin 6, IE
Valters GENCS, Zvērināta advokāta Valtera Genca birojs, Kr. Valdemāra iela 21, Rīga LV-1010, LV
- (54) **PPAR-GAMMA AGONISTI KATJONU ANTIMIKROBO PEPTĪDU EKSPRESIJAS INDUCĒŠANAI KĀ IMŪNAIZ-SARDZĪBAS STIMULANTI**
PPAR-GAMMA AGONISTS FOR THE INDUCTION OF CATIONIC ANTIMICROBIAL PEPTIDE EXPRESSION AS IMMUNOPROTECTIVE STIMULANTS
- (57) 1. Savienojums, kas izvēlēts no: 2-metoksi-3-(4'-aminofenil)propionskābe, 5-amino-N-dihidroksi-2-metoksibenzamīds, 2-etoksi-3-(4'-aminofenil)propionskābe vai 2-etoksi-3-(3'-aminofenil)propionskābe, kas paredzēts akūta divertikulīta ārstēšanai un/vai novēršanai.
2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas paredzēts lietošanai saskaņā ar 1. pretenziju, kur akūta divertikulīta ārstēšana un/vai novēršana notiek pacientiem, kas saslimuši ar resnās zarnas divertikulozi, nenoteiktu kolītu un infekciozu kolītu.
3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kas paredzēts lietošanai saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā savienojums ir 2-metoksi-3-(4'-aminofenil)propionskābe.
4. Savienojums saskaņā ar 3. pretenziju, kas paredzēts lietošanai saskaņā ar 3. pretenziju, kurā savienojums ir kā racēmisks maisījums vai S- vai R-enantiomērs.
5. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kas paredzēts pielietošanai saskaņā ar 4. pretenziju, kurā savienojums ir sastāvā, kas satur viena enantiomēra pārākumu pār citiem enantiomēriem.

- (51) **A61K 31/5377⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2131845**
C07D 295/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 35/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 08717228.4 (22) 28.02.2008
(43) 16.12.2009
(45) 11.04.2012
(31) 07103346 (32) 01.03.2007 (33) EP
(86) PCT/EP2008/052443 28.02.2008
(87) WO2008/104595 04.09.2008
(73) Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH
VERNALIS (R&D) LTD, Oakdene Court, 613 Reading Road, Winnersh, Wokingham, Berkshire, RG41 5UA, GB
- (72) DRYSDALE, Martin James, GB
DYMOCK, Brian William, SG
KRELL, Christoph, CH
MUTZ, Michael, DE
PETERSEN, Holger, DE
ZHENG, Weijia, US
- (74) Gruber, Markus, Novartis Pharma AG, Patent Department, 4002 Basel, CH
Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
- (54) **5-(2,4-DIHDROKSI-5-IZOPROPIL-FENIL)-4-(4-MORFO-LIN-4-ILMETILFENIL)-IZOKSAZOL-3-KARBONSKĀBES ETILAMĪDA MEZILĀTS, TĀ HIDRĀTI UN POLIMORFI UN KOMPOZĪCIJAS, KAS SATUR ŠĪS FORMAS**

5-(2,4-DIHDROKSI-5-IZOPROPYL-PHENYL)-4-(4-MORPHOLIN-4-YLMETHYL-PHENYL)-ISOXAZOLE-3-CARBOXYLIC ACID ETHYLAMIDE MESYLATE, HYDRATES AND POLYMORPHS THEREOF, AND FORMULATIONS COMPRISING THESE FORMS

- (57) 1. 5-(2,4-dihidroksi-5-izopropilfenil)-4-(4-morfolin-4-ilmetilfenil)-izoksazol-3-karbonskābes etilamīda mezilāts.
2. 5-(2,4-dihidroksi-5-izopropilfenil)-4-(4-morfolin-4-ilmetilfenil)-izoksazol-3-karbonskābes etilamīda mezilāta kristāliska forma.
3. Kristāliskā forma saskaņā ar 2. pretenziju, kas ir 5-(2,4-dihidroksi-5-izopropilfenil)-4-(4-morfolin-4-ilmetilfenil)-izoksazol-3-karbonskābes etilamīda mezilāta anhidrāts.
4. 5-(2,4-dihidroksi-5-izopropilfenil)-4-(4-morfolin-4-ilmetilfenil)-izoksazol-3-karbonskābes etilamīda mezilāta anhidrāta kristāliska forma I, kuras rentgenstaru difraktogramma, izsakot 2-tēta vērtībās, satur maksimumus pie 8,0, 11,9, 13,9, 14,2, 16,7, 18,5, 19,4, 22,7, 23,3 ± 0,2 grādiem.
5. Kristāliskā forma saskaņā ar 2. pretenziju, kas ir 5-(2,4-dihidroksi-5-izopropilfenil)-4-(4-morfolin-4-ilmetilfenil)-izoksazol-3-karbonskābes etilamīda mezilāta hidrāts.
6. 5-(2,4-dihidroksi-5-izopropilfenil)-4-(4-morfolin-4-ilmetilfenil)-izoksazol-3-karbonskābes etilamīda mezilāta hidrāta forma H_A, kuras rentgenstaru difraktogramma, izsakot 2-tēta vērtībās, satur maksimumus pie 11,0, 11,6, 14,1, 18,1, 20,1, 20,5, 21,1, 21,7, 21,9, 25,8 ± 0,2 grādiem.
7. 5-(2,4-dihidroksi-5-izopropilfenil)-4-(4-morfolin-4-ilmetilfenil)-izoksazol-3-karbonskābes etilamīda mezilāta hidrāta forma H_B, kuras rentgenstaru difraktogramma, izsakot 2-tēta vērtībās, satur maksimumus pie 6,2, 10,1, 12,6, 14,5, 18,0, 18,5, 19,0, 20,4, 20,9, 21,8, 22,2, 25,4 ± 0,2 grādiem.
8. Kompozīcija, kas satur 5-(2,4-dihidroksi-5-izopropilfenil)-4-(4-morfolin-4-ilmetilfenil)-izoksazol-3-karbonskābes etilamīda mezilātu, kas ir ūdens šķīdums, kurš satur 5-(2,4-dihidroksi-5-izopropilfenil)-4-(4-morfolin-4-ilmetilfenil)-izoksazol-3-karbonskābes etilamīda mezilātu, nesatur nekādus citus sāļus, un kura pH ir 3,2 līdz 5,2.
9. Kompozīcija, kas sastāv no 5-(2,4-dihidroksi-5-izopropilfenil)-4-(4-morfolin-4-ilmetilfenil)-izoksazol-3-karbonskābes etilamīda mezilāta sāls un 5 % masa/masa glikozes un mannitola izotoniska ūdens šķīduma.

- (51) **F25B 11/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2147265**
F25B 1/053⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
F25B 1/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 07736863.7 (22) 22.05.2007
(43) 27.01.2010
(45) 21.03.2012
(86) PCT/IT2007/000360 22.05.2007
(87) WO2008/142714 27.11.2008
(73) Angelantoni Cleantech Srl, Località Cimacolle 464, 06056 Massa Martana (PG), IT
- (72) ASCANI, Maurizio, IT
- (74) Pistolesi, Roberto, Dragotti & Associati Srl, Via Nino Bixio, 7, 20129 Milano, IT
Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra INTELS, a/k 30, LV-1083 Rīga, LV
- (54) **DZESĒŠANAS IERĪCE UN PAŅĒMIENS AR TO SAISTĪTĀ DZESĒŠANAS ŠĶIDRUMA CIRKULĒŠANAI REFRIGERATING DEVICE AND METHOD FOR CIRCULATING A REFRIGERATING FLUID ASSOCIATED WITH IT**
- (57) 1. Saldēšanas iekārta, kas satur: galveno kompresoru (190); kondensatoru (140), kas attiecībā pret galveno kompresoru (190) ir izvietots cirkulējošā šķidruma plūsmas lejteces virzienā; galveno izplešanās elementu (170), kas attiecībā pret kondensatoru (140) ir izvietots cirkulējošā šķidruma plūsmas lejteces virzienā; iztvaicētāju (180), kas attiecībā pret galveno izplešanās elementu (170) ir izvietots cirkulējošā šķidruma plūsmas lejteces virzienā; turbokompresoru (160), kas sastāv no kompresora daļas (166) un pirmās turbīnas daļas (162) un ir izvietots cirkulējošā šķidruma plūsmā starp iztvaicētāju (180) un galveno kompresoru (190); pirmo siltummaini (150), kas satur karsto nozarojumu (150c), kas cirkulējošā šķidruma plūsmas augšteces virzienā caur iepļūdes

cauruļvadu (145) ir savienots ar kondensatoru (140) un cirkulējošā šķidruma plūsmas lejteces virzienā caur izplūdes cauruļvadu (149) ir savienots ar galveno izplešanās elementu (170),

kas raksturīga ar to, ka vismaz vienam siltummaiņim (150, 152) ir aukstais nozarojums (150f), kas augšteces virzienā ir savienots ar iekšējās cauruļvada (145) un pirmā siltummaiņa (150) karsto nozarojumu (150c) un kas caur izplešanās elementu (142) ir iemontēts minētā cauruļvada (145) nozarojumā (146), un kas cirkulējošā šķidruma plūsmas lejteces virzienā ir savienots ar turbokompresora (160) pirmo turbīnas daļu (162), iztukšojot pirmo turbīnas daļu (162) cirkulējošā šķidruma plūsmas lejteces virzienā no turbokompresora kompresora daļas (160) un cirkulējošā šķidruma plūsmas augšteces virzienā no galvenā kompresora (190).

2. Iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka pirmais siltummaiņis (150) ir cauruļvada kūļa siltummaiņis.

3. Iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka pirmais siltummaiņis (150) ir plāksņveida siltummaiņis.

4. Iekārta saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka izplešanās elements (142) ir izoentālpiskais drošēlvārsts.

5. Iekārta saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka tā satur otro siltummaiņi (152), kas ir izvietots virknē starp kondensatoru (140) un galveno izplešanās elementu (170), un ar to, ka turbokompresors (160) satur otro turbīnas daļu (164), otro siltummaiņi (152) ar karsto nozarojumu (152c), kurš cirkulējošā šķidruma plūsmas augšteces virzienā ar savienošanas cauruļvada (147) palīdzību ir saistīts ar pirmā siltummaiņa karsto nozarojumu (150c) un ar otrā siltummaiņa (152) auksto nozarojumu (152f), kas augšteces virzienā ir savienots ar izplešanās elementu (144), kurš ir iemontēts cauruļvada (147) nozarojumā (148) un cirkulējošā šķidruma plūsmas lejteces virzienā ir savienots ar turbokompresora (160) otro turbīnas daļu (164), iztukšojot otro turbīnas daļu (164) cirkulējošā šķidruma plūsmas lejteces virzienā un augšteces virzienā uz galveno kompresoru (190).

6. Paņēmiens dzesēšanas šķidruma cirkulācijai, kas sastāv no šādiem posmiem:

dzesēšanas šķidruma saspiešana galvenajā kompresorā (190); šķidruma kondensēšana kondensatorā (140), kas atrodas cirkulējošā šķidruma plūsmas lejteces virzienā aiz galvenā kompresora (190);

šķidruma izplešana galvenajā izplešanās elementā, kas cirkulējošā šķidruma plūsmas lejteces virzienā atrodas aiz kondensatora (140);

šķidruma iztvaicēšana iztvaicētājā (180), kas cirkulējošā šķidruma plūsmas lejteces virzienā atrodas aiz galvenā izplešanās elementa,

raksturīgs ar to, ka: starp kondensēšanās posmu un izplešanās posmu satur siltumapmaiņas posmu pirmajā siltumapmaiņī (150) starp saspiesto dzesēšanas šķidrumu, kas cirkulē pa pirmā siltumapmaiņa (150) karsto nozarojumu (150c), un saspieš dzesēšanas šķidruma apjomu (s1), kas tiek izvadīts augšteces virzienā attiecībā pret pirmo siltumapmaiņi (150) un tiek atdzesēts, plūstot cauri izplešanās elementam (142) un siltumapmaiņa (150) aukstajam nozarojumam;

starp izplešanās posmu un kondensēšanās posmu tiek īstenots dzesējošā šķidruma pirmssaspiešanas posms turbokompresorā (160), pie kam minētais pirmssaspiešanas posms kā vienu stadiju ietver izplešanos turbokompresorā (160) un vēl vienu stadiju, kurā turbīnas pirmajā daļā (162) izplešas dzesējošā šķidruma apjoms (s1), kas izplūst no siltummaiņa (150) aukstā nozarojuma (150f);

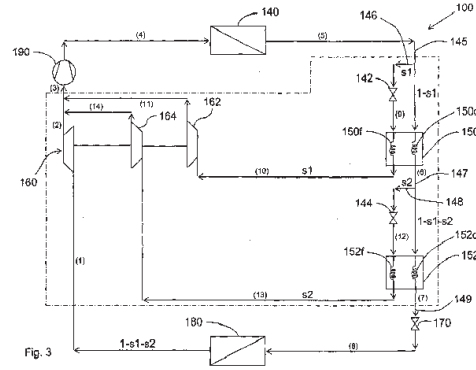
ietver izplūdes posmu, kurā tiek izvadīts šķidrums, kas izplūst no pirmās turbīnas daļas (162), pie kam tas, raugoties cirkulējošās plūsmas virzienā, tiek izvadīts pēc turbokompresora (160) kompresora daļas pirms galvenā kompresora (190).

7. Paņēmiens saskaņā ar 6. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tas, raugoties cirkulējošā šķidruma plūsmas lejteces virzienā, ietver vismaz vienu siltumapmaiņas posmu starp minēto kondensēšanās posmu un minēto izplešanās posmu, pie kam:

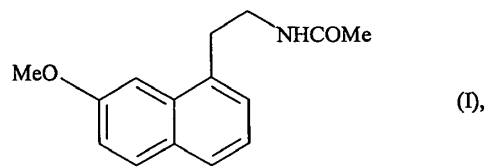
otrais posms ietver siltumapmaiņu otrajā siltummaiņī (152), kas ir izvietots virknē ar pirmo siltumapmaiņi (150), starp dzesēšanas šķidrumu, kas izplūst no pirmā siltummaiņa (150) karstā nozarojuma (150c) un cirkulē pa otrā siltummaiņa (152) karsto nozarojumu (152c), un dzesējošā šķidruma saistīto apjomu (s2),

kas izplūst plūsmas augšteces virzienā no otrā siltummaiņa (152), atdziest izplešanās elementā (144) un cirkulē aukstajā nozarojumā (152f), pie kam izplešanās minētajā pirmssaspiešanas posmā papildus ietver izplešanos turbokompresora (160) otrajā turbīnas daļā (164);

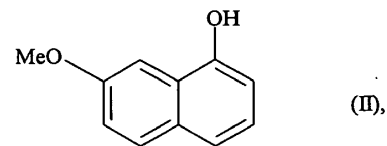
pirmssaspiešanas posms starp galveno izplešanās posmu un galveno saspiešanas posmu tiek nodrošināts ar izplešanos turbokompresora (160) turbīnas pirmajā un otrajā daļā (162, 164), šķidrumam aizplūstot no katra siltummaiņa (150, 152), pie tam šķidrums izplūst no otrās turbīnas daļas cirkulējošā šķidruma plūsmas lejteces virzienā attiecībā pret turbokompresora (160) kompresora daļu un augšteces virzienā no galvenā kompresora (190).



- (51) **C07C 231/02**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2151428**
C07C 231/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07C 233/11⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07C 233/18⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07C 233/91⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 209/48⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 09290606.4 (22) 04.08.2009
(43) 10.02.2010
(45) 07.03.2012
(31) 0804465 (32) 05.08.2008 (33) FR
(73) Les Laboratoires Servier, 35, rue de Verdun, 92284 Suresnes Cedex, FR
(72) HARDOUIN, Christophe, FR
LECOUVE, Jean-Pierre, FR
BRAGNIER, Nicolas, FR
(74) Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
(54) **AGOMELATĪNA IEGŪŠANAS PAŅĒMIENS**
PROCESS FOR THE PREPARATION OF AGOMELATIN
(57) 1. Savienojuma ar formulu (I):



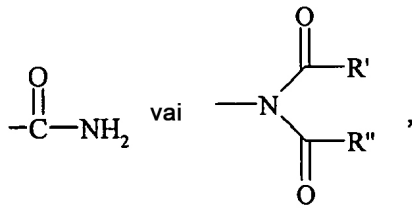
rūpnieciskās sintēzes paņēmiens raksturīgs ar to, ka 7-metoksi-1-naftols ar formulu (II):



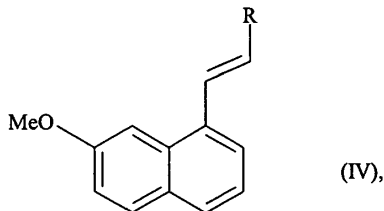
reaģē, kondensējot to, pallādija klātbūtnē pēc hidroksilgrupas pārvēršanas par aizvietojamu grupu, piemēram, halogēna atomu, tozilatgrupu vai trifluorometānsulfonātgrupu, ar savienojumu ar formulu (III):



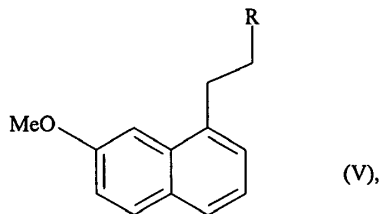
kur R apzīmē grupu:



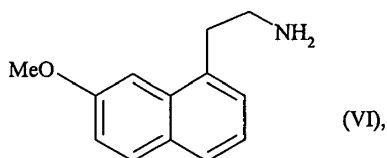
kur R' un R'', kuras var būt vienādas vai dažādas, katra apzīmē (C₁-C₆)alkilgrupu ar taisnu vai sazarotu virkni, vai R' un R'' kopā veido (C₂-C₃)alkilēnķēdi, tādējādi ļauj gredzenam, kas tika veidots, saistīties ar fenilgrupu, lai iegūtu savienojumu ar formulu (IV):



kur R ir tāda, kā definēts iepriekš, kuru pakļauj katalītiskai hydrogenēšanai, iegūstot savienojumu ar formulu (V):



kur R ir tāda, kā definēts iepriekš, kuru pakļauj hidrolīzei sārmainā vai skābā vidē vai bināras reducētāja/skābes sistēmas iedarbībai, iegūstot savienojumu ar formulu (VI) vai tā hidrohlorīdu:



kuru secīgi pakļauj nātrija acetāta un pēc tam etiķskābes anhidrīda iedarbībai, iegūstot savienojumu ar formulu (I), kuru izdala cietas vielas veidā.

2. Savienojuma ar formulu (I) sintēzes paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju raksturīgs ar to, ka savienojums ar formulu (III) ir N-vinilftalimīds.

3. Savienojuma ar formulu (I) sintēzes paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju raksturīgs ar to, ka savienojums ar formulu (III) ir akrilamīds.

4. Savienojuma ar formulu (I) sintēzes paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju raksturīgs ar to, ka savienojuma ar formulu (III) kondensāciju, lai iegūtu savienojumu ar formulu (IV), veic, izmantojot pallādija tetrakis(trifenilfosfīnu).

5. Savienojums ar formulu (IV) saskaņā ar 1. pretenziju, kuru izmanto kā starpproduktu agomelatīna sintēzē.

6. Savienojuma ar formulu (IV) saskaņā ar 5. pretenziju izmantošana agomelatīna sintēzē.

7. Savienojuma ar formulu (II) saskaņā ar 1. pretenziju izmantošana agomelatīna sintēzē.

8. Savienojuma ar formulu (V) saskaņā ar 1. pretenziju izmantošana agomelatīna sintēzē ar nosacījumu, ka šī izmantošana neattiecas uz savienojumu 2-[2-(7-metoksi-1-naftil)etil]-1H-izoindol-1,3(2H)-dions.

9. Agomelatīna sintēzes paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju, sākot ar savienojumu ar formulu (IV), raksturīgs ar to, ka savienojumu ar formulu (IV) iegūst pēc sintēzes paņēmiena saskaņā ar vienu no 1. līdz 4. pretenzijai.

10. Agomelatīna sintēzes paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju, sākot ar savienojumu ar formulu (V), raksturīgs ar to, ka savienojumu ar formulu (V) iegūst pēc sintēzes paņēmiena saskaņā ar vienu no 1. līdz 4. pretenzijai.

11. Agomelatīna sintēzes paņēmieni saskaņā ar 1. pretenziju, sākot ar savienojumu ar formulu (VI), raksturīgs ar to, ka savienojumu ar formulu (VI) iegūst pēc sintēzes paņēmiena saskaņā ar vienu no 1. līdz 4. pretenzijai.

- (51) **B01D 33/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2152380**
B01D 33/044⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
B01D 33/048⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
B01D 33/073⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 08734549.2 (22) 25.04.2008
(43) 17.02.2010
(45) 13.06.2012
(31) 07106918 (32) 25.04.2007 (33) EP
(86) PCT/DK2008/050094 25.04.2008
(87) WO2008/131780 06.11.2008
(73) Danmarks Tekniske Universitet (DTU), Anker Engelsevej 1, Bygning 101A, 2800 Lyngby, DK
(72) STUBBE, Peter, DK
HANSEN, Preben Bøje, DK
(74) Høiberg, Susanne, Høiberg A/S, St. Kongensgade 59 A, 1264 Copenhagen K, DK
Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra KDK, a/k 185, Rīga LV-1084, LV
(54) **FILTRĒŠANAS METODE UN APARĀTS, KURŠ IETVER VELTNI AR PORĀM**
A FILTRATION METHOD AND APPARATUS INCLUDING A ROLLER WITH PORES

(57) 1. Metode sausas vielas separēšanai no vides, pie kam metode satur sekojošus soļus:

- separēšanas kameras nodrošināšanu, kuru, skatoties šķērs-griezumā, veido daudzi veltni, pie kam: minētajā kamerā var regulēt spiedienu; vismaz viens no minētajiem veltniem ir porains veltnis, kura virsmā ir poras, kas attiecībā pret filtrēšanas vidi ir caurlaidīgas, turklāt veltnī ir vismaz viens kanāls filtrāta virzīšanai uz filtrāta izeju, pie tam minētais kanāls ir fluidālā kontaktā ar virsmas porām;

- vismaz viena filtrēšanas līdzekļa montāžu tā, lai filtrēšanas nogulas virzītu vismaz starp vienu veltnu komplektu, kurš sastāv no poraina veltna un otra veltna;

- spiediena diferences radīšanu šķērseniski vismaz vienam filtrēšanas līdzeklim;

- vismaz viena filtrēšanas līdzekļa kontaktēšanu ar sausas vielas suspensiju un vidi, kura uz vismaz viena filtrēšanas līdzekļa akumulē sausu vielu;

- filtrēšanas nogulu iegūšanu uz minētā filtrēšanas līdzekļa;

- vismaz viena filtrēšanas līdzekļa un filtrēšanas nogulu izlaišanu caur minēto vismaz vienu veltnu komplektu, kā rezultātā vide tiek atdalīta no filtrēšanas nogulām, pie tam

- metode eventuāli satur arī filtrēšanas nogulu izvadīšanas soli no aparāta.

2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam filtrēšanas līdzeklis ir integrēts porainā veltna virsmā.

3. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam filtrēšanas līdzeklis ir filtrēšanas lente.

4. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam filtrēšanas līdzeklis ir filtrs, kas piestiprināts pie porainā veltna.

5. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam suspensija ir izvietota separēšanas kamerā un separēšanas laikā vide tiek transportēta iekšup porainā veltna porās.

6. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam suspensija ir izvietota porainajā veltnī, un vide tiek ievadīta separēšanas kamerā atdalīšanas laikā.

7. Metode saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, kura satur papildu soli, kurā vismaz viens filtrs otrreizēji tiek kontaktēts ar suspensiju.

8. Metode saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, pie kam filtrēšanas lente sedz vismaz daļu no porainā veltna virsmas; vislabāk ir, ka filtrēšanas lente aptver porainā veltna virsmu.

9. Metode saskaņā ar jebkuru iepriekšējo pretenziju, pie kam vismaz viens filtrs pārvietojas ar ātrumu, kurš ir robežās no 0,2 līdz 100 km/h, labāk – no 0,6 līdz 50 km/h, vēl labāk – no 0,8 līdz 20 km/h, vēl labāk – no 1 līdz 10 km/h, bet vislabāk – no 1,5 līdz 5 km/h.

10. Aparāts sausas vielas separēšanas no vides, kurš satur:
 - separēšanas kameru, kuru, skatoties šķērsgriezumā, veido daudzi veltni, pie kam: minētajā kamerā var regulēt spiedienu; vismaz viens no minētajiem veltniem ir porains veltnis, kura virsmā ir poras, kas attiecībā pret filtrēšanas vidi ir caurlaidīgas, pie kam minētajā veltnī ir vismaz viens kanāls filtrāta virzīšanai uz filtrāta izeju, un minētais kanāls ir fluidālā kontaktā ar virsmas porām,

- vismaz vienu filtrēšanas līdzekli, kurš ir uzmontēts tā, ka tas virzās vismaz starp veltnu komplektu, kurš sastāv no poraina veltna un otra veltna;

- līdzekļus spiediena diferences radīšanai šķērseniski vismaz vienam filtrēšanas līdzeklim;

- līdzekļus vismaz viena filtrēšanas līdzekļa kontaktēšanai ar sausas vielas suspensiju un vidi;

- līdzekļus vismaz viena filtrēšanas līdzekļa un filtrēšanas nogulu izlaišanai caur vismaz vienu veltnu komplektu, kā arī
 - eventuāli satur līdzekļus filtrēšanas nogulu izvadīšanai.

11. Aparāts saskaņā ar 10. pretenziju, pie kam filtrēšanas līdzeklis ir filtrēšanas lente.

12. Aparāts saskaņā ar 10. pretenziju, pie kam filtrēšanas lente sedz vismaz daļu no porainā veltna virsmas, labāk ir, ka filtrēšanas lente aptver porainā veltna virsmu.

13. Aparāts saskaņā ar jebkuru no 10. līdz 12. pretenzijai, pie kam filtra ūdenscaurlaidība ir vismaz 20 000 l/h/bar/m², vēlams – vismaz 30 000 l/h/bar/m², labāk – vismaz 40 000 l/h/bar/m², vēl labāk – vismaz 50 000 l/h/bar/m², vēl labāk – vismaz 60 000 l/h/bar/m², vēl labāk – vismaz 70 000 l/h/bar/m², vēl labāk – vismaz 80 000 l/h/bar/m², vēl labāk – vismaz 90 000 l/h/bar/m², bet vislabāk – vismaz 100 000 l/h/bar/m².

14. Aparāts saskaņā ar jebkuru no 11. līdz 13. pretenzijai, pie kam filtrēšanas lente satur katalizatoru.

15. Metodes, kas definēta no 1. līdz 9. pretenzijai, un/vai aparāta, kas definēts no 10. līdz 14. pretenzijai, izmantošana sausas vielas separēšanai no vides.

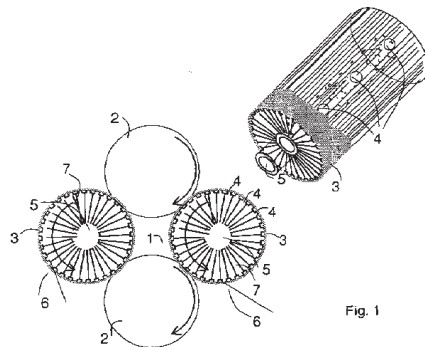


Fig. 1

RESTRAINT SYSTEM FOR SECURING A USER ON A WATERCRAFT, AND WATERCRAFT HAVING A RESTRAINT SYSTEM

(57) 1. Noturēšanas sistēma lietotāja (10) drošībai uz peldlīdzekļa (12), uz kura lietotājs (10) vismaz daļēji atrodas guļus, kas raksturīga ar to, ka tā sastāv no jostas siksnas (14), kas apjōz lietotāja (10) ķermeni (16), divām cirkšņu siksnām (22a, 22b), kas ir izvietotas no vienas puses lietotāja (10) vēdera apvidū (18) un no otras puses lietotāja (10) mugurpusē (20), pie tam katru no tām var izvilkēt caur lietotāja (10) cirkšņa (24) zonu,

kas raksturīga ar to, ka savienojošās siksnas (26) viens gals (28) satver jostas siksnu (14) lietotāja (10) vēdera apvidū (18), bet tās otrs gals (30) ir piestiprināts peldlīdzeklim (12) ar iespēju to palaist vajā.

2. Noturēšanas sistēma saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka lietotāja (10) vēdera apvidū (18) atrodas sastiprināšanas elements (32), ar kuru ir sakabināma savienojošā siksnas (26).

3. Noturēšanas sistēma saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka savienojošā siksnas (16) stiepijas vertikāli no jostas siksnas lietotāja (10) krūšu (34) virzienā (B).

4. Noturēšanas sistēma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka peldlīdzeklim (12) piestiprinātajā savienojošās siksnas (26) galā (30) atrodas stiprinājums (36), pie kura ir piestiprināma cilpa, skrūve, drošības āķis, nospiežamā sprādze vai cits līdzīgs drošības elements, kas ir paredzēts drošai piestiprināšanai peldlīdzeklim (12) savienojuma punktā (38).

5. Noturēšanas sistēma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka abas cirkšņu siksnas (22a, 22b) ir savienotas viena ar otru lietotāja (10) cirkšņa (24) zonā savās arējās pusēs (40a, 40b), kas vērstas prom no lietotāja (10).

6. Noturēšanas sistēma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka jostas siksnas (14) ir regulējama pēc garuma.

7. Noturēšanas sistēma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka cirkšņu siksnas (22a, 22b) ir regulējamas pēc garuma.

8. Noturēšanas sistēma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka savienojošā siksnas (26) ir regulējama pēc garuma.

9. Peldlīdzeklis (12) ar transportlīdzekļa korpusu (42), uz kura lietotājs (10) vismaz daļēji atrodas guļus, kas raksturīgs ar noturēšanas sistēmu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai.

10. Peldlīdzeklis (12) saskaņā ar 9. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka transportlīdzekļa korpusa virspusē atrodas virsma (44), uz kuras lietotājs (10) var apgulties.

11. Peldlīdzeklis (12) saskaņā ar 9. vai 10. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka savienojošā siksnas (26) apgulšanās virsmas (44) zonā satur savienojuma vietu (38) ar transportlīdzekļa korpusu (42).

12. Peldlīdzeklis (12) saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 11. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka savienojošā siksnas (26) tajā zonā, kur šī siksnas lietotāja (10) pēdu (46) virzienā (F) piekļaujas apgulšanās virsmai (44), satur savienojuma vietu (38) ar transportlīdzekļa korpusu (42).

13. Peldlīdzeklis (12) saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 12. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka savienojošās siksnas (26) savienojuma vieta (38) ar transportlīdzekļa korpusu (42) atrodas peldlīdzekļa (12) diametrālā plaknē (M).

14. Peldlīdzeklis (12) saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 13. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka savienojošās siksnas (26) savienojuma vieta (38) ar transportlīdzekļa korpusu (42) atrodas peldlīdzekļa smaguma centra (S) apvidū.

15. Peldlīdzeklis (12) saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 14. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka savienojošā siksnas (26) ir izvietota uz transportlīdzekļa korpusa (42) ar iespēju griezties ap asi (A), kas galvenokārt stiepijas vertikāli attiecībā pret transportlīdzekļa korpusu (42).

16. Peldlīdzeklis (12), saskaņā ar jebkuru no 9. līdz 15. pretenzijai, kas raksturīgs ar to, ka starp savienojamo siksnu (26) un transportlīdzekļa korpusu (42) ir aprīkots ar viegli atveramu slēdzi vai ātras darbības slēdzi.

- (51) **A62B 35/00**(200601) (11) **2175943**
- (21) 08784679.6 (22) 09.07.2008
- (43) 21.04.2010
- (45) 29.02.2012
- (31) 102007032392 (32) 12.07.2007 (33) DE
- (86) PCT/EP2008/005596 09.07.2008
- (87) WO2009/007102 15.01.2009
- (73) Cayago AG, Forchstrasse 452, 8702 Zollikon, CH
- (72) WALPURGIS, Peter, DE
- (74) Fleck, Hermann-Josef, Klingengasse 2, 71665 Vaihingen/Enz, DE
- Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV
- (54) **NOTURĒŠANAS SISTĒMA LIETOTĀJA DROŠĪBAI UZ PELDLĪZDEKĻA UN PELDLĪZDEKLIS AR NOTURĒŠANAS SISTĒMU**

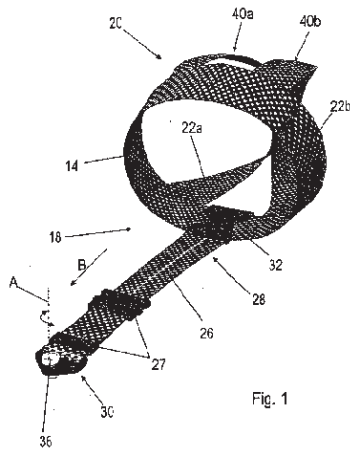
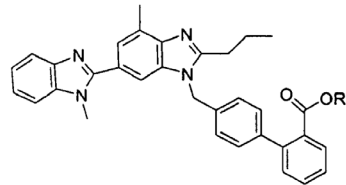


Fig. 1



(VIII)

kur R ir metilgrupa vai etilgrupa, ar kālija hidroksīdu spirtā ar formulu R²OH, kur R² ir etilgrupa vai metilgrupa.

3. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka telmisartāna kālija sāls tiek iegūts, telmisartānu ar formulu (I) neutralizējot ar kālija hidroksīdu.

4. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka iegūtā karbonskābes R¹COOH kālija sāls saturs, kas izteikts kā sāls/telmisartāna masas attiecība, kristalizācijas laikā ir 20 % - 150 %.

5. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka kā karbonskābe tiek izmantota etiķskābe vai skudrskābe.

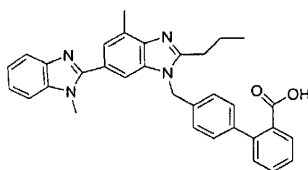
6. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka ūdens saturs sistēmā ir mazāks par 1 %.

7. Telmisartāna (I) kristāliskās formas A ražošanas metode, kas raksturīga ar to, ka telmisartāna esteris (VIII) metanolā ar ūdens saturu mazāku par 1 masas % tiek karsēts kopā ar kālija hidroksīdu līdz viršanas temperatūrai 12 līdz 48 stundas, šķīdumam tiek pievienota skudrskābe vai etiķskābe un pēc atdzesēšanas tiek izdalīts kristālais A formas produkts.

8. Metode saskaņā ar 7. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka A formas telmisartāns tiek kristalizēts temperatūrā no -10 līdz +10°C.

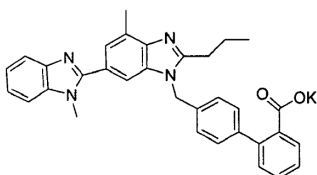
9. Metode saskaņā ar 7. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka telmisartāna, kālija hidroksīda un skudrskābes vai etiķskābes attiecības tiek izvēlētas tādas, lai rezultātā dotu izvēlētas organiskās skābes kālija sāls masas attiecību pret rezultātā iegūto telmisartānu no 1 : 2 līdz 6 : 5.

- (51) **C07D 235/18**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2176235**
 (21) 08773249.1 (22) 08.07.2008
 (43) 21.04.2010
 (45) 18.04.2012
 (31) 20070457 (32) 09.07.2007 (33) CZ
 (86) PCT/CZ2008/000080 08.07.2008
 (87) WO2009/006860 15.01.2009
 (73) Zentiva, k.s., U kabelovny 130, Dolni Mecholupy 102 37, Praha 10, CZ
 (72) STACH, Jan, CZ
 RADL, Stanislav, CZ
 CINIBULK, Josef, CZ
 STRELEC, Ivo, CZ
 JARRAH, Kamal, CZ
 (74) Jirotkova, Ivana, et al, Rott, Ruzicka & Guttmann Patent, Trademark and Law Office, Vinohradská 37, 120 00 Praha 2, CZ
 Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV
 (54) **4'-[[4-METIL-6-(1-METIL-1H-BENZIMIDAZOL-2-IL)-2-PROPIL-1H-BENZIMIDAZOL-1-IL]METIL]-DIFENIL-2-KARBONSKĀBES (TELMISARTĀNA) RAŽOŠANAS METODE**
A METHOD OF MANUFACTURING 4'-[[4-METHYL-6-(1-METHYL-1H-BENZIMIDAZOL-2-YL)-2-PROPYL-1H-BENZIMIDAZOL-1YL]METHYL]BIPHENYL-2-CARBOXYLIC ACID (TELMISARTAN)
 (57) 1. Telmisartāna (I)



(I)

kristāliskās formas A ražošanas metode, raksturīga ar to, ka telmisartāna kālija sāls (VII)



(VII)

šķīdumam spirtā ar formulu R²OH ar ūdens saturu mazāku par 2 %, kur R² ir etilgrupa vai metilgrupa, tiek pievienota karbonskābe ar vispārīgo formulu R¹COOH, kur R¹ ir ūdeņraža atoms vai C₁₋₄ alkilgrupa.

2. Metode saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka telmisartāna kālija sāls tiek iegūts, hidrolizējot telmisartāna alkiles-teri ar vispārīgo formulu (VIII)

- (51) **C08F 26/10**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2178931**
A61F 2/16⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 08826490.8 (22) 16.07.2008
 (43) 28.04.2010
 (45) 04.04.2012
 (31) 950782 P (32) 19.07.2007 (33) US
 (86) PCT/US2008/070176 16.07.2008
 (87) WO2009/012308 22.01.2009
 (73) Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH
 (72) FREEMAN, Charles, US
 (74) Kalhammer, Georg, Lederer & Keller Patentanwälte, Unsöldstrasse 2, 80538 München, DE
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV

(54) **AUGSTAS JONU UN METABOLĪTU PLŪSMAS LĒCAS UN MATERIĀLI**
HIGH ION AND METABOLITE FLUX LENSES AND MATERIALS

(57) 1. Fakiskās mugurējās kameras intraokulārās lēcas, kas satur hidroģelu kā lēcu materiālu, to skaitā N-vinilpirolidona un 2-feniletilmetakrilāta kopolimēru, kas ir šķērssašūts ar šķērssaites veidojošu līdzekli, pie tam polimerizācijas produktam līdzsvara ūdens saturs ir mazāks par 55 % (mas.), refraktīvais indekss ir lielāks par 1,41 un kopējā nātrija un hlorīda jonu plūsma ir lielāka par 16 μekv-mm/h/cm².

2. Fakiskās mugurējās kameras intraokulārās lēcas saskaņā ar 1. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka jonu plūsma ir no 16 līdz 20 μekv-mm/h/cm².

3. Fakiskās mugurējās kameras intraokulārās lēcas saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka līdzsvara ūdens saturs ir intervālā no 50 līdz 55 % (mas.).

4. Fakiskās mugurējās kameras intraokulārās lēcas saskaņā ar 1., 2. vai 3. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka intraokulārās lēcas ir salokāmas, lai ievadītu tās lēcu inžektorā.

5. Fakiskās mugurējās kameras intraokulārās lēcas saskaņā ar 1., 2., 3. vai 4. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka intraokulārās

fakiskās lēcas ir pietiekami stingas, lai paliktu implantētā pozīcijā.

6. Fakiskās mugurējās kameras intraokulārās lēcas saskaņā ar 1., 2., 3., 4. vai 5. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka polimerizācijas produkts satur 70 % (mas.) N-vinilpirolidona un 29 % (mas.) 2-feniletimetakrilāta.

7. Fakiskās mugurējās kameras intraokulārās lēcas saskaņā ar 6. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka šķērssaites veidojošais līdzeklis satur 0,2 līdz 1,0 % (mas.) alilmetakrilāta.

8. Fakiskās mugurējās kameras intraokulārās lēcas saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver polimerizācijas produktu, kas satur no 68 līdz 71 % (mas.) N-vinilpirolidona un no 28 līdz 30 % (mas.) 2-feniletimetakrilāta.

9. Fakiskās mugurējās kameras intraokulārās lēcas saskaņā ar 8. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka līdzsvara ūdens saturs ir 52 % (mas.).

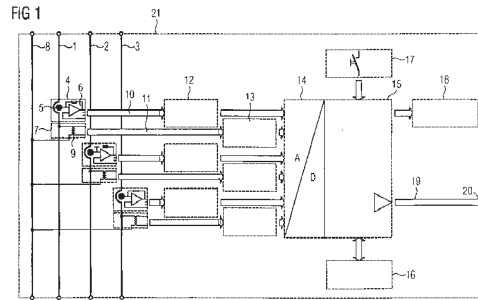
10. Fakiskās mugurējās kameras intraokulārās lēcas saskaņā ar 8. vai 9. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka nātrija jonu plūsma ir intervālā no 16 līdz 20 $\mu\text{ekv}\cdot\text{mm}/\text{h}\cdot\text{cm}^2$.

11. Fakiskās mugurējās kameras intraokulārās lēcas saskaņā ar 8., 9. vai 10. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka šķērssaites veidojošais līdzeklis satur no 0,2 līdz 1,0 % (mas.) alilmetakrilāta.

12. Fakiskās mugurējās kameras intraokulārās lēcas saskaņā ar 8., 9., 10. vai 11. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka intraokulārās lēcas no polimēru kompozīcijas ir salokāmās, lai tās ievadītu lēcu inžektorā.

13. Fakiskās mugurējās kameras intraokulārās lēcas saskaņā ar 8., 9., 10., 11. vai 12. pretenziju, kas atšķiras ar to, ka intraokulārās fakiskās lēcas no polimēru kompozīcijas ir pietiekami stingas, lai paliktu implantētā pozīcijā.

14. Fakiskās mugurējās kameras intraokulārās lēcas saskaņā ar 8., 9., 10., 11., 12. vai 13. pretenziju, kas papildus ietver ultravioleto staru absorbētāju.



- (51) **B61L 1/20**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2181907**
B61L 5/06⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 09171617.5 (22) 29.09.2009
 (43) 05.05.2010
 (45) 18.04.2012
 (31) 102008055651 (32) 29.10.2008 (33) DE
 (73) SIEMENS AKTIENGESELLSCHAFT, Wittelsbacherplatz 2, 80333 München, DE
 (72) BOLLRATH, Bernhard, DE
 BURGASS, Stefan, DE
 WALTER, Harald, DE
 (74) Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
 (54) **PĀRMIJU DIAGNOZES SISTĒMA**
POINTS DIAGNOSIS SYSTEM

(57) 1. Pārmiņu diagnostikas sistēma ar izmērīto vērtību iegūšanas ierīci, kura ir savienota ar pārmiņu piedziņas kabeli un ir izveidota, lai iegūtu elektrisko mērījumu mainīgos lielumus, pie kam katras pārmiņas piedziņas kabelī ir ieslēgts mērīšanas modulis (21), kurš ietver līdzekļus izmērīto vērtību iegūšanai, novērtēšanai un indicēšanai, kā arī saskarnes līdzekļus (20) perifērijas ierīču, it īpaši datu savākšanas datora (26), attālas vadības ierīces un programmatūras aktualizēšanas ierīces pieslēgšanai,

kas raksturīga ar to, ka: mērīšanas moduļim (21) katrā piedziņas kabeļa vadā (1, 2, 3) ir strāvas mērīšanas ierīce (4) ar Halla sensoru (5); starp katru vadu (1, 2, 3) un nullvadu (8) ir sprieguma mērīšanas ierīce ar potenciālus izolējošu pārveidotāju (9); pirms maiņstrāvas/līdzstrāva (A/D) pārveidotāja (14) ir ieslēgta mērīšanas kanāla pielāgošanas ierīce (12, 13) katram strāvas mērīšanas kanālam (10) un katram sprieguma mērīšanas kanālam (11) katrā vadā (1, 2, 3), pie kam sistēma ir aprīkota ar kontrolleri (15), kas ietver A/D pārveidotāju (14) un atmiņas ierīci (16), saskarnes līdzekļiem (20) un indikācijas un vadības elementiem (17, 18).

- (51) **C01B 25/22**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2186774**
C01B 25/222⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C01B 25/223⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C01B 25/234⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C01B 25/237⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C01F 11/46⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C01D 3/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 09173249.5 (22) 16.10.2009
 (43) 19.05.2010
 (45) 21.03.2012
 (31) 200800572 (32) 16.10.2008 (33) BE
 PCT/EP2008/063969 16.10.2008 WO
 (73) Ecophos S.A., Monnet Centre International Laboratory, Avenue Monnet 1, 1348 Louvain-la-Neuve, BE
 (72) TAKHIM, Mohamed, BE
 (74) Pecher, Nicolas, et al, Pecher Consultants SPRL, Centre Monnet - Avenue Jean Monnet, 1, 1348 Louvain-la-Neuve, BE
 Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV

(54) **PAŅĒMIENS AUGSTAS TĪRĪBAS PAKĀPES FOSFORSKĀBES IEGŪŠANAI**
PROCESS FOR THE PRODUCTION OF HIGH PURITY PHOSPHORIC ACID

(57) 1. Paņēmiens augstas tīrības pakāpes fosforskābes iegūšanai, kurā ietilpst šādas stadijas:

- (a) pirmā fosfāta sāls pakļaušana iedarbībai ar pirmo stipro skābi, lai veidotu suspensiju, kas sastāv no pirmās fosforskābes šķīdumā un pirmās cietās fāzes;
- (b) pirmās fosforskābes atdalīšana no pirmās cietās fāzes;
- (c) bāziska savienojuma pievienošana pirmajai fosforskābei, lai veidotu jaunu suspensiju, kas sastāv no otrā fosfāta sāls šķīdumā un otrās cietās fāzes, kas satur piesārņojumus;
- (d) otrā fosfāta sāls atdalīšana no otrās cietās fāzes;
- (e) otrā fosfāta sāls pakļaušana otrajai iedarbībai ar otro, koncentrēto, stipro skābi, lai veidotu otro fosforskābi un sāli;
- (f) otrās fosforskābes atdalīšana no sāls;
- (g) otrās fosforskābes ekstrahēšana ar organisku šķīdinātāju, lai veidotu organisku ekstrakcijas fāzi, kas satur fosforskābi, un ūdens ekstrakcijas fāzi, kas satur piesārņojumus;
- (h) minētās organiskās ekstrakcijas fāzes reekstrahēšana ar ūdens reekstrācijas līdzekli, lai veidotu ūdens reekstrācijas fāzi un organisku fāzi, nabadzīgu ar fosforskābi;
- (i) ūdens reekstrācijas fāzes, kas ir trešā fosforskābe un organiskā fāze, atdalīšana; un
- (j) jonu apmaiņas izmantošana trešajā fosforskābē, lai iegūtu augstas tīrības pakāpes fosforskābi.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tas papildus ietver pirms stadijas (a), kurā pirmo fosfāta sāli pakļauj iedarbībai ar pirmo stipro skābi, šādas stadijas:

- fosfāta ieža pakļaušanu iedarbībai ar sālskābes šķīdumu, lai veidotu suspensiju, kas sastāv no ūdens fāzes, kas satur šķīdumā fosfāta jonus, hlorīda jonus un kalcija jonus, un nešķīstošas cietas fāzes, kas satur piesārņojumus;
- ūdens fāzes, kas satur šķīdumā fosfāta jonus, hlorīda jonus un kalcija jonus, un nešķīstošās cietās fāzes atdalīšanu;
- ūdens fāzes pakļaušanu neitralizēšanai, pievienojot kalcija savienojumu, lai veidotu kalcija fosfātu no fosfāta joniem, minētais kalcija fosfāts ir ūdenī nešķīstošs;

- kalcija fosfāta, kas var tikt izmantots šajā paņēmienā kā pirmais fosfāta sāls, un ūdens fāzes, kas satur šķīdumā kalcija jonus un hlorīda jonus, atdalīšanu.

3. Paņēmieni saskaņā ar 2. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka tas papildus ietver minētās suspensijas iepriekšējās neitralizēšanas veidošanas stadiju līdz pH lielumam, kas ir zemāks par pH lielumu, pie kura kalcija fosfāta nozīmīga daļa nogulsnejas.

4. Paņēmieni saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka pirmais fosfāta sāls ir kalcija monohidrogēnfosfāts (DCP).

5. Paņēmieni saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka pirmā stiprā skābe ir sērskābe un pirmā cietā fāze ir ģipsis.

6. Paņēmieni saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka pirmās stiprās skābes un pirmā fosfāta sāls molārā attiecība ir starp 0,6 un 1,6.

7. Paņēmieni saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka bāziskais savienojums ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no nātrija karbonāta, nātrija hidroksīda, kālija karbonāta, kālija hidroksīda, amonjaka, amonija hidroksīda un šo savienojumu maisījumiem.

8. Paņēmieni saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka bāziskais savienojums tiek pievienots pirmajai fosforskābei, lai iegūtu pH starp 6,0 un 10,0.

9. Paņēmieni saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka otrais fosfāta sāls ir dinātrija fosfāts.

10. Paņēmieni saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka tajā turpmāk ietilpst:

- otrā fosfāta sāls kristalizācijas iegūšana, lai veidotu cietu fosfāta sāli un šķidru fāzi, kas satur piesārņojumus;
- otrā fosfāta sāls, kas vienreiz tika kristalizēts, atdalīšana no šķidrās fāzes.

11. Paņēmieni saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka otrā stiprā skābe ir sālskābe.

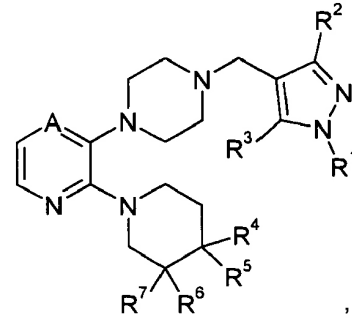
12. Paņēmieni saskaņā ar 11. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka hlorīda un nātrija molārā attiecība ir starp 0,8 un 1,5.

13. Paņēmieni saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka sāls ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no nātrija hlorīda, kālija hlorīda, amonija hlorīda un to maisījumiem.

14. Paņēmieni saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka jonu apmaiņas reakcija tiek veikta ar katjonu apmaiņas sveķiem.

15. Paņēmieni saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīgs ar to, ka jebkurš šķidrās efluents un fosfāta jonus saturošas cietas nogulsnes var tikt atkārtoti izlietotas minētajā paņēmienā.

(57) 1. Savienojums ar formulu:



kur:

- A ir -C(H)=grupa vai -N=grupa,
- R¹ ir aizvietotājs, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no: i) ūdeņraža atoma, ii) metilgrupas, iii) etilgrupas, iv) hidroksimetilgrupas, v) hidroksietilgrupas, vi) fenilgrupas, kas iespējams aizvietota ar 1 līdz 3 fluora atomiem, vii) benzilgrupas, kas iespējams aizvietota ar 1 līdz 3 fluora atomiem, un viii) piridilgrupas;
- R² ir ūdeņraža atoms, metilgrupa vai etilgrupa;
- R³ ir ūdeņraža atoms, metilgrupa vai hlora atoms;
- R⁴ ir izvēlēta no grupas, kas sastāv no: i) ūdeņraža atoma, ii) fluora atoma, iii) metilgrupas, iv) hidroksilgrupas, v) hidroksimetilgrupas, vi) hidroksietilgrupas, vii) metoksimetilgrupas, viii) cianmetilgrupas un ix) metilsulfonilaminometilgrupas;
- R⁵ ir ūdeņraža atoms;
- R⁶ un R⁷ ir vienādas un izvēlētas no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, metilgrupas un fluora atoma, ar nosacījumu, ka ja R⁶ un R⁷ nav ūdeņraža atomi, tad abas R⁴ un R⁵ ir ūdeņraža atomi; vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur R¹ ir metilgrupa, etilgrupa vai fenilgrupa, kas iespējams aizvietota ar 1 līdz 2 fluora atomiem.

3. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju, kur R⁴ ir hidroksilgrupa, hidroksimetilgrupa vai metoksimetilgrupa.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir 3'-[4-(1-etil-5-metil-1H-pirazol-4-ilmetil)-piperazin-1-il]-3,4,5,6-tetrahydro-2H-[1,2']bipiridinil-4-ols vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

5. Savienojums, kurš ir 3'-(4,4-difluor-piperidin-1-il)-4-(1,5-dimetil-1H-pirazol-4-ilmetil)-3,4,5,6-tetrahydro-2H-[1,2']bipirazinil-hidrohlorīds.

6. Farmaceutiska kompozīcija, kas par aktīvu ingredientu satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai kopā ar farmaceutiski pieņemamu nesēju, atšķaidītāju vai pildvielu.

7. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kuru izmanto ārstēšanas terapijā.

8. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kuru izmanto migrēnas ārstēšanā cilvēkiem.

9. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kuru izmanto migrēnas profilaktiskajā ārstēšanā cilvēkiem.

10. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai izmantošana medikamenta ražošanā migrēnas ārstēšanai.

11. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai izmantošana medikamenta ražošanā migrēnas profilaktiskajai ārstēšanai.

(51) C07D 401/14 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾	(11) 2201002
C07D 403/12 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾	
A61K 31/497 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾	
A61P 25/00 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾	
(21) 08836911.1	(22) 30.09.2008
(43) 30.06.2010	
(45) 07.03.2012	
(31) 979464 P	(32) 12.10.2007 (33) US
(86) PCT/US2008/078294	30.09.2008
(87) WO2009/048765	16.04.2009
(73) ELI LILLY AND COMPANY, Lilly Corporate Center, Indianapolis, IN 46285, US	
(72) BADESCU, Valentina, O., US FILLA, Sandra, Ann, US GALLAGHER, Peter, Thaddeus, GB WHATTON, Maria, Ann, GB	
(74) Bassinder, Emma Marie, Eli Lilly and Company Limited, European Patent Operations, Lilly Research Centre, Erl Wood Manor, Sunninghill Road, Windlesham, Surrey GU20 6PH, GB Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV	
(54) 5-HT7 RECEPTORA ANTAGONISTI 5-HT7 RECEPTOR ANTAGONISTS	

(51) H04L 1/00 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾	(11) 2222007
H04L 27/26 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾	
(21) 09161848.8	(22) 03.06.2009
(43) 25.08.2010	
(45) 30.05.2012	
(31) 153310 P	(32) 18.02.2009 (33) US
(73) LG Electronics Inc., 20, Yeouido-dong Yeongdeungpo-gu, Seoul 150-721, KR	
(72) KO, Woo Suk, KR MOON, Sang Chul, KR	
(74) Cabinet Plasseraud, 52, rue de la Victoire, 75440 Paris Cedex 09, FR Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV	

(54) **IERĪCE UN PAŅĒMIENS RAIDOŠĀ SIGNĀLA PĀRRAI-
DEI UN UZTVĒŠANAI
APPARATUS AND METHOD FOR TRANSMITTING AND
RECEIVING A BROADCAST SIGNAL**

(57) 1. Raidītājs datu pārraidei uz uztvērēju, pie kam raidītājs ietver: FEC (tiešas kļūdu labošanas) kodētāju (702-L1), kas ir konfigurēts 1. slāņa signalizācijas datu kodēšanai ar tiešu kļūdu labošanu; bitu blīvētāju (703-L1), kas ir konfigurēts 1. slāņa ar tiešu kļūdu labošanu kodēto signalizācijas datu bitu blīvēšanai; QAM attēlošanas ierīci (704-L1), kas ir konfigurēta 1. slāņa signalizācijas datu ar sablīvētiem bitiem demultiplexēšanai šūnu vārdos un šūnu vārdu attēlošanai konstelāciju vērtības atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem; laika blīvētāju (1908-L1), kas ir konfigurēts attēloto konstelāciju vērtību laika blīvēšanai atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem, balstoties uz atmiņu saskaņā ar 1. slāņa TI (laika blīvēšanas) režīma informāciju, kas norāda laika blīvēšanas dziļumu, pie tam vairāku atmiņas rindu skaits ir vienāds ar laika blīvēšanas dziļumu, bet vairāku atmiņas kolonnu skaits ir vienāds ar koeficientu, kurš rodas, daļot vairākas konstelācijas vērtības, kas nepieciešamas, lai pārraidītu L1 signalizācijas datus ar laika blīvēšanas dziļumu, kurš ir vienāds ar vai lielāks par OFDM simbolu minimālo skaitu, kas ir nepieciešams, lai pārsūtītu L1 signalizācijas datus; ievietotāju (1905-L1), kas ir konfigurēts 1. slāņa iesākuma ievietošanai sablīvētā laika konstelācijas vērtībās atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem, pie tam 1. slāņa iesākums ietver informāciju par L1 TI režīmu; atkārtēšanas ierīci (1915-L1), kas ir konfigurēta konstelācijas vērtību atkārtēšanai atbilstoši 1. slāņa signalizācijas un iesākuma datiem; frekvenču blīvētāju (709-L1), kas ir konfigurēts konstelācijas vērtību frekvenču blīvēšanai atbilstoši 1. slāņa signalizācijas un iesākuma datiem; ierīci (711) signālu kadra veidošanai, kas satur preambulas simbolus, kas balstās uz konstelācijas vērtībām ar sablīvētām frekvencēm, pie kam preambulas simboli ir sadalīti 1. slāņa blokos un katrā 1. slāņa blokā ir 3408 apakšnesēji.

2. Raidītājs saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam FEC kodētājs ietver: BCH kodētāju, kas ir konfigurēts 1. slāņa signalizācijas datu kodēšanai ar BCH koda palīdzību; LDPC kodētāju, kas ir konfigurēts 1. slāņa ar BCH koda palīdzību kodēto signalizācijas datu kodēšanai, lai ģenerētu vismaz vienu LDPC paritātes bitu; punktēšanas ierīci, kas ir konfigurēta punktēšanas veikšanai ģenerētajam LDPC paritātes bitam.

3. Raidītājs saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam bitu blīvētājs ir papildus konfigurēts 1. slāņa ar FEC kodu kodēto signalizācijas datu blīvēšanai, kuriem ir veikta punktēšana.

4. Raidītājs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, pie kam laika blīvētājs ir konfigurēts tā, lai tas neveiktu laika blīvēšanas procesu attēlotajām konstelācijas vērtībām atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem gadījumā, kad informācija par L1 TI režīmu nenorāda uz laika blīvēšanas režīmu.

5. Raidītājs saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, pie kam gadījumā, kad informācija par L1 TI režīmu vērtība ir "01", laika blīvēšanas dziļums ir OFDM simbolu minimālais skaits, kas nepieciešams L1 signalizācijas datu pārņemšanai.

6. Uztvērējs pārraides datu apstrādei, pie kam uztvērējs ietver: ierīci signālu kadra iegūšanai, kura satur preambulas simbolus, ieskaitot 1. slāņa signalizācijas datus un 1. slāņa iesākumu, pie kam preambulas simboli ir sadalīti 1. slāņa blokos un katrā 1. slāņa blokā ir 3408 apakšnesēji un 1. slāņa iesākums ietver informāciju par L1 TI, kas norāda laika blīvēšanas dziļumu; frekvenču atblīvētāju (r709-L1), kas ir konfigurēts konstelācijas vērtību frekvenču atblīvēšanai atbilstoši 1. slāņa signalizācijas un iesākuma datiem; ekstraktoru (r1917-L1, r1912-L1), kas ir konfigurēts konstelācijas vērtību ekstrahēšanai atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem no konstelācijas vērtībām ar atblīvētām frekvencēm atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem un 1. slāņa iesākuma datiem; laika atblīvētāju (r1910-L1), kas ir konfigurēts ekstrahēto konstelācijas vērtību laika atblīvēšanai atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem, kas balstās uz atmiņu saskaņā ar informāciju par L1 TI režīmu, pie kam vairāku atmiņas rindu skaits ir vienāds ar laika blīvēšanas dziļumu, bet vairāku atmiņas kolonnu skaits ir vienāds ar koeficientu, kurš rodas, daļot vairākas konstelācijas vērtības, kas nepieciešamas, lai pārraidītu L1 signalizācijas datus, ar laika blīvēšanas dziļumu, kurš ir vienāds ar vai lielāks par OFDM simbolu minimālo skaitu, kas ir nepieciešams, lai pārsūtītu L1 signalizācijas datus; QAM atjauno-

tāju (r713-L1), kas ir konfigurēts konstelācijas vērtību atjaunošanai atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem 1. slāņa signalizācijas datus; bitu atblīvētāju (r714-L1), kas ir konfigurēts 1. slāņa signalizācijas datu bitu atblīvēšanai; FEC dekoderi (r715-L1), kas ir konfigurēts 1. slāņa signalizācijas datu ar atblīvētiem bitiem dekodēšanai.

7. Uztvērējs saskaņā ar 6. pretenziju, pie kam FEC dekoders satur: atpunktēšanas ierīci, kas ir konfigurēta atpunktēšanas veikšanai vismaz vienam LDPC paritātes bitam; LDPC dekoderi, kas ir konfigurēts 1. slāņa signalizācijas datu un atpunktētā LDPC paritātes bita dekodēšanai ar LDPC-dekodera palīdzību; BCH dekoderi, kas ir konfigurēts 1. slāņa signalizācijas datu un ar LDPC dekoderi dekodētā paritātes bita dekodēšanai ar BCH koda palīdzību.

8. Uztvērējs saskaņā ar 6. vai 7. pretenziju, pie kam laika atblīvētājs ir konfigurēts tā, lai tas neveiktu laika atblīvēšanas procesu ekstrahētajām konstelācijas vērtībām atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem gadījumā, kad informācija par L1 TI režīmu nenorāda uz laika blīvēšanas režīmu.

9. Uztvērējs saskaņā ar jebkuru no 6. līdz 8. pretenzijai, pie kam gadījumā, kad informācija par L1 TI režīmu vērtība ir "01", laika blīvēšanas dziļums ir OFDM simbolu minimālais skaits, kas nepieciešams L1 signalizācijas datu pārņemšanai.

10. Paņēmiens pārraides datu uztveršanai, kas ietver: signālu kadra iegūšanu, kas satur preambulas simbolus, ieskaitot 1. slāņa signalizācijas datus un 1. slāņa iesākumu, pie kam preambulas simboli ir sadalīti 1. slāņa blokos un katrā 1. slāņa blokā ir 3408 apakšnesēji, un 1. slāņa iesākums ietver informāciju par L1 TI, kas norāda laika blīvēšanas dziļumu; frekvenču atblīvēšanu, kas ir konfigurēta konstelācijas vērtību frekvenču atblīvēšanai atbilstoši 1. slāņa signalizācijas un iesākuma datiem; konstelācijas vērtību ekstrahēšanu atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem no konstelācijas vērtībām ar atblīvētām frekvencēm atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem un 1. slāņa datiem; ekstrahēto konstelācijas vērtību laika atblīvēšanu atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem, kas balstās uz atmiņu saskaņā ar informāciju par L1 TI režīmu, pie kam vairāku atmiņas rindu skaits ir vienāds ar laika blīvēšanas dziļumu, bet vairāku atmiņas kolonnu skaits ir vienāds ar kvocientu, kurš rodas daļot vairākas konstelācijas vērtības, kas nepieciešamas, lai pārraidītu L1 signalizācijas datus, ar laika blīvēšanas dziļumu, kurš ir vienāds ar vai lielāks par OFDM simbolu minimālo skaitu, kas ir nepieciešams, lai pārsūtītu L1 signalizācijas datus; konstelācijas vērtību atjaunošanu atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem 1. slāņa signalizācijas datus; 1. slāņa signalizācijas datu bitu atblīvēšanu; 1. slāņa signalizācijas datu ar atblīvētiem bitiem dekodēšanu, izmantojot FEC.

11. Paņēmiens saskaņā ar 10. pretenziju, kas papildus ietver: atpunktēšanas veikšanu vismaz vienam LDPC paritātes bitam; 1. slāņa signalizācijas datu un atpunktētā LDPC paritātes bita dekodēšanu ar LDPC-dekodera palīdzību; 1. slāņa signalizācijas datu un ar LDPC dekoderi dekodētā paritātes bita dekodēšanu ar BCH koda palīdzību.

12. Paņēmiens saskaņā ar 10. vai 11. pretenziju, pie kam laika atblīvēšanas process netiek veikts ekstrahētajām konstelācijas vērtībām atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem gadījumā, kad informācija par L1 TI režīmu nenorāda uz laika blīvēšanas režīmu.

13. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 10. līdz 12. pretenzijai, pie kam gadījumā, kad informācija par L1 TI režīmu vērtība ir "01", laika blīvēšanas dziļums ir OFDM simbolu minimālais skaits, kas nepieciešams L1 signalizācijas datu pārņemšanai.

14. Paņēmiens datu pārraidei uz uztvērēju, pie kam paņēmiens ietver: 1. slāņa signalizācijas datu kodēšanu ar tiešu kļūdu labošanu, izmantojot FEC kodētāju; 1. slāņa ar tiešu kļūdu labošanu kodēto signalizācijas datu bitu blīvēšanu; 1. slāņa signalizācijas datu ar sablīvētiem bitiem demultiplexēšanu šūnu vārdos; šūnu vārdu attēlošanu konstelāciju vērtībās atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem; attēloto konstelāciju vērtību laika blīvēšanu atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem, balstoties uz atmiņu saskaņā ar 1. slāņa TI režīma informāciju, kas norāda laika blīvēšanas dziļumu, pie kam vairāku atmiņas rindu skaits ir vienāds ar laika blīvēšanas dziļumu, bet vairāku atmiņas kolonnu skaits ir vienāds ar kvocientu, kurš rodas daļot vairākas konstelācijas vērtības, kas nepieciešamas, lai pārraidītu L1 signalizācijas datus, ar laika blīvēšanas dziļumu, kurš ir vienāds ar vai lielāks par OFDM simbolu minimālo skaitu, kas ir nepieciešams, lai pārsūtītu L1 signalizācijas datus; 1. slāņa iesākuma ievietošanu sablīvētā laika konstelācijas

vērtībās atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem, pie kam 1. slāņa iesākums ietver informāciju par L1 TI režīmu; konstelācijas vērtību atkārtošānu atbilstoši 1. slāņa signalizācijas un iesākuma datiem; konstelācijas vērtību frekvenču blīvēšanu atbilstoši 1. slāņa signalizācijas un iesākuma datiem; signālu kadra veidošanu, kas satur preambulas simbolus, kas balstās uz konstelācijas vērtībām ar sablīvētām frekvencēm, pie kam preambulas simboli ir sadalīti 1. slāņa blokos un katrā 1. slāņa blokā ir 3408 apakšnesēji.

15. Paņēmiens saskaņā ar 14. pretenziju, kas papildus ietver: 1. slāņa signalizācijas datu kodēšanu ar BCH koda palīdzību; 1. slāņa ar BCH koda palīdzību kodēto signalizācijas datu kodēšanu, lai ģenerētu vismaz vienu LDPC paritātes bitu; punktēšanas veikšanu ģenerētajam LDPC paritātes bitam.

16. Paņēmiens saskaņā ar 15. pretenziju, kas papildus ietver 1. slāņa ar FEC kodu kodēto signalizācijas datu blīvēšanu, kuriem ir veikta punktēšana.

17. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 14. līdz 16. pretenzijai, pie kam netiek veikts laika blīvēšanas process attēlotajām konstelācijas vērtībām atbilstoši 1. slāņa signalizācijas datiem gadījumā, kad informācija par L1 TI režīmu nenorāda uz laika blīvēšanas režīmu.

18. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 14. līdz 17. pretenzijai, pie kam gadījumā, kad informācijas par L1 TI režīmu vērtība ir "01", laika blīvēšanas dziļums ir OFDM simbolu minimālais skaits, kas nepieciešams L1 signalizācijas datu pārņemšanai.

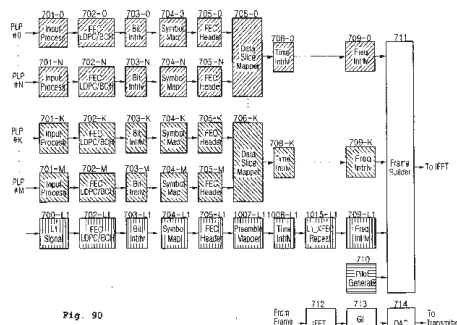
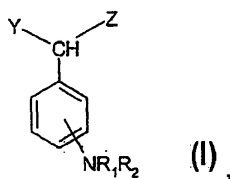


Fig. 90

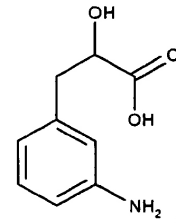
- (51) **A61K 31/196**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2222291**
A61K 31/606⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 1/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 08863709.5 (22) 23.12.2008
- (43) 01.09.2010
- (45) 21.03.2012
- (31) MI20072429 (32) 24.12.2007 (33) IT
- (86) PCT/EP2008/068265 23.12.2008
- (87) WO2009/080828 02.07.2009
- (73) Giuliani International Limited, 33 Sir John Rogerson's Quay, Dublin, IE
- (72) BARONI, Sergio, IT
 BELLINVIA, Salvatore, IT
- (74) Coppo, Alessandro, et al, Notarbartolo & Gervasi S.P.A., Corso di Porta Vittoria, 9, 20122 Milano, IT
 Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
- (54) **SAVIENOJUMI CELIAKIJAS SLIMĪBAS IMUNOLOĢISKĀ ZARNU IEKAISUMA KOMPONENTA SELEKTĪVAJAI ĀRSTĒŠANAI**
COMPOUNDS FOR THE SELECTIVE TREATMENT OF THE INTESTINAL IMMUNO-INFLAMMATORY COMPONENT OF THE CELIAC DISEASE
- (57) 1. Savienojums ar formulu (I):



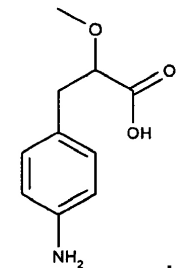
kur:
 R₁ un R₂, vienādas vai atšķirīgas viena no otras, ir izvēlētas no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma vai alkilgrupas ar taisnu

vai sazarotu virkni, kam ir no 1 līdz 6 oglekļa atomiem; Y un Z, vienādas vai atšķirīgas viena no otras, ir izvēlētas no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, -OH grupas, -COOH grupas, -OR₃ grupas, -CH(OR₃)COOH grupas; kur R₃ ir izvēlēta no ūdeņraža atoma, alkilgrupas ar taisnu vai sazarotu virkni, kam ir no 1 līdz 6 oglekļa atomiem; un tā farmaceutiski pieņemami sāļi vai esteri, kurus izmanto celiakijas slimības imunoloģiskā iekaisuma komponenta ārstēšanā.

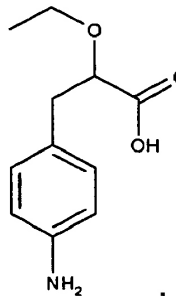
2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētais savienojums ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:
 (±)3-(3'-aminofenil)-2-hidroksipropionskābes ar formulu:



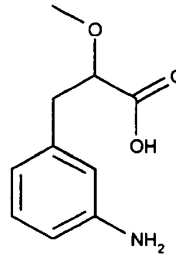
- 2-(4-aminofenil)-2-metoksietilskābes,
- 2-(3-aminofenil)-2-etoksietilskābes,
- 2-(4-aminofenil)-2-etoksietilskābes,
- 3-(4'-aminofenil)-2-metoksipropionskābes ar formulu:



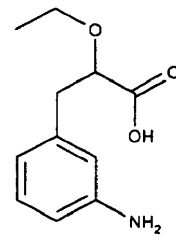
- 3-(4'-aminofenil)-2-etoksipropionskābes ar formulu:



- 3-(3'-aminofenil)-2-metoksipropionskābes ar formulu:



- 3-(3'-aminofenil)-2-etoksipropionskābes ar formulu:



- (51) **A23L 1/308**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2230943**
A23L 1/29⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A23L 2/52⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A23C 9/13⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/702⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/721⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/733⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 1/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 1/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 39/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 08858418.0 (22) 10.12.2008
(43) 29.09.2010
(45) 28.03.2012
(31) PCT/NL2007/050639 (32) 10.12.2007 (33) WO
(86) PCT/NL2008/050787 10.12.2008
(87) WO2009/075573 18.06.2009
(73) N.V. Nutricia, Eerste Stationsstraat 186, 2712 HM Zoetermeer, NL
(72) GOEDHART, Anna Christina, NL
ALLES, Martine Sandra, NL
VAN LAERE, Katrien Maria Jozefa, NL
(74) Swinkels, Bart Willem, Nederlandsch Octroobureau, J. W. Frisolaan 13, 2517 JS Den Haag, NL
Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
(54) **PIEDIATRIJĀ IZMANTOJAMS ŠĶIEDRU MAISIĀJUMS
PAEDIATRIC FIBRE MIXTURE**
(57) 1. Nesagremojamu ogļhidrātu maisījuma, kurā nesagremojamo ogļhidrātu maisījums ietver:
a. vismaz 5 masas % *beta*-galakto-oligosaharīdu, rēķinot uz kopējiem nesagremojamiem ogļhidrātiem;
b. vismaz 4 masas % fruktānu, rēķinot uz kopējiem nesagremojamiem ogļhidrātiem; un
c. vismaz 0,5 masas % nesagremojamu *alfa*-glikānu, rēķinot uz kopējiem nesagremojamiem ogļhidrātiem; un
d. vismaz 1 masas % hemicelulozes, rēķinot uz kopējiem nesagremojamiem ogļhidrātiem;
izmantošana šķidrās barības kompozīcijas ražošanai, kas paredzēta ievadīšanai 1 līdz 14 gadus vecam bērnam.
2. Izmantošana saskaņā ar 1. pretenziju, kurā šķidrā barības kompozīcija ir paredzēta gadījumam, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no ievadīšanas bērnam, kam nepieciešama barība, ievadīšanas bērnam, kam nepieciešams barošanas atbalsts, slimības izraisīta barības trūkuma profilaksei un/vai ārstēšanai, iekaisuma, diarejas un/vai infekciju profilaksei un/vai ārstēšanai.
3. Izmantošana saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kurā šķidrā barības kompozīcija ir paredzēta vēdera aizcietējuma profilaksei un/vai ārstēšanai.
4. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kurā kompozīcija ir paredzēta pediatrijas pacientiem.
5. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā maisījums papildus ietver celulozi un/vai arabinogalak-tānu.
6. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā maisījums papildus ietver galakturonskābes oligosaharīdus un/vai pektīna degradācijas produktus.
7. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā šķidrā barības kompozīcija ietver vismaz 0,2 g nesagremojamu ogļhidrātu, rēķinot uz 100 ml kompozīcijas.
8. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā maisījums ietver *beta*-galakto-oligosaharīdus, fruktānu, nesagremojamu *alfa*-glikānu un hemicelulozi masas attiecībā 1:(0,04 līdz 1); (0,01 līdz 2):(0,1 līdz 2).
9. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā barības kompozīcija ir šķidrums ar viskozitāti no 2 līdz 60 mPa*s 20°C temperatūrā un ar bīdes pretstības ātrumu 95 s⁻¹.
10. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām, kurā šķidrā barības kompozīcija ietver sagremojamu ogļhidrātu, proteīnu un lipīdu.
11. Izmantošana saskaņā ar 10. pretenziju, kas ietver 5 – 15 % proteīnu, 30 – 75 % sagremojamu ogļhidrātu un 20 – 55 % lipīdu, rēķinot uz kompozīcijas kopējām kalorijām.
12. Izmantošana saskaņā ar 10. vai 11. pretenziju, kurā proteīns satur sūkaku proteīnu.

13. Izmantošana saskaņā ar jebkuru no 10. līdz 12. pretenzijai, kurā lipīds satur garās virknes polinepiesātinātas taukskābes.

14. Šķidrā enterāla kompozīcija, kas ietver sagremojamu ogļhidrātu, lipīdus, proteīnu un maisījumu no nesagremojamiem ogļhidrātiem, kurā nesagremojamo ogļhidrātu maisījums ietver:

a. vismaz 5 masas % *beta*-galakto-oligosaharīdus, rēķinot uz kopējiem nesagremojamiem ogļhidrātiem;

b. vismaz 4 masas % fruktānu, rēķinot uz kopējiem nesagremojamiem ogļhidrātiem;

c. vismaz 0,5 masas % nesagremojamu *alfa*-glikānu, rēķinot uz kopējiem nesagremojamiem ogļhidrātiem; un

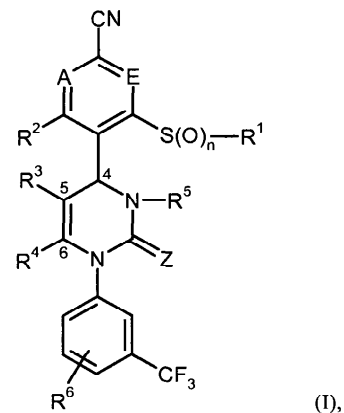
d. vismaz 1 masas % hemicelulozes, rēķinot uz kopējiem nesagremojamiem ogļhidrātiem.

15. Kompozīcija saskaņā ar 14. pretenziju, kas papildus ietver celulozi un arabinogalak-tānu (akācijas sveķus).

16. Kompozīcija saskaņā ar 14. vai 15. pretenziju, kas papildus ietver galakturonskābes oligosaharīdus.

17. Kompozīcijas saskaņā ar jebkuru no 14. līdz 16. pretenzijai izmantošana lietošanai, it sevišķi ievadīšanai, 1 līdz 14 gadus vecam bērnam.

- (51) **C07D 239/22**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2234985**
A61K 31/505⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 11/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 08864824.1 (22) 09.12.2008
(43) 06.10.2010
(45) 07.03.2012
(31) 102007061766 (32) 20.12.2007 (33) DE
102008022521 07.05.2008 DE
102008052013 17.10.2008 DE
(86) PCT/EP2008/010411 09.12.2008
(87) WO2009/080199 02.07.2009
(73) Bayer Pharma Aktiengesellschaft, Müllerstrasse 178, 13353 Berlin, DE
(72) VON NUSSBAUM, Franz, DE
KARTHAUS, Dagmar, DE
ANLAUF, Sonja, DE
DELBECK, Martina, DE
LI, Volkhart Min-Jian, DE
MEIBOM, Daniel, DE
LUSTIG, Klemens, DE
SCHAMBERGER, Jens, DE
(74) Aleksandrs SMIRNOVS, patentu aģentūra A.SMIRNOV & Co., a/k 1440, Rīga LV-1050, LV
(54) **4-(4-CIĀN-2-TIOARIL)-DIHIDROPYRIMIDINONI UN TO IZMANTOŠANA
4-(4-CYANO-2-THIOARYL)-DIHYDROPYRIMIDINONES AND USE THEREOF**
(57) 1. Savienojums ar formulu (I):



kurā:

A un E abi apzīmē C-R⁷ vai viens no abiem gredzena locekļiem A un E apzīmē N, un otrs apzīmē C-R⁷, kur R⁷ apzīmē ūdeņraža, fluora vai hlora atomu attiecīgi;

Z apzīmē O vai S;

n apzīmē skaitli 0, 1 vai 2;

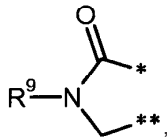
R¹ apzīmē (C₁-C₆)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, aminogrupu, mono- vai di-(C₁-C₄)alkilaminogrupu, hidroksikarbonilgrupu, aminokarbonilgrupu, (C₃-C₆)cikloalkilgrupu, fenilgrupu vai 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupu vai līdz piecām reizēm aizvietota ar fluora atomu, vai apzīmē (C₂-C₆)alkenilgrupu, (C₃-C₆)cikloalkilgrupu, fenilgrupu vai 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupu, turklāt minētās (C₃-C₆)cikloalkilgrupas var būt līdz divām reizēm aizvietotas ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no (C₁-C₂)alkilgrupas, hidroksilgrupas un/vai (C₁-C₄)alkoksigrupas, un minētās fenil- un heteroarilgrupas var būt līdz divām reizēm aizvietotas ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no fluora atoma, hlora atoma, ciāngrupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, difluormetilgrupas, trifluormetilgrupas, (C₁-C₄)alkoksigrupas, difluormetoksigrupas un/vai trifluormetoksigrupas;

R² apzīmē ūdeņraža, fluora vai hlora atomu;

R³ apzīmē ciāngrupu vai grupu ar formulu -C(=O)-R⁸, -C(=O)-O-R⁸, -C(=O)-NH₂ vai -C(=O)-NH-R⁸, kurā R⁸ apzīmē (C₁-C₆)alkilgrupu, (C₃-C₆)alkenilgrupu vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu, turklāt (C₁-C₆)alkilgrupa un (C₃-C₆)cikloalkilgrupa savukārt var būt līdz divām reizēm aizvietotas ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no hidroksilgrupas, (C₁-C₄)alkoksigrupas, hidroksikarbonilgrupas, (C₁-C₄)alkoksikarbonilgrupas, aminogrupas, mono- un/vai di-(C₁-C₄)alkilaminogrupas, un (C₁-C₆)alkilgrupā un (C₃-C₆)cikloalkilgrupā attiecīgi viena CH₂-grupa var būt aizstāta ar O-atomu līdz ķīmiski stabila savienojuma iegūšanai;

R⁴ apzīmē metilgrupu vai etilgrupu;

vai R³ un R⁴ ir savienoti viens ar otru un kopā veido condensētu grupu ar formulu:



kurā * apzīmē savienošanas vietu ar formulā (I) attēloto dihidropirimidīna gredzena 5. pozīciju, un ** apzīmē savienošanas vietu ar formulā (I) attēloto dihidropirimidīna gredzena 6. pozīciju, un R⁹ apzīmē ūdeņraža atomu, (C₁-C₆)alkilgrupu vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu, turklāt (C₁-C₆)alkilgrupa var būt aizvietota ar hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, aminokarbonilgrupu, aminokarbonilaminogrupu, (C₁-C₄)acilaminogrupu vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu;

R⁵ apzīmē ūdeņraža atomu vai (C₁-C₆)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar ciāngrupu, hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, aminogrupu, mono- vai di-(C₁-C₄)alkilaminogrupu vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu vai līdz trim reizēm aizvietota ar fluora atomu, vai apzīmē fenilgrupu, piridilgrupu vai pirimidinilgrupu, turklāt fenilgrupa, piridilgrupa un pirimidinilgrupa savukārt var būt līdz divām reizēm aizvietotas ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no fluora atoma, hlora atoma, ciāngrupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, difluormetilgrupas, (C₁-C₄)alkoksigrupas un/vai trifluormetoksigrupas; vai R⁵ apzīmē grupu ar formulu -C(=O)-O-R¹⁰, -L¹-C(=O)-O-R¹¹, -L²-C(=O)-NR¹²R¹³, -L²-SO₂-NR¹²R¹³, -L²-C(=O)-NR¹⁴-NR¹²R¹³ vai -L²-SO₂-R¹⁵, kurā:

L¹ apzīmē (C₁-C₆)alkandiilgrupu;

L² apzīmē saiti vai (C₁-C₆)alkandiilgrupu;

R¹⁰ apzīmē (C₁-C₆)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar (C₃-C₆)cikloalkilgrupu vai fenilgrupu;

R¹¹ apzīmē ūdeņraža atomu vai (C₁-C₆)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar (C₃-C₆)cikloalkilgrupu vai fenilgrupu;

R¹² un R¹³ ir vienādi vai dažādi neatkarīgi viens no otra apzīmē ūdeņraža atomu, (C₁-C₆)alkilgrupu, (C₃-C₆)cikloalkilgrupu vai 4- līdz 6-locekļu heterociklilgrupu, turklāt (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa un 4- līdz 6-locekļu heterociklilgrupa savukārt var būt līdz divām reizēm aizvietotas ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no fluora atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₄)alkoksigrupas, oksogrupas, aminogrupas, mono- vai di-(C₁-C₄)alkilaminogrupas, hidroksikarbonilgrupas, (C₁-C₄)alkoksikarbonilgrupas un/vai aminokarbonilgrupas, un (C₁-C₆)alkilgrupā viena CH₂-grupa var būt aizstāta ar O-atomu līdz ķīmiski stabila savienojuma iegūšanai, un (C₃-C₆)cikloalkilgrupa un 4- līdz 6-locekļu heterociklilgrupa var būt līdz divām reizēm papildus aizvietotas ar vienādiem vai dažādām (C₁-C₄)alkilgrupām, kas savukārt var būt aizvietotas ar hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu vai hidroksikarbonilgrupu;

vai R¹² un R¹³ kopā ar slāpekļa atomu, kuram tie ir pievienoti, veido 4- līdz 6-locekļu heterociklu, kas var saturēt papildu gredzena heteroatomu no rindas: N, O, S, SO vai SO₂ un var būt līdz divām reizēm aizvietots ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no (C₁-C₄)alkilgrupas, hidroksilgrupas, (C₁-C₄)alkoksigrupas, oksogrupas, aminogrupas, mono- vai di-(C₁-C₄)alkilaminogrupas, hidroksikarbonilgrupas, aminokarbonilgrupas, (C₃-C₆)cikloalkilgrupas, 4- līdz 6-locekļu heterociklilgrupas un/vai 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupas, turklāt (C₁-C₄)alkilgrupa savukārt var būt aizvietota ar hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu vai hidroksikarbonilgrupu;

R¹⁴ apzīmē ūdeņraža atomu vai (C₁-C₄)alkilgrupu;

un R¹⁵ apzīmē (C₁-C₆)alkilgrupu, (C₃-C₆)cikloalkilgrupu, fenilgrupu vai 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupu, turklāt (C₁-C₆)alkilgrupa var būt aizvietota ar hlora atomu, hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, mono- vai di-(C₁-C₄)alkilaminogrupu vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu vai līdz trim reizēm aizvietota ar fluora atomu, un fenilgrupa un 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa savukārt var būt līdz divām reizēm aizvietotas ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no fluora atoma, hlora atoma, ciāngrupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, difluormetilgrupas, trifluormetilgrupas, (C₁-C₄)alkoksigrupas un/vai trifluormetoksigrupas;

un R⁶ apzīmē ūdeņraža, fluora vai hlora atomu;

kā arī tā farmaceutiski pieņemami sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

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

A un E abi apzīmē C-R⁷ vai viens no abiem gredzena locekļiem A un E apzīmē N, un otrs apzīmē C-R⁷, kur R⁷ attiecīgi apzīmē ūdeņraža, fluora vai hlora atomu;

Z apzīmē O vai S;

n apzīmē skaitli 0, 1 vai 2;

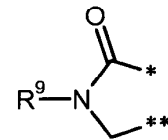
R¹ apzīmē (C₁-C₆)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, aminogrupu, mono- vai di-(C₁-C₄)alkilaminogrupu, hidroksikarbonilgrupu, aminokarbonilgrupu, (C₃-C₆)cikloalkilgrupu vai fenilgrupu, vai apzīmē (C₂-C₆)alkenilgrupu, (C₃-C₆)cikloalkilgrupu vai fenilgrupu, turklāt minētās (C₃-C₆)cikloalkilgrupas var būt līdz divām reizēm aizvietotas ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no (C₁-C₄)alkilgrupas, hidroksilgrupas un/vai (C₁-C₄)alkoksigrupas, un minētās fenilgrupas var būt līdz divām reizēm aizvietotas ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no fluora atoma, hlora atoma, ciāngrupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, difluormetilgrupas, trifluormetilgrupas, (C₁-C₄)alkoksigrupas, difluormetoksigrupas un/vai trifluormetoksigrupas;

R² apzīmē ūdeņraža, fluora vai hlora atomu;

R³ apzīmē ciāngrupu vai grupu ar formulu -C(=O)-R⁸, -C(=O)-O-R⁸, -C(=O)-NH₂ vai -C(=O)-NH-R⁸, kurā R⁸ apzīmē (C₁-C₆)alkilgrupu, (C₃-C₆)alkenilgrupu vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu, turklāt (C₁-C₆)alkilgrupa un (C₃-C₆)cikloalkilgrupa savukārt var būt līdz divām reizēm aizvietotas ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no hidroksilgrupas, (C₁-C₄)alkoksigrupas, hidroksikarbonilgrupas, (C₁-C₄)alkoksikarbonilgrupas, aminogrupas, mono- un/vai di-(C₁-C₄)alkilaminogrupas, un (C₁-C₆)alkilgrupā un (C₃-C₆)cikloalkilgrupā attiecīgi viena CH₂-grupa var būt aizstāta ar O-atomu līdz ķīmiski stabila savienojuma iegūšanai;

R⁴ apzīmē metilgrupu vai etilgrupu;

vai R³ un R⁴ ir savienoti viens ar otru un kopā veido condensētu grupu ar formulu:



kurā * apzīmē savienošanas vietu ar formulā (I) attēloto dihidropirimidīna gredzena 5. pozīciju, un ** apzīmē savienošanas vietu ar formulā (I) attēloto dihidropirimidīna gredzena 6. pozīciju, un R⁹ apzīmē ūdeņraža atomu, (C₁-C₆)alkilgrupu vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu, turklāt (C₁-C₆)alkilgrupa var būt aizvietota ar hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, aminokarbonilgrupu, (C₁-C₄)acilaminogrupu vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu;

R⁵ apzīmē ūdeņraža atomu vai (C₁-C₆)alkilgrupu, kas var būt līdz trim reizēm aizvietota ar fluora atomu, vai apzīmē fenilgrupu, piridilgrupu vai pirimidinilgrupu, turklāt fenilgrupa, piridilgrupa un

pirimidinilgrupa savukārt var būt līdz divām reizēm aizvietotas ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no fluora atoma, hlorā atoma, ciāngrupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, trifluorometilgrupas, (C₁-C₄)alkoksigrupas un/vai trifluorometoksigrupas; vai R⁵ apzīmē grupu ar formulu -C(=O)-O-R¹⁰, -L¹-C(=O)-O-R¹¹, -L²-C(=O)-NR¹²R¹³, -L²-SO₂-NR¹²R¹³, -L²-C(=O)-NR¹⁴-NR¹²R¹³ vai -L²-SO₂-R¹⁵, kurā:

L¹ apzīmē (C₁-C₆)alkandiilgrupu;

L² apzīmē saiti vai (C₁-C₆)alkandiilgrupu;

R¹⁰ apzīmē (C₁-C₆)alkilgrupu;

R¹¹ apzīmē ūdeņraža atomu vai (C₁-C₆)alkilgrupu;

R¹² un R¹³ ir vienādi vai dažādi un neatkarīgi viens no otra apzīmē ūdeņraža atomu, (C₁-C₆)alkilgrupu, (C₃-C₆)cikloalkilgrupu vai 4- līdz 6-locekļu heterociklilgrupu, turklāt (C₁-C₆)alkilgrupa, (C₃-C₆)cikloalkilgrupa un 4- līdz 6-locekļu heterociklilgrupa savukārt var būt līdz divām reizēm aizvietotas ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no fluora atoma, hidroksilgrupas, (C₁-C₄)alkoksigrupas, oksogrupas, aminogrupas, mono- vai di-(C₁-C₄)alkilaminogrupas, hidroksikarbonilgrupas, (C₁-C₄)alkoksikarbonilgrupas un/vai aminokarbonilgrupas, un (C₁-C₆)alkilgrupā viena CH₂-grupa var būt aizstāta ar O-atomu līdz ķīmiski stabila savienojuma iegūšanai;

vai R¹² un R¹³ kopā ar slāpekļa atomu, kuram tie ir pievienoti, veido 4- līdz 6-locekļu heterociklu, kas var saturēt papildu gredzena heteroatomu no rindas: N, O, S, SO vai SO₂ un var būt līdz divām reizēm aizvietots ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no (C₁-C₄)alkilgrupas, hidroksilgrupas, (C₁-C₄)alkoksigrupas, oksogrupas, aminogrupas, mono- un/vai di-(C₁-C₄)alkilaminogrupas, turklāt (C₁-C₄)alkilgrupa savukārt var būt aizvietota ar hidroksilgrupu vai (C₁-C₄)alkoksigrupu;

R¹⁴ apzīmē ūdeņraža atomu vai (C₁-C₄)alkilgrupu un R¹⁵ apzīmē (C₁-C₆)alkilgrupu, (C₃-C₆)cikloalkilgrupu, fenilgrupu vai 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupu, turklāt (C₁-C₆)alkilgrupa var būt aizvietota ar fluora atomu, hlorā atomu, hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, mono- vai di-(C₁-C₄)alkilaminogrupu vai fenilgrupu, un 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupa savukārt var būt līdz divām reizēm aizvietotas ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no fluora atoma, hlorā atoma, ciāngrupas, (C₁-C₄)alkilgrupas, trifluorometilgrupas, (C₁-C₄)alkoksigrupas un/vai trifluorometoksigrupas;

un R⁶ apzīmē ūdeņraža, fluora vai hlorā atomu;

kā arī tā farmaceutiski pieņemami sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

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

A un E abi apzīmē CH;

Z apzīmē O;

n apzīmē skaitli 0 vai 2;

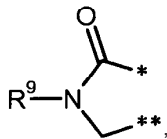
R¹ apzīmē (C₁-C₄)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, hidroksikarbonilgrupu, aminokarbonilgrupu, (C₃-C₆)cikloalkilgrupu, fenilgrupu vai 5-locekļu heteroarilgrupu, vai līdz trim reizēm aizvietota ar fluora atomu, vai apzīmē (C₃-C₆)cikloalkilgrupu, fenilgrupu vai 5-locekļu heteroarilgrupu, turklāt minētās fenil- un heteroarilgrupas var būt līdz divām reizēm aizvietotas ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no fluora atoma, hlorā atoma, ciāngrupas, metilgrupas, trifluorometilgrupas, metoksigrupas un trifluorometoksigrupas;

R² apzīmē ūdeņraža atomu;

R³ apzīmē ciāngrupu, acetilgrupu vai (2-hidroksietoksi)karbonilgrupu;

R⁴ apzīmē metilgrupu

vai R³ un R⁴ ir savienoti viens ar otru un kopā veido kondensētu grupu ar formulu:



kurā * apzīmē savienošanas vietu ar formulā (I) attēloto dihidropirimidīna gredzena 5. pozīciju, un ** apzīmē savienošanas vietu ar formulā (I) attēloto dihidropirimidīna gredzena 6. pozīciju, un R⁹ apzīmē ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu, turklāt (C₁-C₄)alkilgrupa var būt aizvietota ar hidroksilgrupu vai (C₁-C₄)alkoksigrupu;

R⁵ apzīmē ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar ciāngrupu vai di-(C₁-C₄)alkilaminogrupu, vai apzīmē grupu ar formulu -L²-C(=O)-NR¹²R¹³, -L²-C(=O)-NH-NR¹²R¹³ vai -L²-SO₂-R¹⁵, kurā:

L² apzīmē saiti, -CH₂-, -CH₂CH₂- vai -CH(CH₃)-;

R¹² apzīmē ūdeņraža atomu vai (C₁-C₄)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar hidroksilgrupu vai (C₁-C₄)alkoksigrupu;

R¹³ apzīmē ūdeņraža atomu, (C₁-C₆)alkilgrupu vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu, turklāt (C₁-C₆)alkilgrupa var būt līdz divām reizēm aizvietota ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no hidroksilgrupas, (C₁-C₄)alkoksigrupas, hidroksikarbonilgrupas, (C₁-C₄)alkoksikarbonilgrupas un aminokarbonilgrupas, un (C₁-C₆)alkilgrupā viena CH₂-grupa var būt aizstāta ar O-atomu līdz ķīmiski stabila savienojuma iegūšanai;

vai R¹² un R¹³ kopā ar slāpekļa atomu, kuram tie ir pievienoti, veido 5- vai 6-locekļu heterociklu, kas var saturēt papildu gredzena heteroatomu no rindas: N, O un S, un var būt aizvietots ar (C₁-C₄)alkilgrupu, hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, oksogrupu, hidroksikarbonilgrupu, aminokarbonilgrupu, 4- līdz 6-locekļu heterociklilgrupu vai 5- vai 6-locekļu heteroarilgrupu, turklāt (C₁-C₄)alkilgrupa savukārt var būt aizvietota ar hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu vai hidroksikarbonilgrupu;

un R¹⁵ apzīmē (C₁-C₄)alkilgrupu, (C₃-C₆)cikloalkilgrupu vai fenilgrupu, turklāt (C₁-C₄)alkilgrupa var būt aizvietota ar (C₃-C₆)cikloalkilgrupu un fenilgrupu var būt līdz divām reizēm aizvietota ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no fluora atoma, hlorā atoma, ciāngrupas, metilgrupas, trifluorometilgrupas, metoksigrupas un trifluorometoksigrupas;

un R⁶ apzīmē ūdeņraža vai fluora atomu;

kā arī tā farmaceutiski pieņemami sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

4. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kurā:

A un E abi apzīmē CH;

Z apzīmē O;

n apzīmē skaitli 0 vai 2;

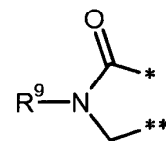
R¹ apzīmē (C₁-C₄)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, hidroksikarbonilgrupu, aminokarbonilgrupu, (C₃-C₆)cikloalkilgrupu vai fenilgrupu, vai apzīmē (C₃-C₆)cikloalkilgrupu vai fenilgrupu, turklāt minētās fenilgrupas var būt līdz divām reizēm aizvietotas ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no fluora atoma, hlorā atoma, ciāngrupas, metilgrupas, trifluorometilgrupas, metoksigrupas un trifluorometoksigrupas;

R² apzīmē ūdeņraža atomu;

R³ apzīmē ciāngrupu vai acetilgrupu;

R⁴ apzīmē metilgrupu

vai R³ un R⁴ ir savienoti viens ar otru un kopā veido kondensētu grupu ar formulu:



kurā * apzīmē savienošanas vietu ar formulā (I) attēloto dihidropirimidīna gredzena 5. pozīciju, un ** apzīmē savienošanas vietu ar formulā (I) attēloto dihidropirimidīna gredzena 6. pozīciju, un R⁹ apzīmē ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu, turklāt (C₁-C₄)alkilgrupa var būt aizvietota ar hidroksilgrupu vai (C₁-C₄)alkoksigrupu;

R⁵ apzīmē ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu vai grupu ar formulu -L²-C(=O)-NR¹²R¹³, -L²-C(=O)-NH-NR¹²R¹³ vai -L²-SO₂-R¹⁵, kurā:

L² apzīmē saiti, -CH₂-, -CH₂CH₂- vai -CH(CH₃)-;

R¹² apzīmē ūdeņraža atomu vai (C₁-C₄)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar hidroksilgrupu vai (C₁-C₄)alkoksigrupu;

R¹³ apzīmē ūdeņraža atomu, (C₁-C₆)alkilgrupu vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu, turklāt (C₁-C₆)alkilgrupa var būt līdz divām reizēm aizvietota ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no hidroksilgrupas, (C₁-C₄)alkoksigrupas, hidroksikarbonilgrupas, (C₁-C₄)alkoksikarbonilgrupas un aminokarbonilgrupas, un (C₁-C₆)alkilgrupā viena CH₂-grupa var būt aizstāta ar O-atomu līdz ķīmiski stabila savienojuma iegūšanai;

vai R¹² un R¹³ kopā ar slāpekļa atomu, kuram tie ir pievienoti, veido 5- vai 6-locekļu heterociklu, kas var saturēt papildu gredzena

heteroatomu no rindas: N, O un S, un var būt aizvietots ar (C₁-C₄)alkilgrupu, hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu vai oksogrupu, turklāt (C₁-C₄)alkilgrupa savukārt var būt aizvietota ar hidroksilgrupu vai (C₁-C₄)alkoksigrupu;
 un R¹⁵ apzīmē (C₁-C₄)alkilgrupu, (C₃-C₆)cikloalkilgrupu vai fenilgrupu, turklāt fenilgrupa var būt līdz divām reizēm aizvietota ar vienādiem vai dažādiem aizvietotājiem no grupas, kas sastāv no fluora atoma, hlora atoma, ciāngrupas, metilgrupas, trifluormetilgrupas, metoksigrupas un trifluormetoksigrupas;
 un R⁶ apzīmē ūdeņraža vai fluora atomu;
 kā arī tā farmaceitiski pieņemami sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

5. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kurā:

A un E abi apzīmē CH;

Z apzīmē O;

n apzīmē skaitli 2;

R¹ apzīmē (C₁-C₄)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar hidroksilgrupu, (C₁-C₄)alkoksigrupu, ciklopropilgrupu, ciklobutilgrupu vai fenilgrupu vai līdz trim reizēm aizvietota ar fluora atomu;

R² apzīmē ūdeņraža atomu;

R³ apzīmē ciāngrupu vai (2-hidroksietoksi)karbonilgrupu;

R⁴ apzīmē metilgrupu;

R⁵ apzīmē ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu vai grupu ar formulu -L²-C(=O)-NH-R¹³ vai -SO₂-R¹⁵, kurā:

L² apzīmē saiti vai -CH₂-;

R¹³ apzīmē ūdeņraža atomu vai (C₁-C₄)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar hidroksilgrupu vai (C₁-C₄)alkoksigrupu, vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu;

un R¹⁵ apzīmē (C₁-C₄)alkilgrupu vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu

un R⁶ apzīmē ūdeņraža atomu;

kā arī tā farmaceitiski pieņemami sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

6. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kurā:

A un E abi apzīmē CH;

Z apzīmē O;

n apzīmē skaitli 2;

R¹ apzīmē (C₁-C₄)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar hidroksilgrupu vai (C₁-C₄)alkoksigrupu;

R² apzīmē ūdeņraža atomu;

R³ apzīmē ciāngrupu;

R⁴ apzīmē metilgrupu;

R⁵ apzīmē ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu vai grupu ar formulu -CH₂-C(=O)-NH-R¹³ vai -SO₂-R¹⁵, kurā:

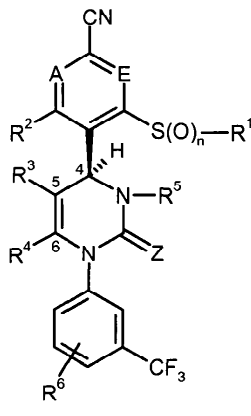
R¹³ apzīmē ūdeņraža atomu vai (C₁-C₄)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar hidroksilgrupu, vai (C₁-C₄)alkoksigrupu;

un R¹⁵ apzīmē (C₁-C₄)alkilgrupu vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu;

un R⁶ apzīmē ūdeņraža atomu;

kā arī tā farmaceitiski pieņemami sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

7. Savienojums saskaņā ar formulu (I) ar konfigurāciju, kas attēlota formulā (I-ent) dihidropirimidīna gredzena 4. pozīcijā saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai,



(I-ent),

kurā:

A un E abi apzīmē CH;

Z apzīmē O;

n apzīmē skaitli 2;

R¹ apzīmē (C₁-C₄)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar hidroksilgrupu vai (C₁-C₄)alkoksigrupu;

R² apzīmē ūdeņraža atomu;

R³ apzīmē ciāngrupu;

R⁴ apzīmē metilgrupu;

R⁵ apzīmē ūdeņraža atomu, (C₁-C₄)alkilgrupu vai grupu ar formulu -CH₂-C(=O)-NH-R¹³ vai -SO₂-R¹⁵, kurā:

R¹³ apzīmē ūdeņraža atomu vai (C₁-C₄)alkilgrupu, kas var būt aizvietota ar hidroksilgrupu, vai (C₁-C₄)alkoksigrupu;

un R¹⁵ apzīmē (C₁-C₄)alkilgrupu vai (C₃-C₆)cikloalkilgrupu;

un R⁶ apzīmē ūdeņraža atomu;

kā arī tā farmaceitiski pieņemami sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

8. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

4-((4S)-5-acetil-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidin-4-il)-3-(metilsulfonyl)benzonitrila;

(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;

(6S)-5-ciān-6-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-N-(2-hidroksietil)-4-metil-2-okso-3-[3-(trifluormetil)fenil]-3,6-dihidropirimidīn-1(2H)-karboksamīda;

(6S)-5-ciān-6-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-N',N'-bis(2-hidroksietil)-4-metil-2-okso-3-[3-(trifluormetil)fenil]-3,6-dihidropirimidīn-1(2H)-karbohidrazīda;

(6S)-5-ciān-6-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-N-[2-(2-hidroksietoksi)etil]-4-metil-2-okso-3-[3-(trifluormetil)fenil]-3,6-dihidropirimidīn-1(2H)-karboksamīda;

(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-3-[[3(S)-3-hidroksipirolidin-1-il]karbonil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;

(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-3-[[4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il]karbonil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;

2-[[6(S)-5-ciān-6-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-4-metil-2-okso-3-[3-(trifluormetil)fenil]-3,6-dihidropirimidīn-1(2H)-il]acetamīda;

(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-3-(metilsulfonyl)-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;

(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-3-(ciklopropilsulfonyl)-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;

(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-3,6-dimetil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;

4-((4S)-6-metil-3-(metilsulfonyl)fenil)-2,5-dioakso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-2,3,4,5,6,7-heksahidro-1H-pirololo[3,4-d]pirimidin-4-il)-3-(metilsulfonyl)benzonitrila;

(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;

(4S)-4-[4-ciān-2-[(S)-metilsulfonyl]fenil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;

(rac)-1-(2-{4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-2,5-dioakso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4,5,7-heksahidro-6H-pirololo[3,4-d]pirimidin-6-il}etil)urīnvielas;

(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-3-[[3-hidroksiazetidīn-1-il]karbonil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;

(4S)-3-[[3(R)-3-aminopiperidin-1-il]karbonil]-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;

(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-2-okso-3-[[4-(piridīn-2-il)piperazin-1-il]karbonil]-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;

(6S)-5-ciān-6-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-N,N-bis(2-hidroksipropil)-4-metil-2-okso-3-[3-(trifluormetil)fenil]-3,6-dihidropirimidīn-1(2H)-karboksamīda;

(6S)-5-ciān-6-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-N-(1-hidroksi-2-metilpropan-2-il)-4-metil-2-okso-3-[3-(trifluormetil)fenil]-3,6-dihidropirimidīn-1(2H)-karboksamīda;

(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-3-[[4-fluorfenil]sulfonyl]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;

(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-3-[[1-(difluormetil)-5-metil-1H-pirazol-4-il]sulfonyl]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;

(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-3-[[2-ciānfenil]sulfonyl]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;

(4S)-3-(ciānmetil)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 5-ciān-6-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-4-metil-2-okso-3-[3-(trifluormetil)fenil]-3,6-dihidropirimidīn-1(2H)-karbonskābes benzilestera;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(etilsulfonyl)fenil]-3,6-dimetil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (rac)-4-[4-ciān-2-((2-hidroksietil)sulfonyl)fenil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(fenilsulfonyl)fenil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-3-(metilsulfonyl)-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonskābes 2-hidroksietilestera,
 kā arī tā farmaceitiski pieņemami sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

9. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonskābes amīda;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (6S)-5-ciān-6-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-N-(2-hidroksietil)-4-metil-2-okso-3-[3-(trifluormetil)fenil]-3,6-dihidropirimidīn-1(2H)-karbonskābes amīda;
 (6S)-5-ciān-6-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-N',N'-bis(2-hidroksietil)-4-metil-2-okso-3-[3-(trifluormetil)fenil]-3,6-dihidropirimidīn-1(2H)-karbohidrazīda;
 2-[(6S)-5-ciān-6-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-4-metil-2-okso-3-[3-(trifluormetil)fenil]-3,6-dihidropirimidīn-1(2H)-il]acetamīda;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-2-okso-3-[2-okso-2-(3-oksopiperazin-1-il)etil]-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-3-(metilsulfonyl)-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-3-{[2-(trifluormetoksi)fenil]sulfonyl}-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-3-(etilsulfonyl)-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-3-(ciklopropilsulfonyl)-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-3,6-dimetil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 4-[(4S)-6-metil-3-(metilsulfonyl)-2,5-diokso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-2,3,4,5,6,7-heksahidro-1H-pirol[3,4-d]pirimidin-4-il]-3-(metilsulfonyl)benzonitrila;
 (rac)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-N-(2-hidroksietil)-6-metil-2,5-diokso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,4,5,6,7-heksahidro-3H-pirol[3,4-d]pirimidīn-3-karbonskābes amīda;
 (4S)-4-[4-ciān-2-((S)-metilsulfonyl)fenil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-3-[(4-fluorfenil)sulfonyl]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-3-[(1,2-dimetil-1H-imidazol-4-il)sulfonyl]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (4S)-3-(ciānmetil)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-3-(4-ciānfenil)-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-2-okso-1,3-bis[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 4-[(4S)-3,6-dimetil-2,5-diokso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-2,3,4,5,6,7-heksahidro-1H-pirol[3,4-d]pirimidin-4-il]-3-(metilsulfonyl)benzonitrila;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(etilsulfonyl)fenil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(etilsulfonyl)fenil]-3,6-dimetil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(etilsulfonyl)fenil]-6-metil-3-(metilsulfonyl)-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrila;
 (4S)-4-[4-ciān-2-(etilsulfonyl)fenil]-6-metil-3-(metilsulfonyl)-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonskābes 2-hidroksietilestera,

kā arī tā farmaceitiski pieņemami sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

10. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai ar šādu struktūru:

(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-3,6-dimetil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrils,
 kā arī tā farmaceitiski pieņemami sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

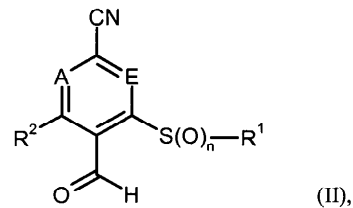
11. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai ar šādu struktūru:

(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-3-(metilsulfonyl)-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrils,
 kā arī tā farmaceitiski pieņemami sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

12. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai ar šādu struktūru:

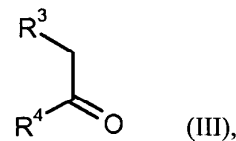
(4S)-4-[4-ciān-2-(metilsulfonyl)fenil]-6-metil-2-okso-1-[3-(trifluormetil)fenil]-1,2,3,4-tetrahidropirimidīn-5-karbonitrils,
 kā arī tā farmaceitiski pieņemami sāļi, solvāti un sāļu solvāti.

13. Paņēmieni savienojumu ar formulu (I), kā definēts no 1. līdz 12. pretenzijai, iegūšanai, kas raksturīgs ar to, ka savienojums ar formulu (II):

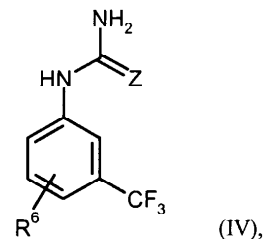


kurā A, E, n, R¹ un R² nozīmes ir minētas no 1. līdz 12. pretenzijai,

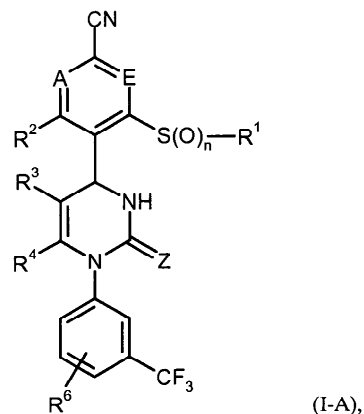
tiešāk pakļauts 3 komponentu reakcijai vienā traukā vai secīgi skābes vai skābes anhidrīda klātbūtnē ar savienojumu ar formulu (III):



kurā R³ un R⁴ nozīmes ir minētas no 1. līdz 12. pretenzijai, un ar savienojumu ar formulu (IV):

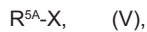


kurā Z un R⁶ nozīmes ir minētas no 1. līdz 12. pretenzijai, iegūstot savienojumu ar formulu (I-A):

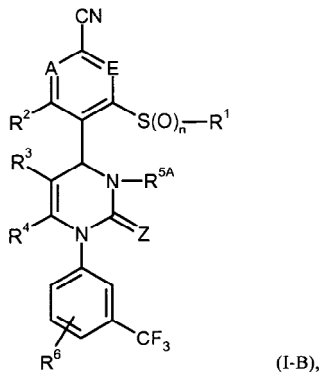


kurā katra A, E, Z, n, R¹, R², R³, R⁴ un R⁶ nozīmes ir iepriekš minētās,

un šis savienojums, gadījumā, ja formulā (I) R⁵ nav ūdeņraža atoms, tad tiek pakļauts reakcijai bāzes klātbūtnē ar savienojumu ar formulu (V):



kurā R^{5A} nozīme ir R⁵ nozīme, kas minēta no 1. līdz 12. pretenzijai, bet nav ūdeņraža atoms, un X apzīmē aizejošo grupu, tādu, kā, piemēram, halogēna atomu, mezilāta, tozilāta vai trifilāta grupu, iegūstot savienojumu ar formulu (I-B):



kurā katra A, E, Z, n, R¹, R², R³, R⁴, R^{5A} un R⁶ nozīmes ir iepriekšminētās, un, ja nepieciešams, tādā veidā iegūtie savienojumi ar formulu (I-A) vai (I-B), lietojot zināmās metodes, tiek sadalīti to enantiomēros un/vai diastereomēros un/vai tiek pārvērsti ar piemērotiem (i) šķīdinātājiem un/vai (ii) bāzēm vai skābēm to šķīdinātos, sāļos un/vai sālū šķīdinātos.

14. Savienojums, kā definēts jebkurā no 1. līdz 12. pretenzijai, slimību ārstēšanai un/vai novēršanai.

15. Savienojums, kā definēts jebkurā no 1. līdz 12. pretenzijai, kuru lieto metodē plaušu arteriālās hipertensijas (PAH) un citu plaušu hipertensijas (PH) formu, hroniskas obstruktīvas plaušu slimības (HOPS), akūta plaušu bojājuma (ALI), akūta respiratorā distresa sindroma (ARDS), plaušu emfizēmas, alfa-1 antitripsīna deficīta (AATD) un cistiskās fibrozes (CF) ārstēšanai un/vai novēršanai.

16. Savienojums, kā definēts jebkurā no 1. līdz 12. pretenzijai, bronhektāzes ārstēšanai un/vai novēršanai.

17. Savienojuma, kā definēts jebkurā no 1. līdz 12. pretenzijai, izmantošana medikamenta iegūšanā, kas paredzēts plaušu arteriālās hipertensijas (PAH) un citu plaušu hipertensijas (PH) formu, hroniskas obstruktīvas plaušu slimības (HOPS), akūta plaušu bojājuma (ALI), akūta respiratorā distresa sindroma (ARDS), plaušu emfizēmas, alfa-1 antitripsīna deficīta (AATD) un cistiskās fibrozes (CF) ārstēšanai un/vai novēršanai.

18. Medikaments, kas satur savienojumu, kā definēts jebkurā no 1. līdz 12. pretenzijai, kombinācijā ar vienu vai vairākām inertām netoksiskām farmaceitiski pieņemamām palīgvielām.

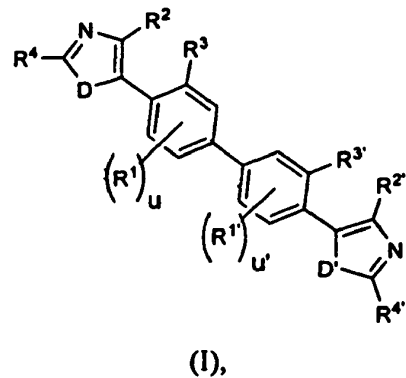
19. Medikaments, kas satur savienojumu, kā definēts jebkurā no 1. līdz 12. pretenzijai, kombinācijā ar vienu vai vairākām papildu aktīvajām vielām, kas izvēlētas no grupas, kas sastāv no kināzes inhibitoriem, matriksa metaloproteāzes inhibitoriem, šķīdināšanas guanilātciklāzes stimulatoriem un aktivatoriem, prostaciklīna analogiem, endotelīna receptoru antagonistiem, fosfodiesterāzes inhibitoriem, beta adrenerģisko receptoru agonistiem, antiholīnēriģiskiem līdzekļiem un glikokortikoīdiem.

20. Medikaments saskaņā ar 18. vai 19. pretenziju, kas paredzēts plaušu arteriālās hipertensijas (PAH) un citu plaušu hipertensijas (PH) formu, hroniskas obstruktīvas plaušu slimības (HOPS), akūta plaušu bojājuma (ALI), akūta respiratorā distresa sindroma (ARDS), plaušu emfizēmas, alfa-1 antitripsīna deficīta (AATD) un cistiskās fibrozes (CF) ārstēšanai un/vai novēršanai.

21. Medikaments saskaņā ar 18. vai 19. pretenziju bronhektāzes ārstēšanai un/vai novēršanai.

22. Medikamenta, kā definēts jebkurā no 18. līdz 20. pretenzijai, izmantošana medikamenta iegūšanā, kas paredzēts plaušu arteriālās hipertensijas (PAH) un citu plaušu hipertensijas (PH) formu, hroniskas obstruktīvas plaušu slimības (HOPS), akūta plaušu bojājuma (ALI), akūta respiratorā distresa sindroma (ARDS), plaušu emfizēmas, alfa-1 antitripsīna deficīta (AATD) un cistiskās fibrozes (CF) ārstēšanai un/vai novēršanai cilvēkiem un dzīvniekiem.

- (51) C07D 403/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) 2245027
- C07D 405/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 487/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 491/044⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- C07D 491/052⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- A61K 31/4178⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- A61K 31/4184⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- A61K 31/4188⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- A61P 31/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 09709849.5 (22) 06.02.2009
- (43) 03.11.2010
- (45) 25.04.2012
- (31) 28277 (32) 13.02.2008 (33) US
- (86) PCT/US2009/033380 06.02.2009
- (87) WO2009/102633 20.08.2009
- (73) Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province Line Road, Princeton, NJ 05843-4000, US
- (72) BACHAND, Carol, CA
- BELEMA, Makonen, US
- DEON, Daniel H., CA
- GOOD, Andrew C., US
- GOODRICH, Jason, US
- JAMES, Clint A., CA
- LAVOIE, Rico, CA
- LOPEZ, Omar D., US
- MARTEL, Alain, CA
- MEANWELL, Nicholas A., US
- NGUYEN, Van N., US
- ROMINE, Jeffrey Lee, US
- RUEDIGER, Edward H., CA
- SNYDER, Lawrence B., US
- ST. LAURENT, Denis R., US
- YANG, Fukang, US
- LANGLEY, David R., US
- WANG, Gan, US
- HAMANN, Lawrence G., US
- (74) Reitstötter - Kinzebach, Patentanwälte, Sternwartstrasse 4, 81679 München, DE
- Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
- (54) **HEPATĪTA C VĪRUSA INHIBITORI**
- HEPATITIS C VIRUS INHIBITORS**
- (57) 1. Savienojums ar formulu (I)



vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kur u un u' neatkarīgi ir 0, 1, 2 vai 3; D un D' katru neatkarīgi izvēlas no NR⁵, O un S; kur katru R⁵ neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma, alkoksikarbonilgrupas, alkilgrupas, arilalkoksikarbonilgrupas, karboksilgrupas, halogēnalkilgrupas, hidroksilgrupas, (NR^aR^b)karbonilgrupas un trialkilsililalkoksililgrupas; katru R¹ un R^{1'} neatkarīgi izvēlas no alkoksigrupas, alkoksialkilgrupas, alkoksikarbonilgrupas, alkilgrupas, arilalkoksikarbonilgrupas, karboksilgrupas, formilgrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, hidroksilgrupas, hidroksialkilgrupas, -NR^aR^b, (NR^aR^b)alkilgrupas un (NR^aR^b)karbonilgrupas; R² izvēlas no ūdeņraža atoma, alkoksikarbonilgrupas, alkilgrupas, arilalkoksikarbonilgrupas, karboksilgrupas, halogēnalkilgrupas un (NR^aR^b)karbonilgrupas; un

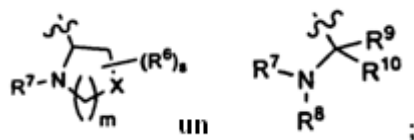
R³ izvēlas no ūdeņraža atoma, alkoksigrupas, alkoksialkilgrupas, alkoksikarbonilgrupas, alkilgrupas, arilalkoksikarbonilgrupas, karboksilgrupas, formilgrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, hidroksilgrupas, hidroksialkilgrupas, -NR^aR^b, (NR^aR^b)alkilgrupas un (NR^aR^b)karbonilgrupas; vai

R² un R³ kopā ar oglekļa atomiem, ar kuriem tie ir saistīti, veido piecu līdz sešu locekļu aromātisku vai nearomātisku gredzenu, kas neobligāti satur vienu vai divus heteroatomus, neatkarīgi izvēloties no slāpekļa, skābekļa un sēra, kur

piecu līdz astoņu locekļu gredzenu neobligāti aizvieto ar vienu, diviem vai trim aizvietotājiem neatkarīgi izvēloties no alkoksigrupas, alkoksialkilgrupas, alkoksikarbonilgrupas, alkilgrupas, alkilsulfonilgrupas, arilgrupas, arilalkilgrupas, arilsulfonilgrupas, karboksilgrupas, formilgrupas, halogēna atoma, halogēnalkoksigrupas, halogēnalkilgrupas, hidroksilgrupas, hidroksialkilgrupas, -NR^aR^b, (NR^aR^b)alkilgrupas, (NR^aR^b)karbonilgrupas, oksogrupas un spirocikla;

R² un R³ kopā ar oglekļa atomiem, ar kuriem tie ir saistīti, veido piecu līdz astoņu locekļu aromātisku vai nearomātisku gredzenu, kas neobligāti satur vienu vai divus heteroatomus, neatkarīgi izvēloties no slāpekļa atoma, skābekļa atoma un sēra atoma; kur piecu līdz astoņu locekļu gredzenu neobligāti aizvieto ar vienu, diviem vai trim aizvietotājiem, neatkarīgi izvēloties no alkoksigrupas, alkoksialkilgrupas, alkoksikarbonilgrupas, alkilgrupas, alkilsulfonilgrupas, arilgrupas, arilalkilgrupas, arilsulfonilgrupas, karboksilgrupas, formilgrupas, halogēna atoma, halogēnalkoksigrupas, halogēnalkilgrupas, hidroksilgrupas, hidroksialkilgrupas, -NR^aR^b, (NR^aR^b)alkilgrupas, (NR^aR^b)karbonilgrupas, oksogrupas un spirocikla;

R⁴ un R⁴ katru neatkarīgi izvēlas no



kur katrs m neatkarīgi ir 0, 1 vai 2;

katrs s neatkarīgi ir 0, 1, 2, 3 vai 4;

katru X neatkarīgi izvēlas no O, S, S(O), SO₂, CH₂, CHR⁶ un C(R⁶)₂; ar nosacījumu, ka, ja m ir 0, tad X izvēlas no CH₂, CHR⁶ un C(R⁶)₂;

katru R⁶ neatkarīgi izvēlas no alkoksigrupas, alkilgrupas, arilgrupas, halogēna atoma, halogēnalkilgrupas, hidroksilgrupas un -NR^aR^b, kur alkilgrupa neobligāti var veidot kondensētu trīs līdz sešu locekļu gredzenu ar blakus esošo oglekļa atomu, kur trīs līdz sešu locekļu gredzenu neobligāti aizvieto ar vienu vai divām alkilgrupām;

katru R⁷ neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma un R¹¹-C(O)-, un R¹¹-C(S)-;

R⁸ izvēlas no ūdeņraža atoma un alkilgrupas;

R⁹ un R¹⁰ katru neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma, alkenilgrupas, alkoksialkilgrupas, alkilgrupas, halogēnalkilgrupas un (NR^aR^b)alkilgrupas; vai

R⁹ vai R¹⁰ kopā ar oglekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido piecu vai sešu locekļu piesātinātu gredzenu, kas neobligāti satur vienu vai divus heteroatomus, izvēloties no NR², O un S; kur R² izvēlas no ūdeņraža atoma un alkilgrupas; un

katru R¹¹ neatkarīgi izvēlas no alkoksigrupas, alkoksialkilgrupas, alkoksikarbonilgrupas, alkoksikarbonilalkilgrupas, alkilgrupas, alkilkarbonilalkilgrupas, arilgrupas, arilalkenilgrupas, arilalkoksigrupas, arilalkilgrupas, ariloksialkilgrupas, cikloalkilgrupas, (cikloalkil)alkenilgrupas, (cikloalkil)alkilgrupas, cikloalkiloksialkilgrupas, halogēnalkilgrupas, heterociklilgrupas, heterociklilalkenilgrupas, heterociklilalkoksigrupas, heterociklilalkilgrupas, heterocikliloksialkilgrupas, hidroksialkilgrupas, -NR^aR^d, (NR^aR^d)alkenilgrupas, (NR^aR^d)alkilgrupas un (NR^aR^d)karbonilgrupas;

R^a un R^b neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma, alkenilgrupas un alkilgrupas;

R^c un R^d neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma, alkeniloksikarbonilgrupas, alkoksialkilkarbonilgrupas, alkoksikarbonilgrupas, alkilgrupas, alkilkarbonilgrupas, alkilsulfonilgrupas, arilgrupas, arilalkoksikarbonilgrupas, arilalkilgrupas, arilalkilkarbonilgrupas, arilkarbonilgrupas, ariloksikarbonilgrupas, arilsulfonilgrupas, cikloalkilgrupas, cikloalkilsulfonilgrupas, formilgrupas, halogēnalkoksikarbonilgrupas,

heterociklilgrupas, heterociklilalkoksikarbonilgrupas, heterociklilalkilgrupas, heterociklilalkilkarbonilgrupas, heterociklilkarbonilgrupas, heterocikliloksikarbonilgrupas, hidroksialkilkarbonilgrupas, (NR^aR^c)alkilgrupas, (NR^aR^c)alkilkarbonilgrupas, (NR^aR^c)karbonilgrupas, (NR^aR^c)sulfonilgrupas, -C(NCN)OR' un -C(NCN)NR^aR^y, kur R' izvēlas no alkilgrupas un neaizvietotas fenilgrupas un kur arilalkilgrupas, arilalkilkarbonilgrupas, heterociklilalkilgrupas un heterociklilalkilkarbonilgrupas alkilgrupas daļu neobligāti papildus aizvieto ar vienu -NR^aR^c grupu; un kur arilgrupu, arilalkoksikarbonilgrupas, arilalkilgrupas, arilalkilkarbonilgrupas, arilkarbonilgrupas, ariloksikarbonilgrupas un arilsulfonilgrupas arilgrupas daļu, heterociklilgrupu un heterociklilalkoksikarbonilgrupas heterociklilalkilgrupas, heterociklilalkilkarbonilgrupas, heterociklilkarbonilgrupas un heterocikliloksikarbonilgrupas heterociklilgrupas daļu neobligāti papildus aizvieto ar vienu, diviem vai trim aizvietotājiem, neatkarīgi izvēloties no alkoksigrupas, alkilgrupas, ciāngrupas, halogēna atoma, halogēnalkoksigrupas, halogēnalkilgrupas un nitrogrupas;

R^e un R^f neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma, alkilgrupas, neaizvietotas arilgrupas, neaizvietotas arilalkilgrupas, neaizvietotas cikloalkilgrupas, neaizvietotas (cikloalkil)alkilgrupas, neaizvietotas heterociklilgrupas, neaizvietotas heterociklilalkilgrupas, (NR^aR^y)alkilgrupas un (NR^aR^y)karbonilgrupas; un

R^x un R^y neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma, alkoksikarbonilgrupas, alkilgrupas, alkilkarbonilgrupas, neaizvietotas arilgrupas, neaizvietotas arilalkoksikarbonilgrupas, neaizvietotas arilalkilgrupas, neaizvietotas cikloalkilgrupas, neaizvietotas heterociklilgrupas un (NR^aR^y)karbonilgrupas, kur R^x un R^y neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma un alkilgrupas.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur D un D' katrs ir NR⁵.

3. Savienojums saskaņā ar 2. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur katru R⁵ neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma un hidroksilgrupas.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur u un u' katrs ir 0.

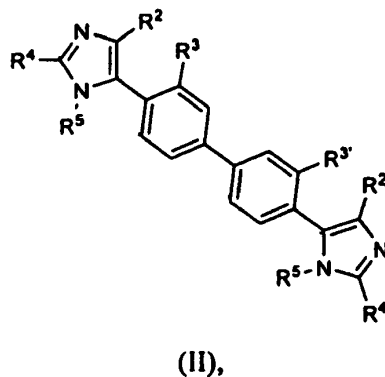
5. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur R² izvēlas no ūdeņraža atoma un halogēnalkilgrupas.

6. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur R³ izvēlas no ūdeņraža atoma un halogēna atoma.

7. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur R² un R³ kopā ar oglekļa atomu, ar kuru tie ir saistīti, veido sešu vai septiņu locekļu karbociklisku gredzenu.

8. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur R² un R³ kopā ar oglekļa atomiem, ar kuriem tie ir saistīti, veido sešu līdz astoņu locekļu gredzenu, kas neobligāti satur vienu heteroatomu, izvēloties no skābekļa atoma, slāpekļa atoma un sēra atoma, kur šo gredzenu neobligāti aizvieto ar vienu vai divām alkilgrupām.

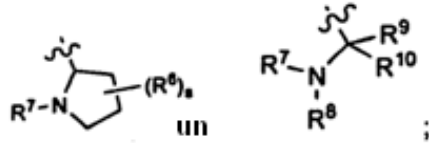
9. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu (II)



(II),

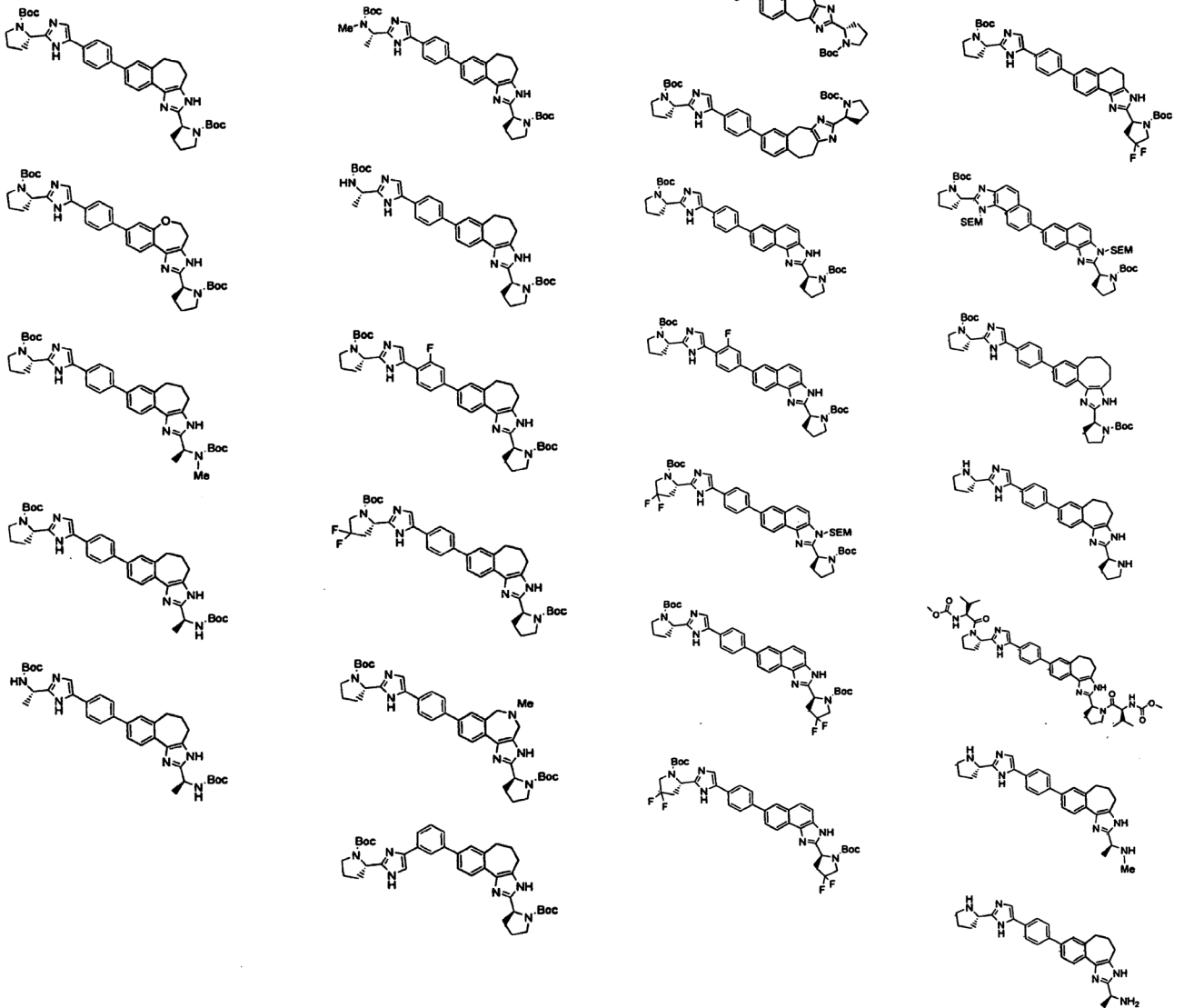
vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kur R² izvēlas no ūdeņraža atoma un halogēnalkilgrupas; un R³ izvēlas no ūdeņraža atoma un halogēna atoma; vai R² un R³ kopā ar oglekļa atomiem, ar kuriem tie ir saistīti, veido piecu vai sešu locekļu aromātisku vai nearomātisku karbociklisku gredzenu;

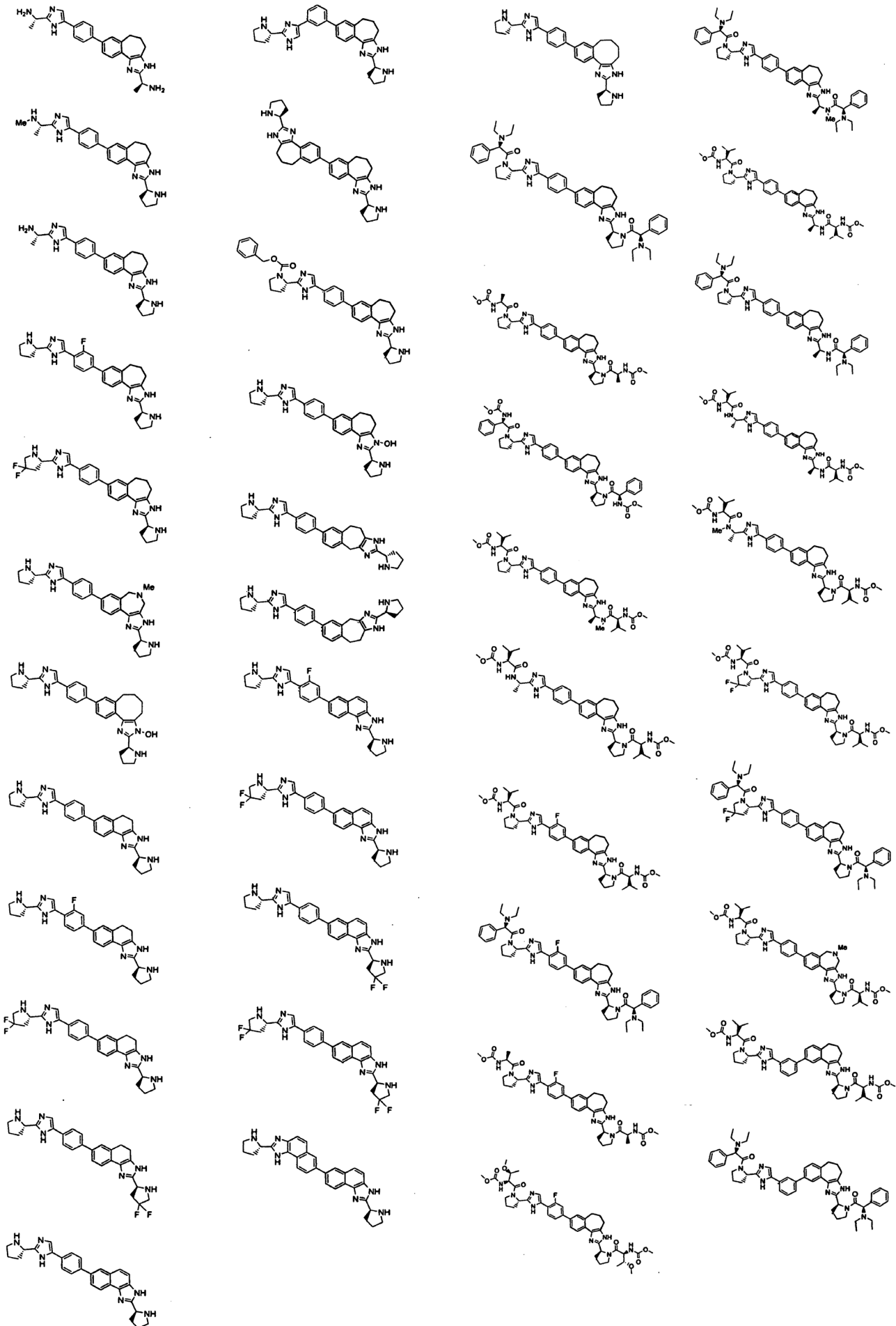
R² un R³ kopā ar oglekļa atomiem, ar kuriem tie ir saistīti, veido sešu līdz astoņu locekļu aromātisku vai nearomātisku gredzenu, kas neobligāti satur vienu heteroatomu, izvēloties no skābekļa atoma, slāpekļa atoma un sēra atoma; kur gredzenu neobligāti aizvieta ar vienu vai divām alkilgrupām; R⁴ un R⁴ katru neatkarīgi izvēlas no

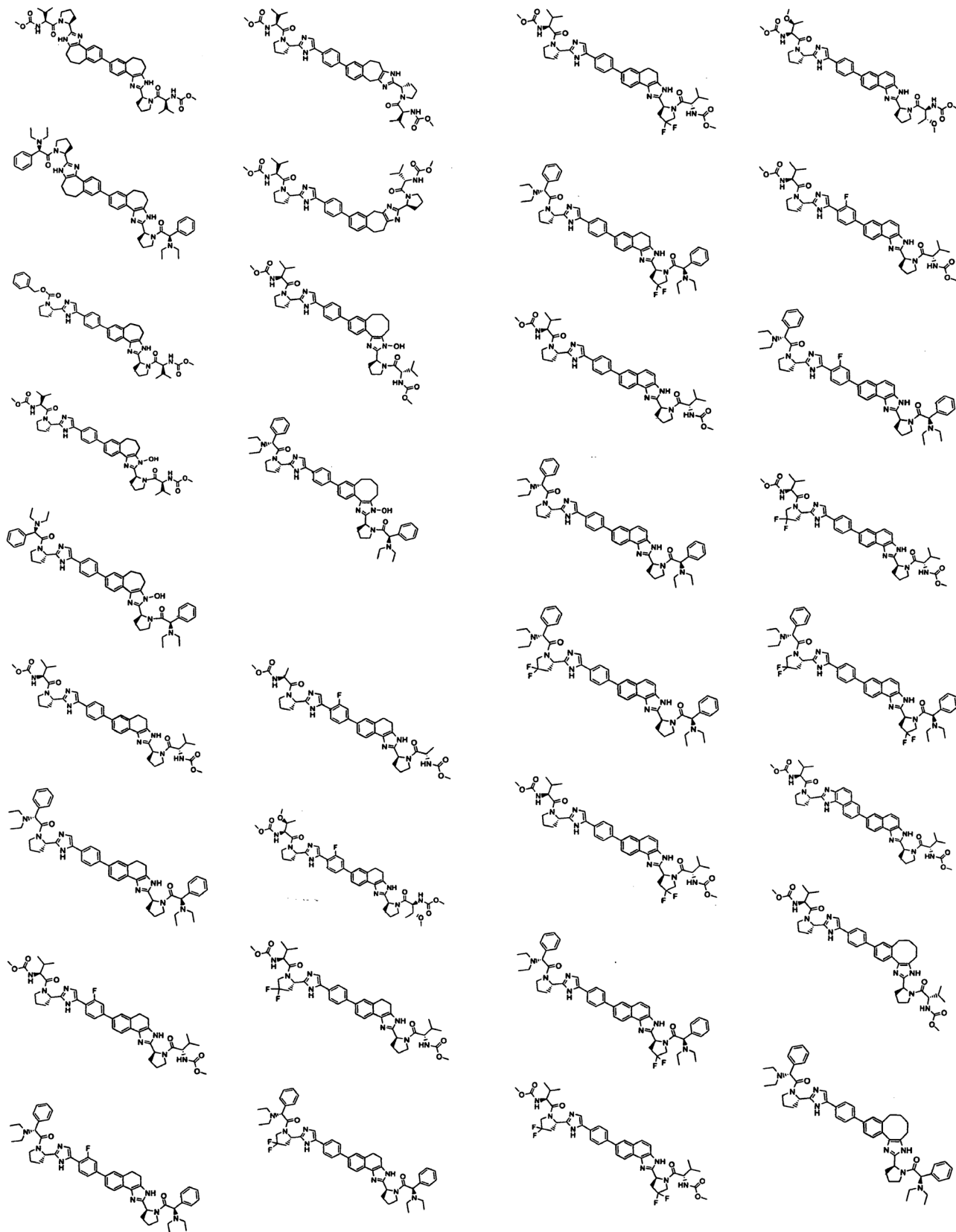


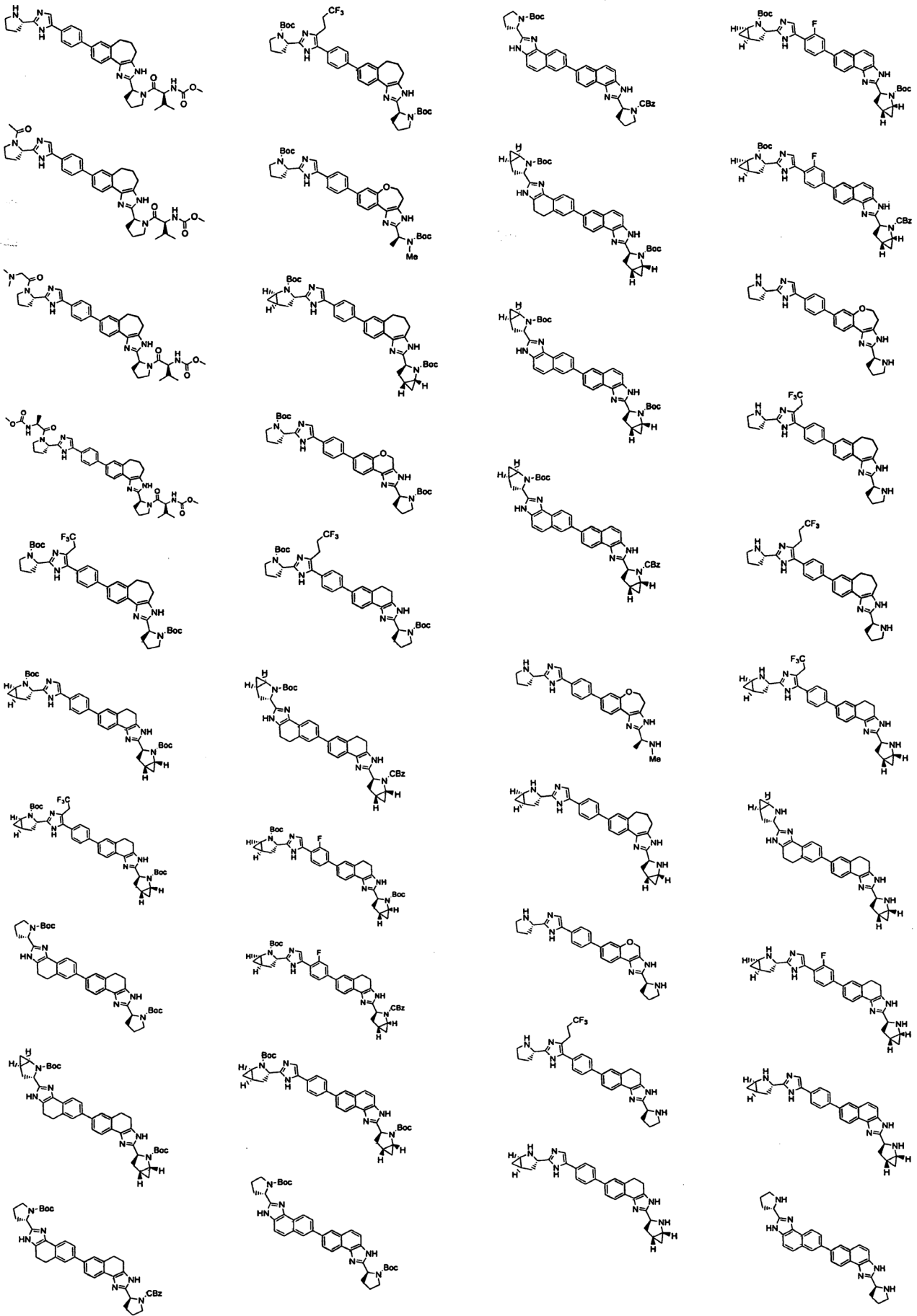
kur katrs s ir 0 vai 2;
 katru R⁶ neatkarīgi izvēlas no alkilgrupas un halogēna atoma, kur alkilgrupa veido kondensētu trīs locekļu gredzenu ar blakus esošo oglekļa atomu;
 katru R⁷ neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma un R¹¹-C(O)-;
 R⁸ izvēlas no ūdeņraža atoma un alkilgrupas;
 R⁹ un R¹⁰ katru neatkarīgi izvēlas no ūdeņraža atoma un alkilgrupas; un
 katru R¹¹ neatkarīgi izvēlas no alkilgrupas, arilalkoksigrupas, arilalkilgrupas un (NR²R³)alkilgrupas.

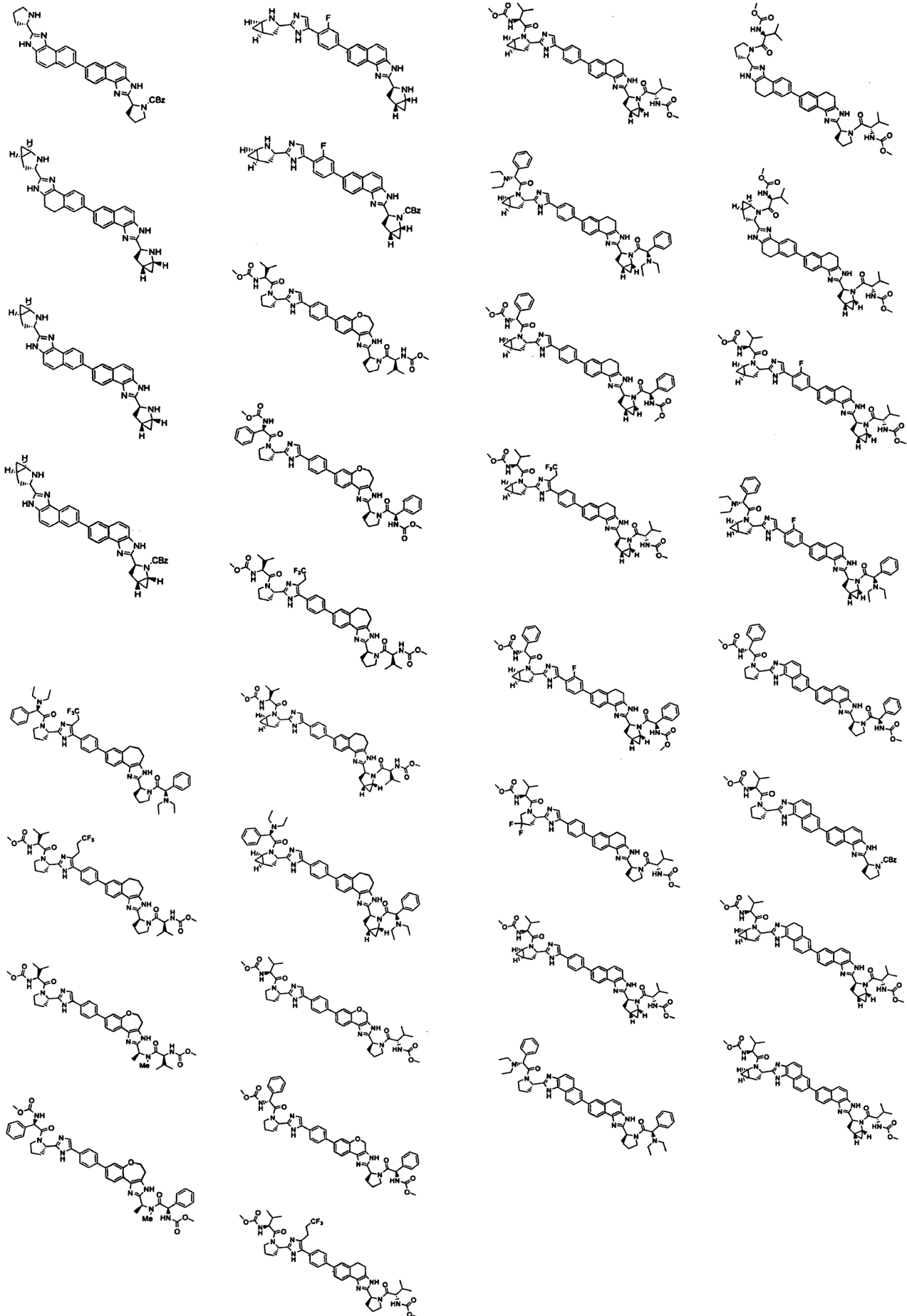
10. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, ko izvēlas no:

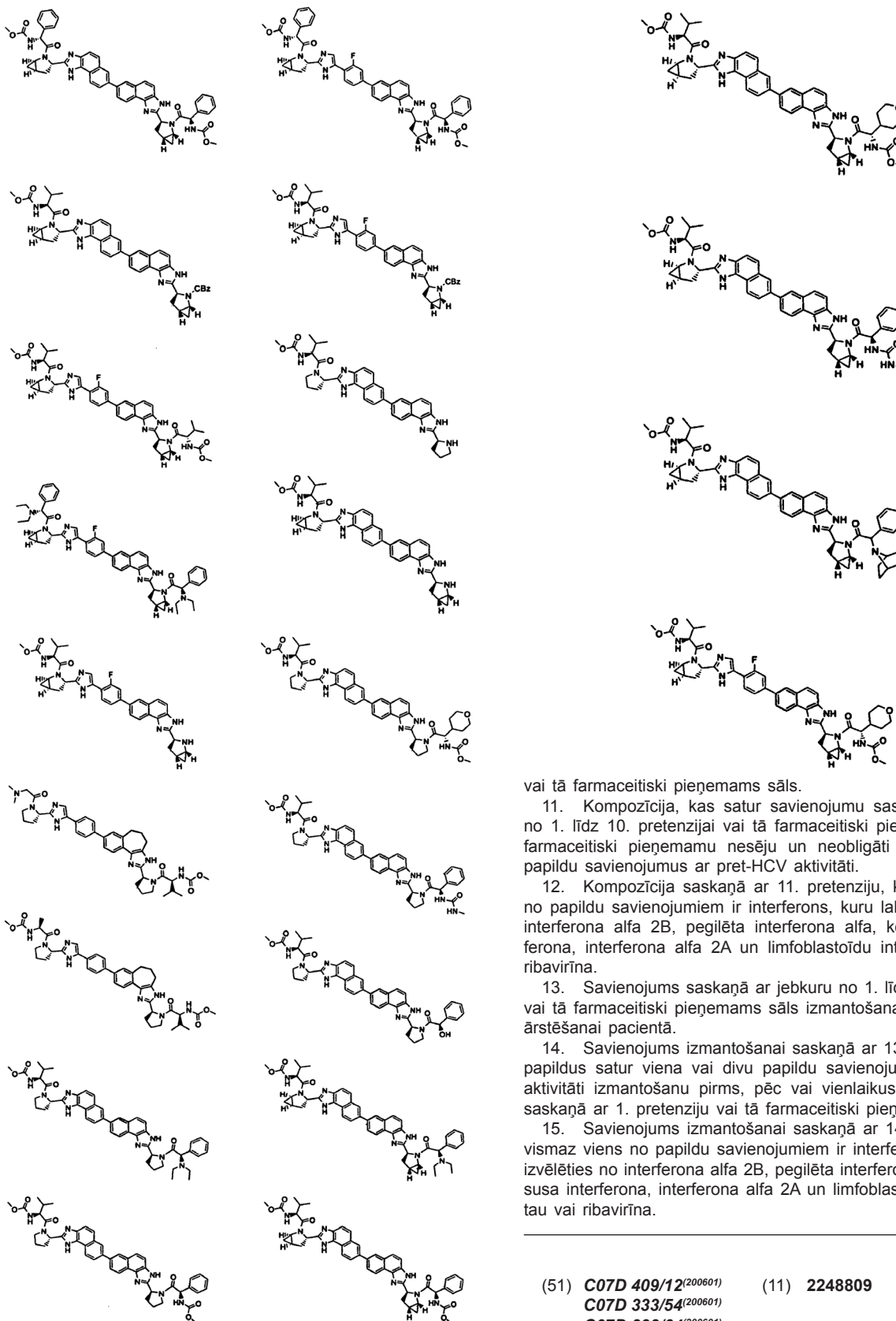












vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

11. Kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli un farmaceutiski pieņemamu nesēju un neobligāti vienu vai divus papildu savienojumus ar pret-HCV aktivitāti.

12. Kompozīcija saskaņā ar 11. pretenziju, kur vismaz viens no papildu savienojumiem ir interferons, kuru labāk izvēlēties no interferona alfa 2B, pegilēta interferona alfa, konsensusa interferona, interferona alfa 2A un limfoblastoīdu interferona tau vai ribavirīna.

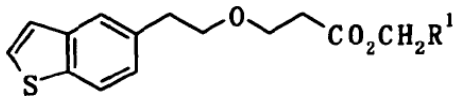
13. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 10. pretenzijai vai tā farmaceutiski pieņemams sāls izmantošanai HCV infekcijas ārstēšanai pacientā.

14. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 13. pretenziju, kas papildus satur vienu vai divu papildu savienojumu ar pret-HCV aktivitāti izmantošanu pirms, pēc vai vienlaikus ar savienojumu saskaņā ar 1. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli.

15. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 14. pretenziju, kur vismaz viens no papildu savienojumiem ir interferons, kuru labāk izvēlēties no interferona alfa 2B, pegilēta interferona alfa, konsensusa interferona, interferona alfa 2A un limfoblastoīdu interferona tau vai ribavirīna.

- | | | | |
|------|--|------|----------------|
| (51) | C07D 409/12 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | (11) | 2248809 |
| | C07D 333/54 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| | C07D 333/64 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | | |
| (21) | 10007872.4 | (22) | 27.03.2006 |
| (43) | 10.11.2010 | | |
| (45) | 09.05.2012 | | |
| (31) | 2005090831 | (32) | 28.03.2005 |
| | 2005174738 | | 15.06.2005 |
| | 2005206808 | | 15.07.2005 |
| | 2005230666 | | 09.08.2005 |
| (62) | 06730075.6 / 1 864 978 | (33) | JP |
| | | | JP |
| | | | JP |

- (73) TOYAMA CHEMICAL CO., LTD., 2-5, 3-chome, Nishishinjuku, Shinjuku-ku, Tokyo 160-0023, JP
 (72) SAITOH, Akihito, JP
 SUZUKI, Yoshiaki, JP
 YONEZAWA, Kenji, JP
 KAWAMURA, Mitsuhide, JP
 KUSANAGI, Takahiko, JP
 NAKAI, Takashi, JP
 (74) Blodig, Wolfgang, et al, Wächtershäuser & Hartz Patent-anwaltspartnerschaft, Ottostrasse 4, 80333 München, DE
 Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
 (54) **ALKYL-3-[2-(BENZO[B]TIOPHEN-5-IL)-ETOKSI]-PROPANOĀTI KĀ STARPPRODUKTI AZETIDIN-3-OLA ATVASINĀJUMU RAŽOŠANĀ**
ALKYL-3-[2-(BENZO[B]THIOPHEN-5-YL)-ETHOXY]-PROPANOATES AS INTERMEDIATES IN THE PRODUCTION OF AZETIDIN-3-OL DERIVATIVES
 (57) 1. Propionskābes estera atvasinājums, ko attēlo ar vispārīgo formulu:



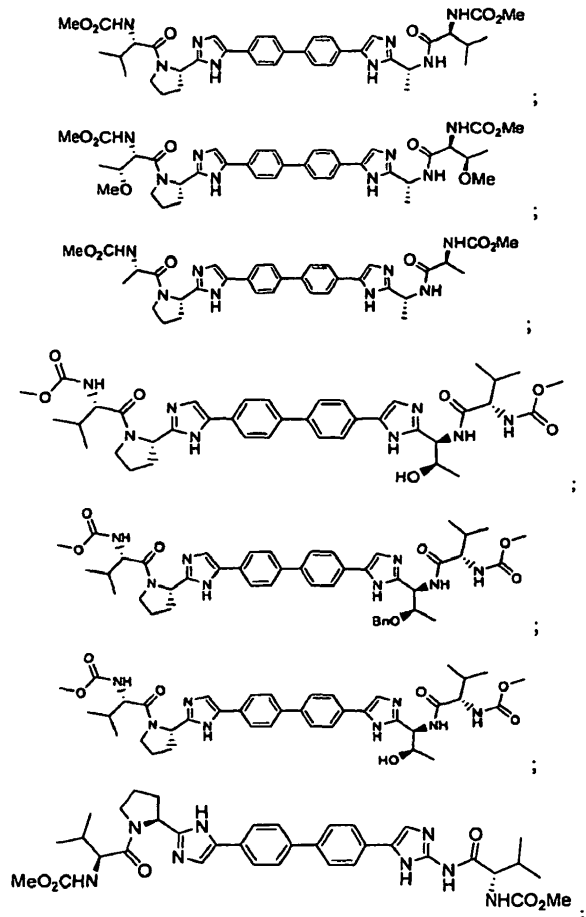
kurā R¹ attēlo ūdeņraža atomu vai neaizvietotu vai aizvietotu alkilgrupu, cikloalkilgrupu vai arilgrupu.

- (51) **C07D 403/10**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2250163**
C07D 403/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/4164⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 31/22⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
 (21) 08780411.8 (22) 12.02.2008
 (43) 17.11.2010
 (45) 28.03.2012
 (86) PCT/US2008/053638 12.02.2008
 (87) WO2009/102318 20.08.2009
 (73) Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province Line Road, Princeton, NJ 05843-4000, US
 (72) BACHAND, Carol, CA
 BELEMA, Makonen, US
 DEON, Daniel, H., CA
 GOOD, Andrew, C., US
 GOODRICH, Jason, US
 JAMES, Clint, A., CA
 LAVOIE, Rico, US
 LOPEZ, Omar, D., US
 MARTEL, Alain, CA
 MEANWELL, Nicholas, A., US
 NGUYEN, Van N., US
 ROMINE, Jeffrey, Lee, US
 RUEDIGER, Edward, H., CA
 SNYDER, Lawrence, B., US
 ST. LAURENT, Denis, R., US
 YANG, Fukang, US
 LANGLEY, David, R., US
 WANG, Gan, US
 HAMANN, Lawrence, G., US
 (74) Reitsstötter - Kinzebach, Patentanwälte, Sternwartstrasse 4, 81679 München, DE
 Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
 (54) **HEPATĪTA C VĪRUSA INHIBITORI**
HEPATITIS C VIRUS INHIBITORS

(57) 1. Savienojums, kas izvēlēts no
 dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1S)-2-metil-1,1-propāndiil)imino((2S)-1-okso-1,2-propāndiil)))biskarbamāta;
 dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1S)-2-metil-1,1-propāndiil)imino((2S,3R)-3-metoksi-1-okso-1,2-butāndiil)))biskarbamāta;
 dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1S)-2-metil-1,1-propāndiil)imino((2S)-3-metil-1-okso-1,2-butāndiil)))biskarbamāta;
 dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1S)-2-metil-1,1-propāndiil)imino((2S)-4-metoksi-1-okso-1,2-butāndiil)))biskarbamāta;

dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1R)-2-metil-1,1-propāndiil)imino((2S)-3-metil-1-okso-1,2-butāndiil)))biskarbamāta;
 dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1R)-2-metil-1,1-propāndiil)imino((2S)-1-okso-1,2-propāndiil)))biskarbamāta;
 dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1R)-2-metil-1,1-propāndiil)imino((2S)-4-metoksi-1-okso-1,2-butāndiil)))biskarbamāta;
 dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1R)-2-metil-1,1-propāndiil)imino((2S,3R)-3-metoksi-1-okso-1,2-butāndiil)))biskarbamāta;
 dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1R)-2-metil-1,1-propāndiil)imino((2R)-3-metil-1-okso-1,2-butāndiil)))biskarbamāta;
 dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1S)-2-metil-1,1-propāndiil)imino((2R)-3-metil-1-okso-1,2-butāndiil)))biskarbamāta;
 N²-(metoksikarbonil)-N-((1S)-1-(4-(4'-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-L-valil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-2-metilpropil)-L-valīnamīda;
 metil ((1S,2R)-2-metoksi-1-(((2S)-2-(4-(4'-(2-((1S)-1-((N-(metoksikarbonil)-O-metil-L-treonil)amino)-2-metilpropil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamāta;
 metil ((1S)-3-metoksi-1-(((2S)-2-(4-(4'-(2-((1S)-1-((N-(metoksikarbonil)-O-metil-L-homoseril)amino)-2-metilpropil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamāta;
 metil ((1S)-2-((2S)-2-(4-(4'-(2-((1S)-1-((N-(metoksikarbonil)-L-alanil)amino)-2-metilpropil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)-1-metil-2-oksoetil)karbamāta;
 N²-(metoksikarbonil)-N-((1R)-1-(4-(4'-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-L-valil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-2-metilpropil)-L-valīnamīda;
 metil ((1S,2R)-2-metoksi-1-(((2S)-2-(4-(4'-(2-((1R)-1-((N-(metoksikarbonil)-O-metil-L-treonil)amino)-2-metilpropil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamāta;
 metil ((1S)-3-metoksi-1-(((2S)-2-(4-(4'-(2-((1R)-1-((N-(metoksikarbonil)-O-metil-L-homoseril)amino)-2-metilpropil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamāta; un
 metil ((1S)-2-((2S)-2-(4-(4'-(2-((1R)-1-((N-(metoksikarbonil)-L-alanil)amino)-2-metilpropil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)-1-metil-2-oksoetil)karbamāta;
 vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

2. Savienojums, kas izvēlēts no:



vai tā farmaceutiski pieņemams sāls.

3. Kompozīcija, kas satur savienojumu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli, un farmaceutiski pieņemamu nesēju.

4. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kas papildus satur vienu vai divus papildu savienojumus ar pret-HCV iedarbību.

5. Kompozīcija saskaņā ar 4. pretenziju, kur vismaz viens no papildu savienojumiem ir interferons vai ribavirīns.

6. Kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, kur interferons ir izvēlēts no interferona alfa 2B, pegilēta alfa interferona, konsensusa interferona, alfa 2A interferona un limfoblastoīdu interferona tau.

7. Kompozīcija saskaņā ar 4. pretenziju, kur vismaz viens no papildu savienojumiem ir izvēlēts no interleikīna 2, interleikīna 6, interleikīna 12, savienojuma, kas veicina 1. tipa T-palīgšūnas atbildes attīstīšanos, interferējošās RNS, antisensa RNS, imikvimoda, ribavirīna, inozīna 5'-monofosfātdehidrogenāzes inhibitora, amantadīna un rimantadīna.

8. Kompozīcija saskaņā ar 4. pretenziju, kur vismaz viens no papildu savienojumiem ir efektīvs mērķa funkcijas inhibēšanā, mērķi izvēloties no HCV metālproteāzes, HCV serīna proteāzes, HCV polimerāzes, HCV helikāzes, HCV NS4B proteīna, HCV ieejas, HCV uzkrāšanās, HCV izejas, HCV NS5A proteīna un IMPDH HCV infekcijas ārstēšanai.

9. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemams sāls HCV infekcijas ārstēšanai pacientam.

10. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 9. pretenziju, kas papildus ietver vienu vai divu papildu savienojumu ar pret-HCV iedarbību izmantošanu pirms, pēc vai vienlaikus ar savienojumu saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli.

11. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 10. pretenziju, kur vismaz viens no papildu savienojumiem ir interferons vai ribavirīns.

12. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 11. pretenziju, kur interferons ir izvēlēts no interferona alfa 2B, pegilēta interferona alfa, konsensusa interferona, interferona alfa 2A un limfoblastoīdu interferona tau.

13. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 10. pretenziju, kur vismaz viens no papildu savienojumiem ir izvēlēts no interleikīna 2, interleikīna 6, interleikīna 12, savienojuma, kas veicina 1. tipa T-palīgšūnas atbildes attīstīšanos, interferējošās RNS, antisensa RNS, imikvimoda, ribavirīna, inozīna 5'-monofosfātdehidrogenāzes inhibitora, amantadīna un rimantadīna.

14. Savienojums izmantošanai saskaņā ar 10. pretenziju, kur vismaz viens no papildu savienojumiem ir efektīvs mērķa funkcijas inhibēšanā, mērķi izvēloties no HCV metālproteāzes, HCV serīna proteāzes, HCV polimerāzes, HCV helikāzes, HCV NS4B proteīna, HCV ieejas, HCV uzkrāšanās, HCV izejas, HCV NS5A proteīna un IMPDH HCV infekcijas ārstēšanai.

di: transportriteņa ierīce tiek piestiprināta konteineram, kura vērsta uz zemi; transportriteņa ierīce tiek piestiprināta pēc būtības zonas iekšpusē, kuru nosaka sānu sienas, kuras ir vērstas pret zemi; transportriteņa ierīce tiek piestiprināta konteineram, lai varētu griezties ap rotācijas asi, pie kam transportriteņa ierīce ir pagriežama vēlamajā transportēšanas virzienā; transportriteņa ierīce tiek nostiprināta spraugā (102) konteinerā stūrī, pie tam šī sprauga tiek izveidota sprostelementam (30), kuram ir fiksācijas ass (34), kas var pagriezt ap longitudinālo asi, un fiksācijas ass vienā galā ir gala posms (36), kurš ir salāgots ar spraugu (102) konteinerā stūrī,

raksturīga ar to, ka sprostelements (30) var tikt papildus pārvietots longitudinālās ass virzienā tā, ka konteinerā sienas plāte (104) tiek iespiesta starp fiksācijas ass (34) gala posmu (36) un rāmi (10).

2. Metode saskaņā ar 3. pretenziju, raksturīga ar to, ka transportriteņa ierīce tiek piestiprināta katrā konteinerā sienas stūrī, kurš ir vērsts pret zemi.

3. Konteinerā transportriteņa ierīce, kurai ir stūra posms ar spraugu (102) un sienas plati (104), kas aptver spraugu (102), pie kam transportriteņa ierīcei ir rāmis (10), vismaz viens ritenis (20a) un piestiprināšanas līdzekļi, lai to piestiprinātu pie konteinerā (100), pie tam: piestiprināšanas līdzekļi ir izveidoti tā, lai varētu rotēt ap rotācijas asi; piestiprināšanas līdzekļi satur sprostelementu (30) piestiprināšanai pie konteinerā sienas, kura ir vērsta pret zemi; sprostelements (30) satur fiksācijas asi (34), kas var rotēt ap longitudinālo asi, un vienā longitudinālās ass galā ir gala posms (36), kurš ir ielāgots spraugā (102) konteinerā stūrī,

raksturīga ar to, ka sprostelements (30) var tikt papildus pārvietots longitudinālās ass virzienā, un tādējādi konteinerā sienas plāte (104) tiek iespiesta starp fiksācijas ass (34) gala posmu (36) un rāmi (10).

4. Transportriteņa ierīce saskaņā ar 3. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka tā papildus satur atbalsta daļu (32) ar caurejošu caurumu fiksatora asij (34) un pamatni (12), kā arī satur dobu telpu rāmī (10), kurā tiek ievietota atbalsta daļa, lai tā varētu rotēt attiecībā pret rāmi.

5. Transportriteņa ierīce saskaņā ar 4. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka starp atbalsta daļu (32) un pamatni (12) ir izmantots balstgultnis (42).

6. Transportriteņa ierīce saskaņā ar 4. vai 5. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka balstgultnis (46) apņēms fiksācijas asi (34) starp atbalsta daļu (32) un gala elementu (36).

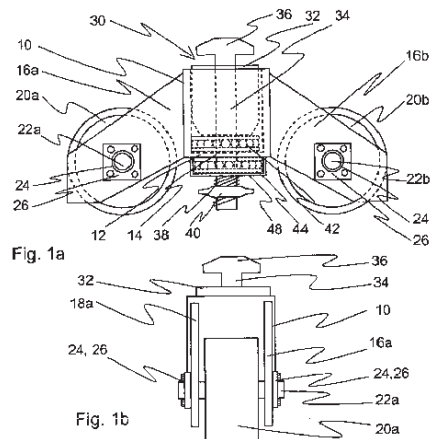
7. Transportriteņa ierīce saskaņā ar jebkuru no 3. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka tā satur divus riteņus (20a, 20b), kas novietoti rāmja (10) pretējās pusēs.

8. Transportriteņa ierīce saskaņā ar jebkuru no 4. līdz 6. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka viens ritenis (20a) ir novietots ekscentriski attiecībā pret rāmi (10) un ir vismaz viens gredzenveida gultnis (50, 52a) ap atbalsta daļu (32) starp rāmju iekšējo virsmu un atbalsta daļas ārējo virsmu.

9. Transportriteņa ierīce saskaņā ar 8. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka minētais gredzenveida gultnis (50, 52a) ir eļļas plēves balstgultnis, kura garums atbilst atbalsta daļas garumam.

- (51) **B65D 90/18**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2256066**
B65G 7/04⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 10163745.2 (22) 25.05.2010
- (43) 01.12.2010
- (45) 01.02.2012
- (31) 20095590 (32) 28.05.2009 (33) FI
- (73) Yski, Pasi, Prantinkatu 3 B 5, 32700 Huittinen, FI
- (72) Yski, Pasi, FI
- (74) Suominen, Kaisa Liisa, Turun Patenttitoimisto Oy, P.O. Box 99, 20521 Turku, FI
Guntis KAZAINIS, Mālkalnes prospekts 29-59, Ogre LV-5003, LV
- (54) **METODE TRANSPORTA STŪRES RATA IERĪCES PIESTIPRINĀŠANAI KONTEINERAM UN KONTEINERA TRANSPORTIEKĀRTA**
METHOD FOR ATTACHING A TRANSPORT WHEEL ARRANGEMENT TO A CONTAINER AND A TRANSPORT WHEEL ARRANGEMENT OF A CONTAINER

(57) 1. Metode atsevišķas transportriteņa ierīces, kas izveidota saskaņā ar 3. pretenziju, piestiprināšanai konteineram (100), kuram ir stūra posms ar spraugu (102) un sienas plāte (104), kas aptver spraugu (102), pie kam: saskaņā ar piedāvāto meto-



- (51) **F16L 13/00**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2258972**
F16L 13/11⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
F16L 23/024⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
B23P 11/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 10005832.0 (22) 06.06.2010
(43) 08.12.2010
(45) 09.05.2012
(31) 102009024126 (32) 06.06.2009 (33) DE
(73) Thoni, Lothar, Lauf-Tegg-Strasse 6, 9108 Jakobsbad, CH
(72) THONI, Lothar, CH
(74) Patentanwältte Bitterich, Dr. Keller, Schwertfeger, Westring 17, 76829 Landau, DE
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV
- (54) **DETAĻA AR ATLOKU UN TĀS IZGATAVOŠANAS PAŅĒMIENS**
COMPONENT WITH FLANGE AND METHOD FOR PRODUCTION OF SAME

(57) 1. Detaļa (1) ar caurules daļu (4) un ar vismaz vienu atloku (2), kas satur atloka savienotājdaļu (3), kura veido presētas sēžas savienojumu ar detaļas (1) caurules daļu (4) un atloka apkakli (5), kas virzienā radiāli uz āru robežojas ar atloka savienotājdaļu (3), pie kam atloka manšete ar stiprinājuma līdzekļiem var būt piestiprināta pie citas detaļas, lai veidotu savienojumu starp abām detaļām,

kas raksturīga ar to, ka kontaktsavienojumā, kas ir saistīts ar presētas sēžas savienojumu, starp atloka savienotājdaļu (3) un caurules daļu (4) ir izveidota vismaz viena rievā (7), kas stiepjas apkārt atloka (2) longitudinālajai asij (L), pie kam: rievā caur uzpildes atveri (8), kas ir caurejoša uz ārpusi, var tikt aizpildīta ar blīvējošu materiālu (9), lai veidotu hermētisku presētas sēžas savienojumu; atloka savienotājdaļas (3) un caurules daļas (4) apgabali sāniski robežojas ar rievu (7), pie tam minētie apgabali viens ar otru veido presētas sēžas savienojumu visā rievas (7) garumā.

2. Detaļa saskaņā ar 1. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka rievā (7) ir izvietota atloka savienotājdaļas (3) iekšējā sienā (6), veidojot presētas sēžas savienojumu ar detaļas (1) caurules daļu (4).

3. Detaļa saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka ventilācijas atvere (10), kas ir caurejoša uz ārpusi, iziet uz vismaz vienu rievu (7).

4. Detaļa saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka vismaz viena rievā (7) ir izveidota kā gredzenveida rievā (11', 11").

5. Detaļa saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka vismaz viena rievā (7) ir izveidota kā spirālveida rievā (12).

6. Detaļa saskaņā ar 5. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka spirālveida rievas viens vaļējais gals (12) sākas pirmajā gredzenveida rievā (11') un/vai spirālveida rievas (12) otrs vaļējais gals sākas otrajā gredzenveida rievā (11").

7. Detaļa saskaņā ar 6. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka uzpildes atvere (8) no ārpusi ir vaļēja pirmajā gredzenveida rievā (11'), un ventilācijas atvere (10) no ārpusi ir vaļēja otrajā gredzenveida rievā (11").

8. Detaļa saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka blīvējošais materiāls (9) ir veidots no epoksīdsveķu bāzes kā divkomponentu saistviela.

9. Detaļa saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka blīvējošā materiāla viskozitāte ir lielāka par 10⁷ mPa*s.

10. Detaļa saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 9. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka atloka (2) iekšējais diametrs izvēršas iekšup no atloka savienotājdaļas (3) iekšējā diametra (D) kā pakāpiens (20) presētas sēžas savienojumā ar caurules daļu (4), pie kam minētais pakāpiens (20) veido caurules daļas (4) gala plaknes longitudinālu aizturi (16).

11. Detaļa saskaņā ar 10. pretenziju, kas raksturīga ar to, ka blīvējošais elements, tāds kā O-veida gredzens (24), ir ievietots starp atloka (2) iekšup vērsto pakāpienu (20) un caurules daļas (4) gala virsmu.

12. Detaļa saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 11. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka starp detaļas (1) caurules daļu (4) un atloka

savienotājdaļu (3) ir aprīkota ar vismaz vienu papildu blīvi, tādu kā O-veida gredzens.

13. Paņēmiens saspiestu gaisu necaurlaidīga savienojuma izveidošanai starp detaļu (1), it īpaši caurules vai apvalka daļu, un atloku (2), pie kam atloks (2) satur atloka savienotājdaļu (3), kura ir jāsavieno ar detaļas (1) caurules daļu (4) un atloka manšeti, (5), kas ir izvietota radiāli uz āru, kura īstenošanai tiek veikti sekojoši soļi:

a) rievas izveidošana (7) atloka savienotājdaļas (3) iekšējā sienā (6), pie kam rievā (7) stiepjas apkārt atloka (2) longitudinālajai asij (L),

b) detaļas (1) montāža pozicionāli stabilā veidā tā, ka tās caurules daļa (4) stiepjas iepriekšnoteiktas ass (A) virzienā,

c) atloka (2) iespiļēšana elementa (13) aksiālās novirzes rezultātā,

d) atloka (2) longitudinālās ass (L) koaksiāla salāgošana ar detaļas (1) caurules daļas (4) longitudinālo asi (A),

e) atloka (2) karsēšana, lai atloka savienotājdaļas (3) iekšējais perimetrs palielinātos,

f) atloka savienotājdaļas (3) uzspiešana uz detaļas (1) caurules daļas (4) gala longitudinālās ass virzienā, izmantojot minēto aksiālās novirzes elementu (13), tā, ka vismaz atloka savienotājdaļas (3) pagarinājuma apgabals (S), kas ir aprīkots ar rievu (7), daļēji nosedz caurules daļu (4),

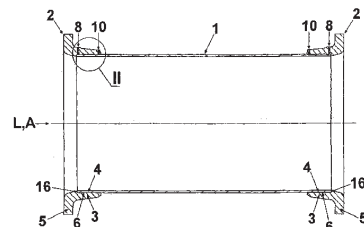
g) atloka (2) atdzesēšana, izveidojot presētas sēžas savienojumu starp atloku (2) un detaļu (1), pie kam atloka savienotājdaļas (3) un caurules daļas (4) apgabali laterāli robežojas ar rievu (7), kas cita ar citu veido presētas sēžas savienojumu visā rievas (7) garumā,

h) šķidra vai pastveida blīvējošā materiāla (9) ievadīšana rievā (7), pie kam blīvējošais materiāls (9) pēc tam veido sasaistošo savienojumu starp atloka savienotājdaļu (3) un detaļas (1) caurules daļu (4),

i) atloka (2) iespiļējuma atbrīvošanu novirzes elementā (13).

14. Paņēmiens saskaņā ar 13. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka atloka (2) karsēšana solī e) tiek veikta ar indukcijas sildītāju (15).

15. Paņēmiens saskaņā ar 13. vai 14. pretenziju, kas raksturīgs ar to, ka solī h) blīvējošais materiāls (9) tiek ievadīts rievā (7) no ārpusi caur uzpildes atveri (8).



Figur 1

- (51) **E01B 7/24**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2260149**
(21) 09717022.9 (22) 09.03.2009
(43) 15.12.2010
(45) 21.03.2012
(31) 102008013236 (32) 07.03.2008 (33) DE
(86) PCT/EP2009/052703 09.03.2009
(87) WO2009/109664 11.09.2009
(73) Triple S GmbH, Ringstraße 40, 82223 Eichenau, DE
(72) FUNKE, Michael, DE
FRENZEL, Tim, DE
(74) Wablat Lange Karthaus, Anwaltssozietāt, Potsdamer Chaussee 48, 14129 Berlin, DE
Vladimirs ANOHINS, Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010, LV
- (54) **PĀRMIJU APSILDĪŠANAS SISTĒMA**
SWITCH HEATING SYSTEM

(57) 1. Apsildes sistēma pārmiju sliežu, kuras ietver pārmijas sākumā (WA) sākošās rāmja sliedes un pārslēgšanas sliedes ar galvu, tiltiņu un pēdu, apsildīšanai ar apsildīšanas līniju, kurai cauri plūst šķidrums un kuru vismaz ar vienu sienu var novest siltumvades kontaktā ar sliedes daļu, pie tam tā ir savienota ar

līnijas sistēmu, kas saņem siltumu no siltuma avota ar cirkulējoša šķidrums palīdzību,

kas raksturīga ar to, ka ir aprīkota ar metālisku īpašas formas detaļu (30), kura no pārmijas sākuma (WA) pārslēgšanas ierīces rajonā var tikt piestiprināta pie vismaz vienas sliedes (1, 2, 11, 12) pārsedzes (42) ārpusē, pie kam pārsedzē (42) no pārmijas projām vērstajā pusē ir vismaz viena apsildīšanas līnijas aptvere (31, 32), kas var tikt piespiesta pie sliedes un sastāv no siltuma pievades līnijas (24) un siltuma aizvades (23) līnijas.

2. Apsildes sistēma atbilstoši 1. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka metāliskā īpašas formas detaļa (30) var tikt piestiprināta pie pārslēgšanas sliedes (2, 12) no rāmja sliedes (1, 11) projām vērstajā pusē un/vai pie rāmja sliedes (1, 11) tās ārpusē distancēti no pārmijas sākuma (WA).

3. Apsildes sistēma atbilstoši 1. vai 2. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka īpašas formas detaļa (30) katrā no tām ietver divas aptveres (31, 32) apsildīšanas līnijas siltuma pievades līnijai (24) un siltuma aizvades līnijai (23).

4. Apsildes sistēma atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka īpašas formas detaļa (30) sastāv no siltumu vadoša metāla, vēlams no alumīnija.

5. Apsildes sistēma atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka īpašas formas detaļa (30) ir ekstrūzijas ceļā izgatavota detaļa.

6. Apsildes sistēma atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka īpašas formas detaļa (30) ar pārsedzi (42) ir savienota ar siltumu vadošu materiālu, kuram ir adhezīvas īpašības.

7. Apsildes sistēma atbilstoši jebkurai no iepriekšējām pretenzijām, kas raksturīga ar to, ka īpašas formas detaļa (30), ieskaitot apsildīšanas līnijas siltuma pievades līniju (24) un siltuma aizvades līniju (23), *in situ* no ārpusē tiek pārklāta ar izolējošu materiālu (35, 36).

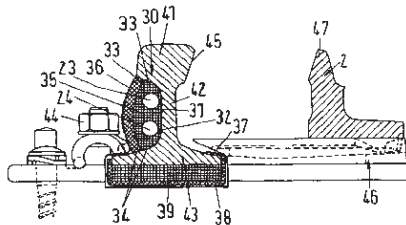
8. Apsildes sistēma atbilstoši 7. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka rāmja sliedes (1, 11) pēda (43) ir aprīkota ar siltumizolāciju.

9. Apsildes sistēma atbilstoši 7. vai 8. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka kā izolācija ir izmantots gumijas veida ārējais slānis (36, 38) ar tajā ievadītām cietām putām (35, 39).

10. Apsildes sistēma atbilstoši jebkurai no 7. līdz 9. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka cietās putas (35) līnijas siltuma pievades līnijas (24) un siltuma aizvades līnijas (23) zonā var tikt uzklātas *in situ*.

11. Apsildes sistēma atbilstoši jebkurai no 7. līdz 10. pretenzijai, kas raksturīga ar to, ka izolācija (38, 39) sliedes pēdai (43) tiek iepriekš izgatavota atsevišķi.

12. Apsildes sistēma atbilstoši jebkurai vienai vai vairākām iepriekšējām pretenzijām ar pamatplates (80) slīdes paliktņiem (46) un sašaurinātu slīdes paliktņu plāti (81), kas saistīta ar pārmijas nazi (6) pārvietojamās pārslēgšanas sliedes (2, 12) atbalstīšanai, kas raksturīga ar to, ka slīdes paliktņa (46) sašaurinātā daļa (83) ir izveidota noslēgšanai ar plāksni (82), un blakusesošo slīdes paliktņu paralēlās sašaurinātās daļas (83) slīdes paliktņa apsildīšanai var tikt sapārotas viena ar otru caur apsildīšanas līnijām (23, 24).



- (51) **C07K 14/715⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2267024**
- C12P 21/02⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**
- (21) 10184728.3 (22) 01.06.2006
- (43) 29.12.2010
- (45) 09.05.2012
- (31) 687631 P (32) 03.06.2005 (33) US
- 05104878 03.06.2005 EP
- 05106429 13.07.2005 EP

- (62) 06763472.5 / 1 885 753
- (73) ARES TRADING S.A., Zone Industrielle de l'Ourietaz, 1170 Aubonne, CH
- (72) WIEBER, Urs, CH
- ZIEGLER, Thierry, FR
- (74) Weiss, Wolfgang, Weickmann & Weickmann Patentanwälte, Richard-Strauss-Strasse 80, 81679 München, DE
- Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV

(54) **REKOMBINANTA IL-18 SAISTOŠĀ PROTEĪNA RAŽOŠANA**
PRODUCTION OF RECOMBINANT IL-18 BINDING PROTEIN

(57) 1. Paņēmiens rekombinanta interleikīnu-18 saistošā proteīna (IL-18BP) producēšanai Ķīnas kāmjā olnīcu (CHO) šūnās bioreaktorā bezseruma kultivēšanas apstākļos, pie kam paņēmiens ir paņēmiens ar piebarošanu, kas ietver šādus soļus:

- a) šūnu pavairošanas fāzi 37°C;
- b) eventuali, starpfāzi 33°C;
- c) producēšanas fāzi 29°C.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, pie kam kopējais šūnu blīvums producēšanas fāzē svārstās no 4 līdz 8 x 10⁶ šūnām mililitrā dienā.

3. Paņēmiens saskaņā ar 2. pretenziju, pie kam kopējais šūnu blīvums producēšanas fāzē svārstās no 4 līdz 8 x 10⁶ šūnām mililitrā dienā vismaz 10 dienas ilgi šūnu kultūras pastāvēšanas laikā.

4. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, pie kam dzīvotspēja svārstās starp 100 un 80 %.

5. Paņēmiens saskaņā ar 4. pretenziju, pie kam dzīvotspēja svārstās starp 100 un 80 % vismaz 10 dienas ilgi šūnu kultūras pastāvēšanas laikā.

6. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, pie kam proteīna produktivitāte ir augstāka par apmēram 150 mg vai apmēram 350 mg litrā dienā.

7. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kas turklāt ietver šūnu kultūras supernatanta savākšanas soli.

8. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kas turklāt ietver IL-18BP attīrīšanas soli.

9. Paņēmiens saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kas turklāt ietver soli, kurā IL-18BP tiek iestrādāts farmaceitiskā kompozīcijā.

- (51) **C07D 401/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾** (11) **2274297**
- C07D 403/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**
- C07D 405/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**
- C07D 413/14⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**
- C07D 417/12⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**
- C07F 7/18⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**
- A61K 31/41⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**
- A61K 31/4155⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**
- A61K 31/427⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**
- A61K 31/44⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**
- A61K 31/497⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**
- A61P 3/10⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾**

- (21) 09732665.6 (22) 06.04.2009
- (43) 19.01.2011
- (45) 09.05.2012
- (31) 45370 P (32) 16.04.2008 (33) US
- 145761 P 20.01.2009 US
- (86) PCT/EP2009/054067 06.04.2009
- (87) WO2009/127546 22.10.2009
- (73) F. Hoffmann-La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH

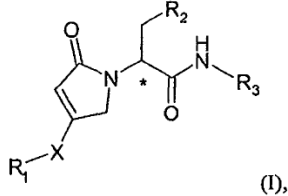
- (72) BERTHEL, Steven, Joseph, US
- BRINKMAN, John, A., US
- HAYDEN, Stuart, US
- HAYNES, Nancy-Ellen, US
- KESTER, Robert, Francis, US
- McDERMOTT, Lee, Apostle, US
- QIAN, Yimin, US
- SARABU, Ramakanth, US

SCOTT, Nathan, Robert, US
TILLEY, Jefferson, Wright, US

(74) Waschbüsch, Klaus, F. Hoffmann-La Roche AG,
124 Grenzacherstrasse, 4070 Basel, CH
Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082,
LV

(54) **PIROLIDINONA GLIKOKINĀZES AKTIVATORI
PYRROLIDINONE GLUCOKINASE ACTIVATORS**

(57) 1. Savienojumi ar formulu (I):



(I),

kurā:

X ir O, NH vai N(C₁₋₉alkil)grupa;

R₁ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no

- C₁₋₉alkilgrupas,
- C₁₋₉alkoksi-C₁₋₉alkilgrupas,
- cikloalkilgrupas,
- CH₂-cikloalkilgrupas,
- heterociklilgrupas,
- arilgrupas, neaizvietotas vai mono-, bi- vai triaizvietotas neatkarīgi ar C₁₋₉alkilgrupu, C₂₋₉alkenilgrupu, hidroksilgrupu, -NH₂, halogēna atomu, C₁₋₉alkoksigrupu, -CF₃, -OCF₃, -S(CH₃), -S(O)₂CH₃, -CH₂-arilgrupu, heteroarilgrupu, ciāngrupu, C₁₋₉alkanoilgrupu, -O-arilgrupu, -O-CH₂-arilgrupu, -N(CH₃)₂, cikloalkilgrupu, heterociklilgrupu, -C(O)-heterociklilgrupu vai C₁₋₉alkilgrupu, mono- vai biaizvietotu ar hidroksilgrupu,

- CH₂-arilgrupas,
- heteroarilgrupas, neaizvietotas vai aizvietotas ar C₁₋₉alkilgrupu vai halogēna atomu,
- 1-metil-1H-indazol-4-ilgrupas,
- benzoksazol-4-ilgrupas
- 2-metil-benzoksazol-4-ilgrupas,
- 2,3-dihidro-benzo[1,4]dioksin-5-ilgrupas,
- 2,3-dihidro-benzo[1,4]dioksin-2-ilmetilgrupas
- 5,6,7,8-tetrahidro-naftil-1 grupas,
- naftil-1 grupas un
- izohinolinilgrupas;

R₂ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no

- C₁₋₉alkilgrupas vai C₁₋₉alkilgrupas, mono- vai biaizvietotas ar hidroksilgrupu,
- halogēn-C₁₋₉alkilgrupas,
- C₁₋₉alkoksi-C₁₋₉alkilgrupas vai C₁₋₉alkilsulfanilalkilgrupas,
- C₁₋₉alkoksigrupas,
- cikloalkilgrupas, neaizvietotas vai mono- vai biaizvietotas neatkarīgi ar halogēna atomu vai C₁₋₉alkilgrupu,
- heterociklilgrupas,
- arilgrupas, neaizvietotas vai mono- vai biaizvietotas neatkarīgi ar halogēna atomu un
- heteroarilgrupas, kurai ir vismaz viens gredzena heteroatoms, kas ir vai nu O, vai S; un

R₃ ir neaizvietota vai aizvietota heteroarilgrupa, kas savienota ar gredzena oglekļa atomu pie redzamās amīngrupas ar vienu heteroatomu, kas ir slāpekļa atoms, kurš ir blakus saistīts gredzena oglekļa atomam, pie tam minētā aizvietotā heteroarilgrupa ir aizvietota pozīcijā, kas nav blakus minētajam saistītajam oglekļa atomam, neatkarīgi ar grupu, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no C₁₋₉alkilgrupas, halogēna atoma, C₁₋₉alkoksikarbonilgrupas, ciāngrupas, karboksilgrupas, cikloalkilgrupas, arilgrupas, 2-okso-oksazolidin-5-ilmetilgrupas, -N(C₁₋₉alkil)₂ grupas, 2,2,-dimetil-[1,3]dioksolan-4-ilgrupas, -CH₂-dimetil-[1,3]dioksolanilgrupas, t-butil-dimetil-silaniloksietilgrupas, neaizvietotas -CH₂-arilgrupas, -CH₂-arilgrupas, aizvietotas ar ciāngrupu vai C₁₋₉alkoksigrupu, heterociklilgrupas, -CH₂-heterociklilgrupas, -6-(CH₂)₂-2,2-dimetil-[1,3]dioksan-4-il-etīlškābes *terc*-butilestera un C₁₋₉alkilgrupas, mono-, bi- vai triaizvietotas neatkarīgi ar hidroksilgrupu, halogēna atomu, C₁₋₉alkoksigrupu, -N(C₁₋₉alkil)₂grupu, -NH₂, C₁₋₉alkanoilgrupu, C₁₋₉alkoksikarbonilgrupu, C₂₋₉alkeniloksikarbonilgrupu, karboksilgrupu, aminokarbonilgrupu vai C₁₋₉alkoksikarbonilaminogrupu,

un kurā

"cikloalkilgrupa" nozīmē vienvērtīgu mono- vai polikarboicikliskas grupas aizvietotāju no trīs līdz desmit oglekļa atomiem, "heterociklilgrupa" nozīmē mono- vai policiklisku, piesātinātu gredzenu, kurā viens, divi vai trīs oglekļa atomi ir aizvietoti ar tādu heteroatomu, kā N, O vai S, "arilgrupa" nozīmē aromātisku mono- vai polikarboiciklisku grupu no 6 līdz 12 oglekļa atomiem, saturot vismaz vienu aromātisku gredzenu, un "heteroarilgrupa" nozīmē aromātisku mono- vai policiklisku grupu no 5 līdz 12 atomiem, saturot vismaz vienu aromātisku gredzenu, kas satur vienu, divus vai trīs gredzena heteroatomus, kas izvēlēti no N, O un S,

vai farmaceutiski pieņemams tā sāls.

2. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kurā X ir O.

3. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kurā X ir NH vai N(C₁₋₉alkil)grupa.

4. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kurā R₁ ir fenilgrupa, neaizvietota vai mono-, bi- vai triaizvietota neatkarīgi ar C₁₋₉alkilgrupu, C₂₋₉alkenilgrupu, hidroksilgrupu, -NH₂, halogēna atomu, C₁₋₉alkoksigrupu, -CF₃, -OCF₃, -S(CH₃), -S(O)₂CH₃, -CH₂-arilgrupu, heteroarilgrupu, ciāngrupu, C₁₋₉alkanoilgrupu, -O-arilgrupu, -O-CH₂-arilgrupu, -N(CH₃)₂, cikloalkilgrupu, heterociklilgrupu, -C(O)-heterociklilgrupu vai C₁₋₉alkilgrupu, mono- vai biaizvietotu ar hidroksilgrupu.

5. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kurā R₁ ir fenilgrupa, mono-, bi- vai triaizvietota neatkarīgi ar C₁₋₉alkilgrupu, C₂₋₉alkenilgrupu, hidroksilgrupu, -NH₂, halogēna atomu, C₁₋₉alkoksigrupu, -CF₃, -OCF₃, -S(CH₃), -ciāngrupu, -O-benzilgrupu, -N(CH₃)₂, cikloalkilgrupu, pirolidinilgrupu vai C₁₋₉alkilgrupu, mono- vai biaizvietotu ar hidroksilgrupu.

6. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kurā R₂ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no

- C₁₋₉alkilgrupas vai C₁₋₉alkilgrupas, mono- vai biaizvietotas ar hidroksilgrupu,
- halogēn-C₁₋₉alkilgrupas,
- C₁₋₉alkoksi-C₁₋₉alkilgrupas vai C₁₋₉alkilsulfanilalkilgrupas,
- C₁₋₉alkoksigrupas,
- cikloalkilgrupas, neaizvietotas vai mono- vai biaizvietotas neatkarīgi ar halogēna atomu vai C₁₋₉alkilgrupu,
- heterociklilgrupas un
- arilgrupas, neaizvietotas vai mono- vai biaizvietotas neatkarīgi ar halogēna atomu.

7. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kurā R₂ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no

- C₁₋₉alkilgrupas vai C₁₋₉alkilgrupas, mono- vai biaizvietotas ar hidroksilgrupu,
- halogēn-C₁₋₉alkilgrupas,
- C₁₋₉alkoksi-C₁₋₉alkilgrupas vai C₁₋₉alkilsulfanilalkilgrupas,
- C₁₋₉alkoksigrupas,
- cikloalkilgrupas, neaizvietotas vai mono- vai biaizvietotas neatkarīgi ar halogēna atomu vai C₁₋₉alkilgrupu un
- heterociklilgrupas.

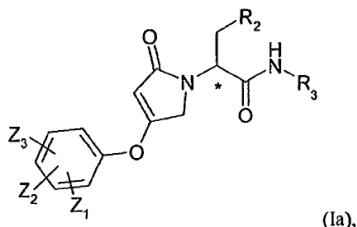
8. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 7. pretenzijai, kurā R₃ ir heteroarilgrupa, izvēlēta no grupas, kas sastāv no

1H-pirazol-3-ilgrupas, tiazol-2-ilgrupas, benzotiazol-2-ilgrupas, [1,2,4]tiadiazol-5-ilgrupas, [1,3,4]tiadiazol-2-ilgrupas, piridin-2-ilgrupas un pirazin-2-ilgrupas, neaizvietotas vai aizvietotas pozīcijā, kas nav blakus minētajam saistītajam oglekļa atomam, neatkarīgi ar grupu, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no C₁₋₉alkilgrupas, halogēna atoma, C₁₋₉alkoksikarbonilgrupas, ciāngrupas, karboksilgrupas, cikloalkilgrupas, arilgrupas, 2-okso-oksazolidin-5-ilmetilgrupas, -N(C₁₋₉alkil)₂, 2,2,-dimetil-[1,3]dioksolan-4-ilgrupas, -CH₂-dimetil-[1,3]dioksolanilgrupas, t-butil-dimetil-silaniloksietilgrupas, neaizvietotas -CH₂-arilgrupas, -CH₂-arilgrupas, aizvietotas ar ciāngrupu vai C₁₋₉alkoksigrupu, heterociklilgrupas, -CH₂-heterociklilgrupas, -6-(CH₂)₂-2,2-dimetil-[1,3]dioksan-4-il-etīlškābes *terc*-butilestera un C₁₋₉alkilgrupas, mono-, bi- vai triaizvietotas neatkarīgi ar hidroksilgrupu, halogēna atomu, alkoksigrupu, -N(C₁₋₉alkil)₂, -NH₂, C₁₋₉alkanoilgrupu, C₁₋₉alkoksikarbonilgrupu, C₂₋₉alkeniloksikarbonilgrupu, karboksilgrupu, aminokarbonilgrupu vai C₁₋₉alkoksikarbonilaminogrupu.

9. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai, kurā minētā heteroarilgrupa R_3 ir aizvietota ar halogēna atomu, C_{1-9} alkilgrupu vai C_{1-9} alkilgrupu, mono-, bi- vai triaizvietotu neatkarīgi ar hidroksilgrupu, halogēna atomu, alkoksigrupu, $-N(C_{1-9}alkil)_2$, $-NH_2$, C_{1-9} alkanoilgrupu, C_{1-9} alkoksikarbonilgrupu, C_{2-9} alkeniloksikarbonilgrupu, karboksilgrupu, aminokarbonilgrupu vai C_{1-9} alkoksikarbonilaminogrupu.

10. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kurā minētā heteroarilgrupa R_3 ir aizvietota ar halogēna atomu, C_{1-9} alkilgrupu vai C_{1-9} alkilgrupu, mono- vai biaizvietotu ar hidroksilgrupu.

11. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu (Ia):



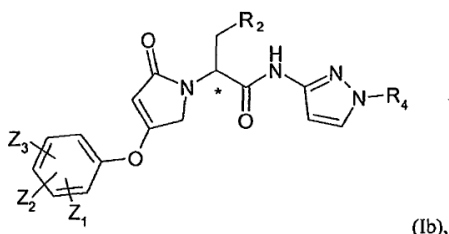
kurā:

Z_1 , Z_2 , Z_3 neatkarīgi cits no cita ir ūdeņraža atoms, C_{1-9} alkilgrupa, C_{2-9} alkenilgrupa, hidroksilgrupa, $-NH_2$, halogēna atoms, C_{1-9} alkoksigrupa, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-S(CH_3)_2$, $-S(O)_2CH_3$, $-CH_2$ -arilgrupa, heteroarilgrupa, ciāngrupa, C_{1-9} alkanoilgrupa, $-O$ -arilgrupa, $-O-CH_2$ -arilgrupa, $-N(CH_3)_2$, cikloalkilgrupa, heterociklilgrupa, $-C(O)$ -heterociklilgrupa vai C_{1-9} alkilgrupa, mono- vai biaizvietota ar hidroksilgrupu;

R_2 ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C_{1-9} alkilgrupas, C_{1-9} alkilgrupas, mono- vai biaizvietotas ar hidroksilgrupu, halogēn- C_{1-9} alkilgrupas, C_{1-9} alkoksi- C_{1-9} alkilgrupas, C_{1-9} alkilsulfanilalkilgrupas, C_{1-9} alkoksigrupas, cikloalkilgrupas, minētā cikloalkilgrupa ir neaizvietota vai mono- vai biaizvietota neatkarīgi ar halogēna atomu vai C_{1-9} alkilgrupu, heterociklilgrupas un arilgrupas, minētā arilgrupa ir neaizvietota vai mono- vai biaizvietota neatkarīgi ar halogēna atomu; un R_3 ir neaizvietota vai aizvietota heteroarilgrupa, kas savienota ar gredzena oglekļa atomu pie redzamās amīngrupas ar vienu heteroatomu, kas ir slāpekļa atoms, kurš ir blakus saistīts gredzena oglekļa atomam, minētā aizvietotā heteroarilgrupa, kas ir aizvietota pozīcijā, kas nav blakus minētajam saistītajam oglekļa atomam, neatkarīgi ar grupu, kas izvēlēta no grupas, kas sastāv no

C_{1-9} alkilgrupas, halogēna atoms, C_{1-9} alkoksikarbonilgrupas, ciāngrupas, karboksilgrupas, cikloalkilgrupas, arilgrupas, 2-okso-oksazolidin-5-ilmetilgrupas, $-N(C_{1-9}alkil)_2$ grupas, 2,2,-dimetil-[1,3]dioksolan-4-ilgrupas, $-CH_2$ -dimetil-[1,3]dioksolan-4-ilgrupas, t-butil-dimetil-silaniloksietilgrupas, neaizvietotas $-CH_2$ -arilgrupas, $-CH_2$ -arilgrupas, aizvietotas ar ciāngrupu vai alkoksigrupu, heterociklilgrupas, $-CH_2$ -heterociklilgrupas, 6-(CH_2)-2,2-dimetil-[1,3]dioksolan-4-il-etilskābes *tert*-butilestera un C_{1-9} alkilgrupas, mono-, bi- vai triaizvietotas neatkarīgi ar hidroksilgrupu, halogēna atomu, alkoksigrupu, $-N(C_{1-9}alkil)_2$ grupu, $-NH_2$, C_{1-9} alkanoilgrupu, C_{1-9} alkoksikarbonilgrupu, C_{2-9} alkeniloksikarbonilgrupu, karboksilgrupu, aminokarbonilgrupu vai C_{1-9} alkoksikarbonilaminogrupu, vai farmaceitiski pieņemams to sāls.

12. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju ar formulu (Ib):



kurā:

Z_1 , Z_2 , Z_3 neatkarīgi viens no otra ir ūdeņraža atoms, C_{1-9} alkilgrupa, C_{2-9} alkenilgrupa, hidroksilgrupa, $-NH_2$, halogēna atoms, zemākā alkoksigrupa, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-S(CH_3)_2$, $-S(O)_2CH_3$, $-CH_2$ -arilgrupa, heteroarilgrupa, ciāngrupa, C_{1-9} alkanoilgrupa, $-O$ -arilgrupa, $-O-CH_2$ -arilgrupa, $-N(CH_3)_2$, cikloalkilgrupa, heterociklilgrupa, $-C(O)$ -heterociklilgrupa vai zemākā alkilgrupa, mono- vai biaizvietota ar hidroksilgrupu;

R_2 ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C_{1-9} alkilgrupas, C_{1-9} alkilgrupas, mono- vai biaizvietotas ar hidroksilgrupu, halogēn- C_{1-9} alkilgrupas, C_{1-9} alkoksi- C_{1-9} alkilgrupas, C_{1-9} alkilsulfanilalkilgrupas, C_{1-9} alkoksigrupas, cikloalkilgrupas, minētā cikloalkilgrupa ir neaizvietota vai mono- vai biaizvietota neatkarīgi ar halogēna atomu vai C_{1-9} alkilgrupu, heterociklilgrupas un arilgrupas, minētā arilgrupa ir neaizvietota vai mono- vai biaizvietota neatkarīgi ar halogēna atomu; un R_4 ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, C_{1-9} alkilgrupas, halogēna atoms, C_{1-9} alkoksikarbonilgrupas, ciāngrupas, karboksilgrupas, cikloalkilgrupas, arilgrupas, 2-okso-oksazolidin-5-ilmetilgrupas, $-N(C_{1-9}alkil)_2$, 2,2,-dimetil-[1,3]dioksolan-4-ilgrupas, $-CH_2$ -dimetil-[1,3]dioksolan-4-ilgrupas, t-butil-dimetil-silaniloksietilgrupas, neaizvietotas $-CH_2$ -arilgrupas, $-CH_2$ -arilgrupas, aizvietotas ar ciāngrupu vai alkoksigrupu, heterociklilgrupas, $-CH_2$ -heterociklilgrupas, 6-(CH_2)-2,2-dimetil-[1,3]dioksolan-4-il-etilskābes *tert*-butilestera un C_{1-9} alkilgrupas, mono-, bi- vai triaizvietotas neatkarīgi ar hidroksilgrupu, halogēna atomu, C_{1-9} alkoksigrupu, $-N(C_{1-9}alkil)_2$, $-NH_2$, C_{1-9} alkanoilgrupu, C_{1-9} alkoksikarbonilgrupu, C_{1-9} alkeniloksikarbonilgrupu, karboksilgrupu, aminokarbonilgrupu vai C_{1-9} alkoksikarbonilaminogrupu, vai farmaceitiski pieņemams to sāls.

13. Savienojumi ar formulu (I), kuriem ir formula (Ib) saskaņā ar 12. pretenziju, kurā Z_1 , Z_2 un Z_3 neatkarīgi viens no otra ir ūdeņraža atoms, trifluormetilgrupa, hlora atoms, fluora atoms, broma atoms, alkanoilgrupa, pīrolidīnīlgrupa, piperidīnīlgrupa, morfolinīlgrupa, ciklopentilgrupa, etoksigrupa, metoksigrupa vai metilgrupa.

14. Savienojumi ar formulu (I), kuriem ir formula (Ib) saskaņā ar 12. pretenziju, kurā R_4 ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no 1-(S)-2,3-dihidroksi-propilgrupas, 1-(R)-2,3-dihidroksi-propilgrupas, 2-hidroksi-2-metil-propilgrupas, 2-hidroksi-etilgrupas un 2-metoksi-etilgrupas.

15. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kurā R_2 ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no zemākās alkilgrupas, ciklopentilgrupas, ciklobutilgrupas, cikloheksilgrupas, tetrahidropīranilgrupas vai tetrahidrofuranilgrupas.

16. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētais savienojums ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

(S)-3-ciklopentil-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-2-(4-metoksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionamīda, (S)-N-(5-hlor-tiazol-2-il)-3-ciklopentil-2-(4-metoksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionamīda, (S)-N-benzotiazol-2-il-3-ciklopentil-2-(4-metoksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionamīda, (S)-3-ciklopentil-2-(4-metoksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-N-(3-metil-[1,2,4]tiadiazol-5-il)-propionamīda, (S)-3-ciklopentil-N-[1-(2-metoksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-2-(4-metoksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionamīda, (S)-3-ciklopentil-2-(4-metoksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-N-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-propionamīda, (2-{3-[(S)-3-ciklopentil-2-(4-metoksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionilamino]-pirazol-1-il}-etil)-karbamātskābes *tert*-butilestera, (S)-3-ciklopentil-N-(5-fluor-tiazol-2-il)-2-(4-metoksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionamīda, (S)-3-ciklopentil-2-(4-metoksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-N-pirazin-2-il-propionamīda, 6-[(S)-3-ciklopentil-2-(4-metoksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionilamino]-nikotīnskābes metilestera, 6-[(S)-3-ciklopentil-2-(4-metoksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionilamino]-nikotīnskābes, (S)-N-[1-(3-ciān-benzil)-1H-pirazol-3-il]-3-ciklopentil-2-(4-metoksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionamīda, (S)-3-ciklopentil-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-2-[4-((S)-2-metoksi-1-metil-etoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-propionamīda, (S)-2-(4-benziloksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-3-ciklopentil-N-[1-(2-hidroksi-2-metilpropil)-1H-pirazol-3-il]-propionamīda, (S)-3-ciklopentil-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-2-(4-izopropoksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionamīda, (S)-3-ciklopentil-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-2-(4-ciklopentiloksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionamīda, (S)-3-ciklopentil-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-2-(4-cikloheksiloksi-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionamīda,

(S)-3-cikloheksil-2-[4-(3-fluor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-propionamīda,
 (S)-2-[4-(3-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-3-cikloheksil-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-propionamīda,
 (S)-3-cikloheksil-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-2-[4-(3-metoksi-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-propionamīda,
 (S)-3-cikloheksil-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-2-[2-okso-4-(3-trifluormetil-fenoksi)-2,5-dihidro-pirol-1-il]-propionamīda,
 (S)-3-cikloheksil-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-2-(2-okso-4-m-toliloksi-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionamīda,
 (S)-3-cikloheksil-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-2-[2-okso-4-(3-trifluormetoksi-fenoksi)-2,5-dihidro-pirol-1-il]-propionamīda,
 (S)-3-cikloheksil-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-2-[4-(6-metil-piridin-3-iloksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-propionamīda,
 (S)-3-cikloheksil-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-2-(2-okso-4-fenoksi-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionamīda,
 2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-3-(trans-3-metil-ciklobutil)-propionamīda,
 (S)-2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-3-(trans-3-metil-ciklobutil)-propionamīda,
 (R)-2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-3-(trans-3-metil-ciklobutil)-propionamīda,
 2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-3-(cis-3-metil-ciklobutil)-propionamīda,
 (S)-2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4,4-difluor-pentānskābes [1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-5,5,5-trifluor-4-trifluormetil-pentānskābes [1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-5,5,5-trifluor-pentānskābes [1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-4,4-difluor-butiramīda,
 (S)-2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-4-hidroksi-butiramīda,
 (S)-2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-4-metilsulfanil-butiramīda,
 2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-4,4,4-trifluor-butiramīda,
 3-(2,6-dihlor-fenil)-2-[4-(2,6-difluor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-propionamīda,
 2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-5,5,5-trifluor-4-metil-pentānskābes [1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-5,5-dimetil-heksānskābes [1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 3-biciklo[2.2.1]hept-2-il-2-[4-(2,6-difluor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-propionamīda,
 3-biciklo[2.2.1]hept-7-il-2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-propionamīda,
 (S)-2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-4-metoksi-butiramīda,
 (S)-3-cikloheksil-2-[4-(3,4-dihlor-fenilamino)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-propionamīda,
 (S)-3-cikloheksil-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-2-(4-izopropilamino-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionamīda,
 (S)-3-cikloheksil-2-[4-(etil-metil-amino)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-propionamīda,
 (S)-3-ciklopentil-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-2-(4-izopropilamino-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il)-propionamīda
 (S)-2-[4-[3-(2-hidroksi-2-metil-propil)-fenoksi]-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-pentānskābes (1-metil-1H-pirazol-3-il)-amīda,
 (S)-2-[4-[3-(2-hidroksi-2-metil-propil)-fenoksi]-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-pentānskābes [1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 (S)-2-[4-[3-(2-hidroksi-2-metil-propil)-fenoksi]-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-pentānskābes [1-((R)-2,2-dimetil-[1,3]dioksolan-4-ilmetil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,

(S)-2-[4-[3-(2-hidroksi-2-metil-propil)-fenoksi]-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-pentānskābes [1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 (S)-2-[4-[3-(2-hidroksi-2-metil-propil)-fenoksi]-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-pentānskābes (1-metil-1H-pirazol-3-il)-amīda,
 (S)-4-metil-2-[4-(1-metil-1H-indazol-4-iloksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-pentānskābes [1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 (S)-2-[4-(2-amino-3-hidroksi-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-pentānskābes [1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 (S)-2-[4-(benzoksazol-4-iloksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-pentānskābes [1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 (S)-4-metil-2-[4-(2-metil-benzoksazol-4-iloksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-pentānskābes [1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 (S)-2-[4-[3-(2-hidroksi-2-metil-propil)-fenoksi]-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-pentānskābes pirazin-2-ilamīda,
 (S)-2-[4-[4-(2-hidroksi-2-metil-propil)-fenoksi]-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-pentānskābes pirazin-2-ilamīda,
 (S)-2-[4-[3-(2-hidroksi-2-metil-propil)-fenoksi]-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-pentānskābes pirazin-2-ilamīda,
 (S)-2-[4-[2-fluor-3-(1-hidroksi-1-metil-etil)-fenoksi]-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-pentānskābes pirazin-2-ilamīda,
 (S)-2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-heksānskābes [1-((R)-2,2-dimetil-[1,3]dioksolan-4-ilmetil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 (S)-2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-heksānskābes [1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 (2R,4S)-2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-heksānskābes [1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 (2S,4S)-2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-heksānskābes [1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 (R)-2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-heksānskābes [1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 (2R,4R)-2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-heksānskābes [1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 (2S,4R)-2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-heksānskābes [1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 2-[4-(3-etoksi-2,6-difluor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-3-(tetrahydro-piran-4-il)-propionamīda,
 (S)-2-[4-(3-etoksi-2,6-difluor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-3-(tetrahydro-piran-4-il)-propionamīda,
 (R)-2-[4-(3-etoksi-2,6-difluor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-3-(tetrahydro-piran-4-il)-propionamīda vai
 (2S,4S)-4-etoksi-2-[4-(3-etoksi-2-fluor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-pentānskābes [1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 (S)-2-[4-(3-etoksi-2,6-difluor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-pentānskābes [1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīda,
 2-[4-(2-brom-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-3-(tetrahydro-piran-4-il)-propionamīda,
 (S)-2-[4-(2,6-difluor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-N-[1-(2-hidroksi-2-metil-propil)-1H-pirazol-3-il]-3-(S)-tetrahydro-piran-2-il-propionamīda,
 2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-3-((1R,3S,4R)-3,4-difluor-ciklopentil)-N-[1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-propionamīda,
 vai farmaceitiski pieņemams to sāls.

17. Savienojums ar formulu (I) saskaņā ar 1. pretenziju, kurš ir (S)-2-[4-(2-hlor-fenoksi)-2-okso-2,5-dihidro-pirol-1-il]-4-metil-pentānskābes [1-((R)-2,3-dihidroksi-propil)-1H-pirazol-3-il]-amīds, vai farmaceitiski pieņemams tā sāls.

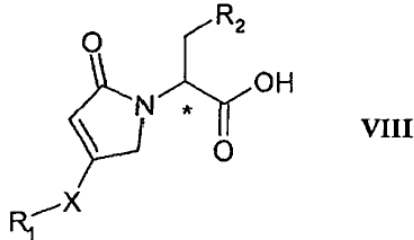
18. Farmaceutiska kompozīcija, kas ietver terapeitiski efektīvu savienojuma ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 17. pretenzijai vai tā farmaceitiski pieņemama sāls daudzumu un farmaceitiski pieņemamu nesēju.

19. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 17. pretenzijai izmantošanai par terapeitiski aktīvu vielu.

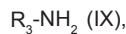
20. Savienojumi ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 17. pretenzijai izmantošanai cukura diabēta ārstēšanā.

21. Savienojumu ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 17. pretenzijai izmantošana medikamenta iegūšanai cukura diabēta ārstēšanai.

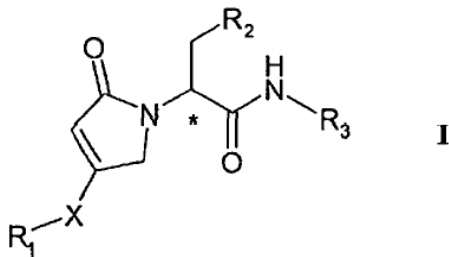
22. Paņēmiens savienojumu ar formulu (I) saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 17. pretenzijai iegūšanai, kur paņēmiens ietver a) savienojuma ar formulu (VIII)



kurā X, R₁ un R₂ ir, kā definēts 1. pretenzijā, reakciju ar savienojumu ar formulu (IX)

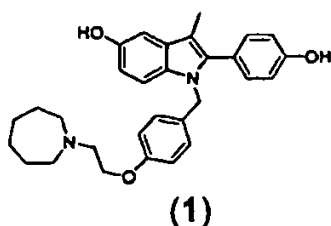


kurā R₃ ir, kā definēts 1. pretenzijā, amīda savienojuma veidošanas reaģenta un bāzes klātbūtnē, lai iegūtu savienojumu ar formulu (I)



un, ja vēlams, pārvēršot savienojumu ar formulu (I) farmaceutiski pieņemamā sāļi.

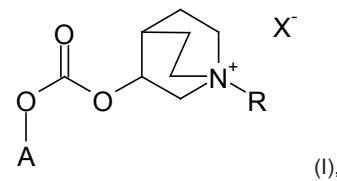
- (51) **C07D 209/12**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2311805**
A61K 31/404⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 5/30⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 10013501.1 (22) 24.07.2008
 (43) 20.04.2011
 (45) 09.05.2012
 (31) 20070500 (32) 25.07.2007 (33) CZ
 (62) 08784167.2 / 2 185 510
 (73) Zentiva, K.S., U Kabelovny 130, 102 37 Praha 10, CZ
 (72) JIRMAN, Josef, CZ
 RICHTER, Jindrich, CZ
 (74) Jirotkova, Ivana, et al, Rott, Ruzicka & Guttman Patent, Trademark and Law Office, Vinohradská 37, 120 00 Praha 2, CZ
 Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV
- (54) **JAUNA BAZEDOKSIFĒNA ACETĀTA POLIMORFĀ FORMA**
NEW POLYMORPHIC FORM OF BAZEDOXIFENE ACETATE
- (57) 1. 1-[4-(2-azepan-1-il-etoksi)benzil]-2-(4-hidroksifenil)-3-metil-1H-indol-5-ola ar formulu (1)



sāls ar etiķskābi (bazedoksifēna acetāts), pie kam sāls ir raksturīgs ar šādiem maksimumiem rentgenstaru difrakcijas ainā: 13,17; 15,97; 17,95; 19,62; 20,54; 22,08; 25,27.

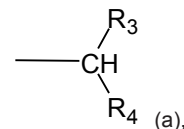
2. Sāls saskaņā ar 1. pretenziju izmantošana farmaceutiski nodrošīgu kompozīciju gatavošanai.

- (51) **C07D 453/02**⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ (11) **2313404**
A61K 31/439⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 11/00⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
- (21) 09777321.2 (22) 21.07.2009
 (43) 27.04.2011
 (45) 28.03.2012
 (31) 08162066 (32) 08.08.2008 (33) EP
 (86) PCT/EP2009/005272 21.07.2009
 (87) WO2010/015324 11.02.2010
 (73) CHIESI FARMACEUTICI S.p.A., Via Palermo, 26/A, 43100 Parma, IT
 (72) AMARI, Gabriele, IT
 DELCANALE, Maurizio, IT
 (74) Minoja, Fabrizio, Bianchetti Bracco Minoja S.r.l., Via Plinio 63, 20129 Milano, IT
 Valters GENCS, Zvērināta advokāta Valtera Genca birojs, Kr. Valdemāra iela 21, Rīga LV-1010, LV
- (54) **HINUKLIDĪNA KARBONĀTA ATVASINĀJUMI UN TĀ MEDICĪNISKIE SASTĀVI**
QUINUCLIDINE CARBONATE DERIVATIVES AND MEDICINAL COMPOSITION THEREOF
- (57) 1. Savienojums ar vispārējo formulu (I)



kur:

A var būt arilgrupa, kurā viens vai vairāki ūdeņraža atomi pēc izvēles ir aizvietoti ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem vai fenilgrupu, vai heteroarilgrupu, kurā viens vai vairāki ūdeņraža atomi pēc izvēles ir aizvietoti ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem, vai arilalkilgrupu, vai heteroarilalkilgrupu, vai grupa ar formulu (a)



kur

R₃ un R₄ ir vienādi vai dažādi un neatkarīgi var būt izvēlēti no grupas, kas ietver: H, (C₃-C₈)cikloalkilgrupu, arilgrupu vai heteroarilgrupu, kurā iepriekš minētā arilgrupa vai heteroarilgrupa pēc izvēles var būt aizvietota ar halogēna atomu vai ar vienu vai vairākiem aizvietotajiem, kas neatkarīgi izvēlēti no rindas: OH, O-(C₁-C₁₀)alkilgrupa, oksogrups (=O), SH, S-(C₁-C₁₀)alkilgrupa, NO₂, CN, CONH₂, COOH, (C₁-C₁₀)alkoksikarbonilgrupa, (C₁-C₁₀)alkilsulfanilgrupa, (C₁-C₁₀)alkilsulfonilgrupa, (C₁-C₁₀)alkilsulfonilgrupa, (C₁-C₁₀)alkilgrupa un (C₁-C₁₀)alkoksilgrupa vai, ja abi R₃ un R₄ neatkarīgi viens no otra ir arilgrupa vai heteroarilgrupa, tad tie var būt saistīti caur Y grupu, kas var būt (CH₂)_n ar n=0-2, kurā, ja n=0, tad Y ir vienkārša saite, kas veido triciklisku gredzena sistēmu, kurā (CH₂)_n grupas oglekļa atoms var būt aizvietots ar heteroatomu, kas izvēlēts no: O, S, N un ar nosacījumu, ka R₃ un R₄ nekad abi nav H.

R ir atlikumgrupa, kas izvēlēta no:

- (C₁-C₁₀)alkilgrupa, (C₂-C₁₀)alkenilgrupa un (C₂-C₁₀)alkinilgrupa, kas pēc izvēles aizvietota ar grupu, kas izvēlēta no:
- grupas, kas izvēlēta no: NH₂, NR₁R₂, CONR₁R₂, NR₂COR₁, OH, SOR₁, SO₂R₁, SH, CN, NO₂ un alicikliskie savienojumi;
- Z-R₁, kur Z ir izvēlēts no: CO, O, COO, OCO, SO₂, S, SO, COS un SCO vai tā ir saite un
- (C₃-C₈)cikloalkilgrupa.

R₁ ir atlikumgrupa, kas izvēlēta no:

- alicikliskie savienojumi, kas pēc izvēles aizvietots ar vienu vai vairākiem aizvietotajiem, kas neatkarīgi izvēlēti no rindas: OH,

oksogrupa (=O), SH, NO₂, CN, CONH₂, NR₂CO-(C₁-C_x)alkilgrupa, COOH, (C₁-C₁₀)alkoksikarbonilgrupa, (C₁-C₁₀)alkilsulfanilgrupa, (C₁-C₁₀)alkilsulfonilgrupa, (C₁-C₁₀)alkilgrupa un (C₁-C₁₀)alkoksilgrupa, NR₂CO-(C₁-C₁₀)alkilgrupa;

- arilgrupa, kas pēc izvēles aizvietota ar NR₂CO-(C₁-C₁₀)alkilgrupu, un

- heteroarilgrupa, kas pēc izvēles aizvietota ar NR₂CO-(C₁-C₁₀)alkilgrupu, (C₁-C₁₀)alkilgrupu, O-(C₁-C₁₀)alkilgrupu vai halogēna atomu.

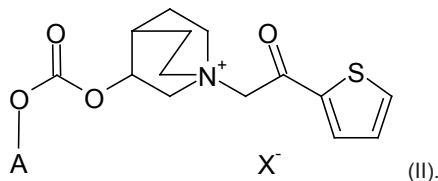
R₂ ir atlikumgrupa, kas izvēlēta no rindas: H, fenoksikarbonilgrupa, benzoiloksikarbonilgrupa, (C₁-C₁₀)alkoksikarbonilgrupa, (C₁-C₁₀)alkilkarbonilgrupa, (C₁-C₁₀)alkilsulfonilgrupa un (C₁-C₁₀)alkilgrupa.

X ir fizioloģiski pieņemams anjons.

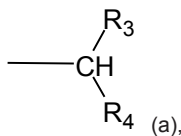
2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R ir (C₁-C₆)alkilgrupa, kas aizvietota ar Z-R₁.

3. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R ir (C₁-C₆)alkilgrupa, kas aizvietota ar Z-R₁, kur Z ir O, CO vai saite un R₁ ir arilgrupa vai heteroarilgrupa, kas, ieteicams, aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem.

4. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R ir CH₂, Z ir CO un R₁ ir tienilgrupa, kas ir saskaņā ar formulu (II):



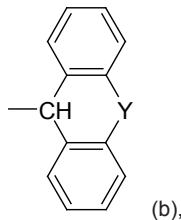
5. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā A ir arilgrupa, kurā viens vai vairāki ūdeņraža atomi pēc izvēles ir aizvietoti ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem vai fenilgrupa, vai heteroarilgrupa, kurā viens vai vairāki ūdeņraža atomi pēc izvēles ir aizvietoti ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem, vai arilalkilgrupa, vai heteroarilalkilgrupa, vai grupa ar formulu (a)



kurā R₃ un R₄ neatkarīgi viens no otra abi ir arilgrupa vai heteroarilgrupa, kas, ieteicams, aizvietoti ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem.

6. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā A ir grupa ar formulu (a), kurā R₃ un R₄ abi ir fenilgrupa, kas, ieteicams, aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem.

7. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā A ir grupa ar formulu (a), kurā R₃ un R₄ abi neatkarīgi viens no otra ir fenilgrupa un tie ir saistīti caur Y grupu, kas var būt (CH₂)_n ar n=0-2, kurā, ja n=0, tad Y ir vienkārša saite, kas veido triciklisku gredzena sistēmu ar formulu (b)



kurā (CH₂)_n grupas oglekļa atoms var būt aizvietots ar heteroatomu, kas izvēlēts no O, S, N.

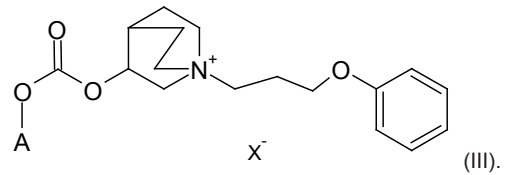
8. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā A ir 9H-fluoren-9-ilgrupa, kas, ieteicams, aizvietota ar vienu vai vairākiem oglekļa atomiem.

9. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā A ir benzilgrupa, kas pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem.

10. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā A ir bifenilmetilgrupa, kas, ieteicams, aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem.

11. Savienojums saskaņā ar 4. pretenziju, kurā A ir tiofenilmetilgrupa, kas, ieteicams, aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem.

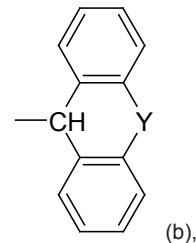
12. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R ir propilgrupa, kas aizvietota ar Z-R₁ grupu, kurā Z ir O un R₁ ir fenilgrupa saskaņā ar formulu (III):



13. Savienojums saskaņā ar 12. pretenziju, kurā A ir arilgrupa vai heteroarilgrupa, vai arilalkilgrupa, vai heteroarilalkilgrupa, vai grupa ar formulu (a), kurā R₃ un R₄ abi neatkarīgi viens no otra ir arilgrupa vai heteroarilgrupa, kas, ieteicams, aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem.

14. Savienojums saskaņā ar 12. pretenziju, kurā A ir grupa ar formulu (a), kurā R₃ un R₄ abi ir fenilgrupa, kas, ieteicams, aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem.

15. Savienojums saskaņā ar 12. pretenziju, kurā A ir grupa ar formulu (a), kurā R₃ un R₄ abi neatkarīgi viens no otra ir arilgrupa vai heteroarilgrupa, un tie ir saistīti caur grupu Y, kura var būt (CH₂)_n ar n=0-2, kurā, ja n=0, tad Y ir vienkārša saite, kas veido triciklisku gredzena sistēmu ar formulu (b)



kurā (CH₂)_n grupas oglekļa atoms var būt aizvietots ar heteroatomu, kas izvēlēts no O, S, N.

16. Savienojums saskaņā ar 12. pretenziju, kurā A ir 9H-fluoren-9-ilgrupa, kas, ieteicams, aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem.

17. Savienojums saskaņā ar 12. pretenziju, kurā A ir benzilgrupa, kas pēc izvēles aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem.

18. Savienojums saskaņā ar 12. pretenziju, kurā A ir bifenilmetilgrupa, kas, ieteicams, aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem.

19. Savienojums saskaņā ar 12. pretenziju, kurā A ir tiofenilmetilgrupa, kas, ieteicams, aizvietota ar vienu vai vairākiem halogēna atomiem.

20. Farmaceutiskais sastāvs, kurš ietver savienojumu saskaņā ar 1. līdz 19. pretenziju ar vienu vai vairākiem farmaceutiski pieņemamiem nesējiem un/vai palīgvielām.

21. Savienojums ar formulu (I), kas ir saskaņā ar ikvienu no 1. līdz 19. pretenzijai, ko paredzēts izmantot obstruktīva bronhīta vai iekaisuma saslimšanu, ieteicams, astmas vai hroniska bronhīta, vai hroniskas obstruktīvas plaušu slimības (HOPS) ārstēšanai.

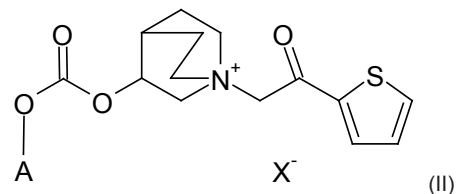
22. Savienojums saskaņā ar formulu (I), kas ir saskaņā ar 1. līdz 19. pretenziju, kas paredzēts izmantošanai kā medikaments.

23. Ierīce, kas ietver farmaceutisko sastāvu saskaņā ar 20. pretenziju.

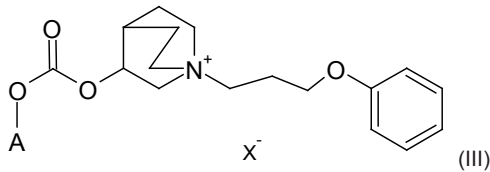
24. Ierīce saskaņā ar 23. pretenziju, kas ir vienas vai vairāku devu pulvera inhalators, dozēto devu inhalators vai sīkdispersijas izsmidzinātājs.

25. Paņēmieni savienojuma ar formulu (I), kas ir saskaņā ar 1. pretenziju, iegūšanai, kas ietver šādus soļus:

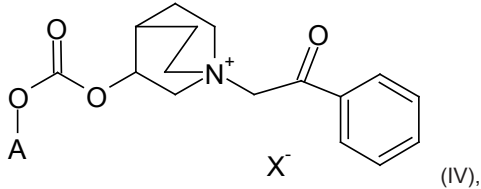
(i) aminospirta ar formulu (II)



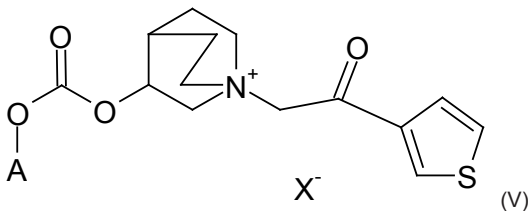
reakciju ar 1,1'-karbonildiimidzolu, lai iegūtu imidazola atvasinājumu ar formulu (III)



(ii) tad reakcija ar spirtu ar formulu (IV)



lai iegūtu savienojumu ar formulu (V)



(iii) tad alkilēšana ar alkilēšanas vielu RX, lai iegūtu ceturtnajā amonija sāļi ar formulu (I).

- | | | |
|---|---------------------|---------|
| (51) A61K 9/20 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | (11) 2316430 | |
| (21) 10182198.1 | (22) 07.10.2005 | |
| (43) 04.05.2011 | | |
| (45) 06.06.2012 | | |
| (31) 200401546 | (32) 08.10.2004 | (33) DK |
| 200401736 | 10.11.2004 | DK |
| 200500211 | 11.02.2005 | DK |
| 200500419 | 23.03.2005 | DK |
| 691513 P | 16.06.2005 | US |
| (62) 05789026.1 / 1 799 196 | | |
| (73) Forward Pharma A/S, c/o NB Capital Aps, Østergade 24A, 1, 1100 Copenhagen K, DK | | |
| (72) NILSSON, Henrik, AT
SCHÖNHARTING, Florian, DK
MÜLLER, Bernd W, DE
ROBINSON, Joseph R., US | | |
| (74) HOFFMANN EITLE Patent- und Rechtsanwälte, Arabellastrasse 4, 81925 München, DE
Aleksandra FORTŪNA, FORAL Intelektuālā Īpašuma aģentūra, SIA, a/k 98, Rīga LV-1050, LV | | |
| (54) FUMĀRSKĀBES ESTERI SATUROŠAS KONTROLĒTAS ATBRĪVOŠANĀS FARMACEITISKAS KOMPOZĪCIJAS CONTROLLED RELEASE PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS COMPRISING A FUMARIC ACID ESTER | | |

(57) 1. Kontrolētas atbrīvošanas farmaceutiska kompozīcija, kas kā aktīvo vielu satur vienu vai vairākus fumārskābes esterus, kuri izvēlēti no fumārskābes di-(C₁-C₉)alkilesteriem un fumārskābes mono-(C₁-C₉)alkilesteriem vai to farmaceutiski pieņemamu sāļi, kur fumārskābes esteru atbrīvošana, ja pakļauta *in vitro* šķīdības testam, pirmajās 2 testa stundās, kā šķīšanas vidi izmantojot 0,1 N sāļsskābi, bet pēc tam kā šķīšanas vidi izmantojot 0,05 M fosfāta buferšķīduma pH 6,5 – notiek šādi: perorālai lietošanai hiperproliferatīvo, iekaisuma vai autoimūno traucējumu ārstēšanā pirmajās 3 stundās no testa sākuma tiek atbrīvots kompozīcijā esošā dimetilfumarāta ne vairāk kā 70 masas % no kopējā daudzuma, ievadot dimetilfumarāta dienas devu no 240 līdz 840 mg no vienas līdz trijās reizēs.

2. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kurā fumārskābes estera atbrīvošana notiek šādi: pirmajās 4 stundās

no testa sākuma tiek atbrīvots fumārskābes estera ne vairāk kā 92 masas % no kopējā daudzuma.

3. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur fumārskābes estera atbrīvošana notiek šādi: pirmajās 5 stundās no testa sākuma tiek atbrīvots fumārskābes estera ne vairāk kā 94 masas % no kopējā daudzuma.

4. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 3. pretenzijai, kur fumārskābes estera atbrīvošana notiek šādi: pirmajās 6 stundās no testa sākuma tiek atbrīvots fumārskābes estera ne vairāk kā 95 masas % no kompozīcijā esošā kopējā daudzuma.

5. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 4. pretenzijai, kur fumārskābes estera atbrīvošana notiek šādi: pirmajās 7 stundās no testa sākuma tiek atbrīvots fumārskābes estera ne vairāk kā 98 masas % no kompozīcijā esošā kopējā daudzuma.

6. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 5. pretenzijai, kur fumārskābes estera atbrīvošana notiek šādi: pirmajās 9 stundās no testa sākuma tiek atbrīvots fumārskābes estera ne vairāk kā 99 masas % no kompozīcijā esošā kopējā daudzuma.

7. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 6. pretenzijai, kur fumārskābes estera atbrīvošana notiek šādi: pirmajās 12 stundās no testa sākuma tiek atbrīvots fumārskābes estera ne vairāk kā 99 % no kompozīcijā esošā kopējā daudzuma.

8. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām dimetilfumarāta devas no 360 līdz 480 mg ievadīšanai no vienas līdz trijās reizēs.

9. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām dimetilfumarāta dienas devas no 480 līdz 600 mg ievadīšanai no vienas līdz trijās reizēs.

10. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām dimetilfumarāta dienas devas no 600 līdz 720 mg ievadīšanai no vienas līdz trijās reizēs.

11. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām dimetilfumarāta dienas devas no 720 līdz 840 mg ievadīšanai no vienas līdz trijās reizēs.

12. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām ievadīšanai katru dienu vienu, divas vai trīs reizes.

13. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 12. pretenziju ievadīšanai vienreiz dienā.

14. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 12. pretenziju ievadīšanai divreiz dienā.

15. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar jebkuru no iepriekšējām pretenzijām izmantošanai psoriāzes, psoriātiskā artrīta, nei-rodematīta, zarnu iekaisuma slimības, tādas kā Krona slimība un čūlainais kolīts, autoimūno slimību, tādu kā poliartrīts, multiplās sklerozes (MS), juvenīlā cukura diabēta sākumstadijā, Hašimoto tireoidīta, Greivsa slimības, sistēmiskās sarkanās vilkēdes (SLE), Šegrēna sindroma, hroniskas progresējošas anēmijas, hroniska aktīva (lupoīdā) hepatīta, reimatoīdā artrīta (RA) un redzes nerva neirīta, sāpju, tādu kā radikulārās sāpes, ar radikulopātiju saistītās sāpes, neiropātiskās sāpes vai išiasa jeb sēžas nerva sāpes, orgānu transplantāta atgrūšanas (atgrūšanas profilaksei), sarkodiozes, nekrobiozes lipoidica vai granulomas *annulare* ārstēšanā.

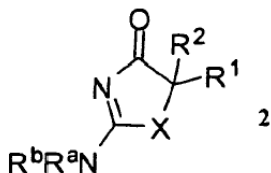
16. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 15. pretenziju izmantošanai psoriāzes ārstēšanā.

17. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 15. pretenziju izmantošanai multiplās sklerozes (MS) ārstēšanā.

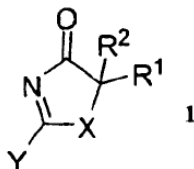
18. Farmaceutiska kompozīcija saskaņā ar 15. pretenziju izmantošanai reimatoīdā artrīta (RA) ārstēšanā.

- | | | |
|---|---------------------|---------|
| (51) C07D 277/54 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | (11) 2321290 | |
| (21) 09790875.0 | (22) 28.07.2009 | |
| (43) 18.05.2011 | | |
| (45) 20.06.2012 | | |
| (31) 84549 P | (32) 29.07.2008 | (33) US |
| (86) PCT/US2009/051929 | 28.07.2009 | |
| (87) WO2010/014586 | 04.02.2010 | |
| (73) Amgen, Inc, One Amgen Center Drive, Thousand Oaks, California 91320-1799, US | | |

- (72) CAILLE, Seb, US
CUI, Sheng, US
WANG, Xiang, US
FAUL, Margaret, US
- (74) Sexton, Jane Helen, et al, J A Kemp, 14 South Square, Gray's Inn, London WC1R 5JJ, GB
Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV
- (54) **ASIMETRISKS PAŅĒMIENS AIZVIETOTU 2-AMINO-TIAZOLONU IEGŪŠANAI**
ASYMMETRIC PROCESS FOR MAKING SUBSTITUTED 2-AMINO-THIAZOLONES
- (57) 1. Paņēmiens savienojuma ar formulu (2) vai tā tautomēra, stereiozomēra vai farmaceitiski pieņemama sāls iegūšanai:



kas ietver savienojuma ar formulu (1):



reakciju ar savienojumu ar formulu R^aR^bNH ; kurā X ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no S, O un NR; Y ir $R^cC(O)NH$ vai SR^d ;

R ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, C_{1-6} alkilgrupas, C_{2-8} alkenilgrupas, C_{2-8} alkinilgrupas, C_{1-4} alkoksigrupas, C_{1-4} alkoksi C_{1-4} alkilgrupas, C_{1-8} fluoralkilgrupas, C_{1-8} hidroksialkilgrupas, C_{3-8} cikloalkilgrupas, C_{4-8} bicikloalkilgrupas, C_{3-8} heterocikloalkilgrupas, heteroarilgrupas, arilgrupas, C_{3-8} cikloalkil C_{1-6} alkilgrupas, C_{3-8} heterocikloalkil C_{1-6} alkilgrupas, heteroaril C_{1-6} alkilgrupas un aril C_{1-6} alkilgrupas;

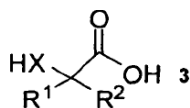
R^a ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C_{1-8} alkilgrupas, arilgrupas, C_{3-8} cikloalkilgrupas un aril C_{1-6} alkilgrupas;

R^1 un R^2 katrs neatkarīgi ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, C_{1-8} alkilgrupas, C_{2-8} alkenilgrupas, C_{2-8} alkinilgrupas, C_{1-4} alkoksi C_{1-4} alkilgrupas, C_{1-8} fluoralkilgrupas, C_{1-8} hidroksialkilgrupas, C_{3-8} cikloalkilgrupas, C_{3-8} aminoalkilgrupas, C_{3-8} halogēnalkilgrupas, C_{3-8} heteroalkilgrupas, C_{3-8} heterocikloalkilgrupas, heteroarilgrupas, arilgrupas, C_{3-8} cikloalkil C_{1-6} alkilgrupas, C_{3-8} heterocikloalkil C_{1-6} alkilgrupas, heteroaril C_{1-6} alkilgrupas un aril C_{1-6} alkilgrupas; kur R^1 un R^2 vienlaikus nav ūdeņraža atoms;

R^a ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, C_{1-8} alkilgrupas, C_{2-8} alkenilgrupas, C_{2-8} alkinilgrupas, C_{1-4} alkoksigrupas, C_{1-4} alkoksi C_{1-4} alkilgrupas, C_{1-8} fluoralkilgrupas, C_{1-8} hidroksialkilgrupas, C_{3-8} cikloalkilgrupas, C_{4-8} bicikloalkilgrupas, C_{3-8} heterocikloalkilgrupas, heteroarilgrupas, arilgrupas, C_{3-8} cikloalkil C_{1-6} alkilgrupas, C_{3-8} heterocikloalkil C_{1-6} alkilgrupas, heteroaril C_{1-6} alkilgrupas un aril C_{1-6} alkilgrupas; un

R^b ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C_{1-8} alkilgrupas, C_{2-8} alkenilgrupas, C_{2-8} alkinilgrupas, C_{1-4} alkoksigrupas, C_{1-4} alkoksi C_{1-4} alkilgrupas, C_{1-8} fluoralkilgrupas, C_{1-8} hidroksialkilgrupas, C_{3-8} cikloalkilgrupas, C_{4-8} bicikloalkilgrupas, C_{3-8} heterocikloalkilgrupas, heteroarilgrupas, arilgrupas, C_{3-8} cikloalkil C_{1-6} alkilgrupas, C_{3-8} heterocikloalkil C_{1-6} alkilgrupas, heteroaril C_{1-6} alkilgrupas un aril C_{1-6} alkilgrupas.

2. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus ietver savienojuma ar formulu (1) veidošanu, kas ietver savienojuma ar formulu (3)



reakciju ar savienojumu ar formulu Y-CN; kurā X un Y ir, kā definēti 1. pretenzijā.

3. Paņēmiens saskaņā ar 2. pretenziju, kurā savienojums ar formulu (3) ir (S)-2-merkaptto-2,3-dimetilbutānskābe un savienojums ar formulu Y-CN ir metilizocianāts.

4. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R^1 un R^2 ir neatkarīgi izvēlēti no C_{1-8} alkilgrupas.

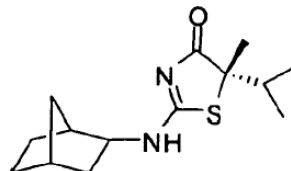
5. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā savienojums ar formulu (1) ir (S)-5-izopropil-5-metil-2-(metiltio)thiazol-4(5H)-ons.

6. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā R^a ir H.

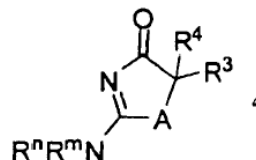
7. Paņēmiens saskaņā ar 6. pretenziju, kurā R^aR^bNH ir (S)-ekso-aminonorbomāns.

8. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kas ietver (S)-5-izopropil-5-metil-2-(metiltio)thiazol-4(5H)-ona reakciju ar (S)-ekso-aminonorbomānu.

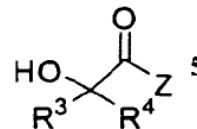
9. Paņēmiens saskaņā ar 1. pretenziju, kurā savienojums ar formulu (2) ir



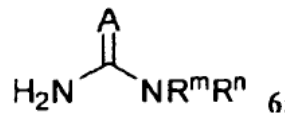
10. Paņēmiens savienojuma ar formulu (4) vai tā tautomēra, stereiozomēra, solvāta vai farmaceitiski pieņemama sāls iegūšanai:



kas ietver savienojuma ar formulu (5):



reakciju ar savienojumu ar formulu (6)



kurā

A ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no S, O un NR^5 ;

Z ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no halogēna atoma, OR^6 un SR^6 ;

R^3 un R^4 katrs neatkarīgi ir izvēlēti no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, C_{1-8} alkilgrupas, C_{2-8} alkenilgrupas, C_{2-8} alkinilgrupas, C_{1-4} alkoksi C_{1-4} alkilgrupas, C_{1-8} fluoralkilgrupas, C_{1-8} hidroksialkilgrupas, C_{3-8} cikloalkilgrupas, C_{3-8} aminoalkilgrupas, C_{3-8} halogēnalkilgrupas, C_{3-8} heteroalkilgrupas, C_{3-8} heterocikloalkilgrupas, heteroarilgrupas, arilgrupas, C_{3-8} cikloalkil C_{1-6} alkilgrupas, C_{3-8} heterocikloalkil C_{1-6} alkilgrupas, heteroaril C_{1-6} alkilgrupas un aril C_{1-6} alkilgrupas; kurā R^3 un R^4 vienlaikus nav ūdeņraža atoms;

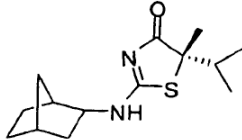
R^5 ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, C_{1-8} alkilgrupas, C_{2-8} alkenilgrupas, C_{2-8} alkinilgrupas, C_{1-4} alkoksigrupas, C_{1-4} alkoksi C_{1-4} alkilgrupas, C_{1-8} fluoralkilgrupas, C_{1-8} hidroksialkilgrupas, C_{3-8} cikloalkilgrupas, C_{3-8} heterocikloalkilgrupas, heteroarilgrupas, arilgrupas, C_{3-8} cikloalkil C_{1-6} alkilgrupas, C_{3-8} heterocikloalkil C_{1-6} alkilgrupas, heteroaril C_{1-6} alkilgrupas un aril C_{1-6} alkilgrupas;

R^6 ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C_{1-8} alkilgrupas, pentafluorfenilgrupas, nitrofenilgrupas, di-nitrofenilgrupas, CF_3 fenilgrupas, p-toluolsulfonilgrupas un metānsulfonilgrupas;

R^m ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no ūdeņraža atoma, C_{1-8} alkilgrupas, C_{2-8} alkenilgrupas, C_{2-8} alkinilgrupas, C_{1-4} alkoksigrupas, C_{1-4} alkoksi C_{1-4} alkilgrupas, C_{1-8} fluoralkilgrupas, C_{1-8} hidroksialkilgrupas, C_{3-8} cikloalkilgrupas, C_{4-8} bicikloalkilgrupas, C_{3-8} heterocikloalkilgrupas, heteroarilgrupas, arilgrupas, C_{3-8} cikloalkil C_{1-6} alkilgrupas, C_{3-8} heterocikloalkil C_{1-6} alkilgrupas, heteroaril C_{1-6} alkilgrupas un aril C_{1-6} alkilgrupas; un

Rⁿ ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no C₁₋₈ alkilgrupas, C₂₋₈ alkenilgrupas, C₂₋₈ alkililgrupas, C₁₋₄ alkoksigrupas, C₁₋₄ alkoksic₁₋₄ alkilgrupas, C₁₋₈ fluoralkilgrupas, C₁₋₈ hidroksialkilgrupas, C₃₋₈ cikloalkilgrupas, C₄₋₈ bicikloalkilgrupas, C₃₋₈ heterocikloalkilgrupas, heteroarilgrupas, arilgrupas, C₃₋₈ cikloalkilC₁₋₆ alkilgrupas, C₃₋₈ heterocikloalkilC₁₋₆ alkilgrupas, heteroarilC₁₋₆ alkilgrupas un arilC₁₋₆ alkilgrupas.

11. Paņēmiens saskaņā ar 10. pretenziju, kurā A ir O.
12. Paņēmiens saskaņā ar 11. pretenziju, kurā R³ un R⁴ ir neatkarīgi izvēlēti no C₁₋₈ alkilgrupas.
13. Paņēmiens saskaņā ar 10. pretenziju, kurā R^m ir H.
14. Paņēmiens saskaņā ar 10. pretenziju, kurā savienojums ar formulu (5) ir (S)-2-hidroksi-2,3-dimetilbutānskābe un savienojums ar formulu (6) ir (S)-ekso-norborniltiourīnviela.
15. Paņēmiens saskaņā ar 8. pretenziju, kurā savienojums ar formulu (4) ir



- | | |
|--|-------------------------|
| (51) A61K 9/20 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/00 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | (11) 2323633 |
| (21) 09792207.4 | (22) 03.09.2009 |
| (43) 25.05.2011 | |
| (45) 21.03.2012 | |
| (31) 94131 P | (32) 04.09.2008 (33) US |
| (86) PCT/US2009/055820 | 03.09.2009 |
| (87) WO2010/028108 | 11.03.2010 |
| (73) Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province Line Road, P.O. Box 4000, Princeton, NJ 08543-4000, US | |
| (72) BROWN, Jonathan, R., GB
TOALE, Helen, GB
DENNIS, Andrew, B., GB
TIMMINS, Peter, GB | |
| (74) Reitsötter - Kinzebach, Patentanwälte, Sternwartstrasse 4, 81679 München, DE
Anda BORISOVA, ALFA-PATENTS, a/k 109, Rīga LV-1082, LV | |
| (54) STABILA FARMACEITISKA KOMPOZĪCIJA HIV FIKSĀCIJAS INHIBITORA OPTIMIZĒTAI PIEGĀDEI
STABLE PHARMACEUTICAL COMPOSITION FOR OPTIMIZED DELIVERY OF AN HIV ATTACHMENT INHIBITOR | |

(57) 1. Farmaceutiska kompozīcija tabletes formā, kas ietver HIV fiksācijas inhibitora fosfāta estera priekštečzāles, 1-benzoil-4-[2-[4-metoksi-7-(3-metil-1H-1,2,4-triazol-1-il)-1-[(fosfonoksi)metil]-1H-pirololo[2,3-c]piridin-3-il]-1,2-dioksietil]piperazīnu un hidroksipropilmetilcelulozi (HPMC) ar hidrāta viskozitāti vismaz aptuveni 100 cP, kas nodrošina vēlamu pagarinātu izejas savienojuma absorbciju, kad ievadīta cilvēkiem, nodrošina priekštečzāļu stabilitāti pret sārmaino fosfatāzi, kamēr joprojām ir devas formā saskaņā ar pācievadīšanas nosacījumiem, un kur minētā kompozīcija nesatur nevienus enzīma inhibitorus un minētā HPMC daudzums minētajā kompozīcijā ir 10-50 masas %.

2. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētā savienojuma daudzums minētajā kompozīcijā ir 20-90 masas %.
3. Kompozīcija saskaņā ar 2. pretenziju, kur minētā savienojuma daudzums ir 50-85 masas %.
4. Kompozīcija saskaņā ar 3. pretenziju, kur minētā savienojuma daudzums ir 60-75 masas % daudzumā.
5. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētā HPMC daudzums ir 15-40 masas %.
6. Kompozīcija saskaņā ar 5. pretenziju, kur minētā HPMC daudzums ir 20-30 masas %.
7. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētā HPMC viskozitāte ir vismaz aptuveni 2000 cP, vismaz aptuveni 3000 cP vai vismaz aptuveni 4000 cP.
8. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas papildus ietver vienu vai vairākas papildu palīgvielas, kas izvēlētas no grupas, kas sastāv no mikrokristāliskas celulozes, silīcija dioksīda un magnija stearāta.

9. Kompozīcija saskaņā ar 8. pretenziju, kur minētās papildu palīgvielas daudzums minētajā kompozīcijā ir 15 masas %.

10. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētā HPMC viskozitāte nepārsniedz aptuveni 120000 cP.

11. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kur minētais savienojums ir trīs sāls veidā.

12. Kompozīcija saskaņā ar 1. pretenziju, kas ir derīga HIV infekcijas ārstēšanai, kura papildus ietver pretvīrusu iedarbīgu daudzumu AIDS ārstēšanas līdzekļa, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

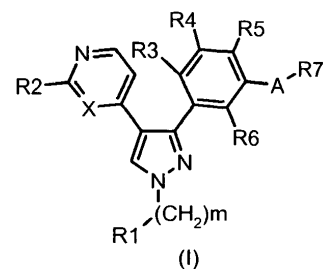
- (a) AIDS pretvīrusa līdzekļa;
- (b) pretinfekcijas līdzekļa;
- (c) imūnmodulatora; un
- (d) cita HIV ievadīšanas inhibitora.

13. Paņēmiens farmaceutiskas kompozīcijas iegūšanai tabletes formā, kurš ietver savienojuma 1-benzoil-4-[2-[4-metoksi-7-(3-metil-1H-1,2,4-triazol-1-il)-1-[(fosfonoksi)metil]-1H-pirololo[2,3-c]piridin-3-il]-1,2-dioksietil]piperazīna sajaukšanu kopā ar HPMC ar viskozitāti vismaz aptuveni 2000 cP, bez jebkādiem enzīma inhibitoriem un minētās kompozīcijas saspiešanu tabletes.

14. Kompozīcija saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 12. pretenzijai izmantošanai zīdītāja, kas inficēts ar HIV vīrusu, ārstēšanā.

15. Kompozīcija izmantošanai saskaņā ar 14. pretenziju, kas ietver minētās kompozīcijas pretvīrusu iedarbīga daudzuma kombinācijā ar pretvīrusu iedarbīgu AIDS ārstēšanas līdzekļa daudzumu, kas izvēlēts no grupas, kas sastāv no AIDS pretvīrusu līdzekļa; pretinfekcijas līdzekļa; imūnmodulatora un cita HIV ievadīšanas inhibitora, ievadīšanu minētajam zīdītājam.

- | | |
|---|-------------------------|
| (51) C07D 401/04 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 403/04 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 407/14 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
C07D 409/14 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61K 31/4439 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾
A61P 35/00 ⁽²⁰⁰⁶⁰¹⁾ | (11) 2324008 |
| (21) 09780990.9 | (22) 23.07.2009 |
| (43) 25.05.2011 | |
| (45) 09.05.2012 | |
| (31) 08161076 | (32) 24.07.2008 (33) EP |
| (86) PCT/EP2009/059506 | 23.07.2009 |
| (87) WO2010/010154 | 28.01.2010 |
| (73) NERVIANO MEDICAL SCIENCES S.R.L., Viale Pasteur, 10, 20014 Nerviano (MI), IT | |
| (72) PULICI, Maurizio, IT
ZUCCOTTO, Fabio, IT
BADARI, Alessandra, IT
NUVOLONI, Stefano, IT
CERVI, Giovanni, IT
TRAQUANDI, Gabriella, IT
BIONDARO, Sonia, IT
TRIFIRO', Paolo, IT
MARCHIONNI, Chiara, IT
MODUGNO, Michele, IT | |
| (74) Duncan, Garreth Andrew, et al, D Young & Co LLP, 120 Holborn, London EC1N 2DY, GB
Lūcija KUZJUKĒVIČA, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV | |
| (54) 3,4-DIARILPIRAZOLI KĀ PROTEĪNKINĀŽU INHIBITORI
3,4-DIARYLPYRAZOLES AS PROTEIN KINASE INHIBITORS | |
| (57) 1. Savienojums ar formulu (I): | |



kur:

m ir vesels skaitlis no 0 līdz 6;

R1 ir ūdeņraža atoms, trihlormetilgrupa, trifluormetilgrupa, halogēna atoms, ciāngrupa, OH, OR8, NR9R10, NR21, COR22, COOH, COOR11, CONR12R13 vai eventuāli aizvietota grupa, kas ir izvēlēta no lineāras virknes vai sazarotas C₁₋₈alkilgrupas, C₂₋₈alkenilgrupas vai C₂₋₈alkinilgrupas, C₃₋₈cikloalkilgrupas, C₃₋₈cikloalkenilgrupas, heterociklilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas, kur:

R8 un R11 katrs neatkarīgi ir eventuāli aizvietota grupa, kas ir izvēlēta no lineāras virknes vai sazarotas C₁₋₈alkilgrupas, C₃₋₈cikloalkilgrupas, heterociklilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas; R9, R10, R12 un R13, vienādi vai dažādi, katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai eventuāli aizvietota grupa, kas ir izvēlēta no lineāras virknes vai sazarotas C₁₋₈alkilgrupas, C₃₋₈cikloalkilgrupas, heterociklilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas, vai, ņemti kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir saistīti, kā R9 un R10, tā arī R12 un R13 var veidot eventuāli aizvietotu heterociklilgrupu vai heteroarilgrupu, kas eventuāli satur vienu papildu heteroatomu vai heteroatomu grupu, kas izvēlēta no S, O, N vai NH;

R21 un R22, vienādi vai dažādi, katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai eventuāli aizvietota grupa, kas ir izvēlēta no lineāras virknes vai sazarotas C₁₋₈alkilgrupas, C₃₋₈cikloalkilgrupas, heterociklilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas, vai, ņemti kopā ar atomiem, pie kuriem tie ir saistīti, R21 un R22 var veidot eventuāli aizvietotu heterociklilgrupu, kas eventuāli satur vienu papildu heteroatomu vai heteroatomu grupu, kas izvēlēta no S, O, N vai NH;

X ir -CH vai N;

R2 ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms, NR14R15, SR23 vai SO₂R23, kur:

R14 un R15 neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai eventuāli aizvietota grupa, kas ir izvēlēta no lineāras virknes vai sazarotas C₁₋₈alkilgrupas, C₃₋₈cikloalkilgrupas, heterociklilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas, vai, ņemti kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir saistīti, R14 un R15 var veidot eventuāli aizvietotu 3- līdz 8-locekļu heterociklilgrupu vai heteroarilgrupu, kas eventuāli satur vienu papildu heteroatomu vai heteroatomu grupu, kas izvēlēta no S, O, N vai NH; vai R14 ir ūdeņraža atoms un R15 ir COR16, kur:

R16 ir OR17, NR18R19 vai eventuāli aizvietota grupa, kas ir izvēlēta no lineāras virknes vai sazarotas C₁₋₈alkilgrupas, C₂₋₈alkenilgrupas vai C₂₋₈alkinilgrupas, C₃₋₈cikloalkilgrupas, C₃₋₈cikloalkenilgrupas, heterociklilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas, kur:

R17 ir eventuāli aizvietota grupa, kas ir izvēlēta no lineāras virknes vai sazarotas C₁₋₈alkilgrupas, C₃₋₈cikloalkilgrupas, heterociklilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas;

R18 un R19 katrs neatkarīgi ir eventuāli aizvietota grupa, kas ir izvēlēta no lineāras virknes vai sazarotas C₁₋₈alkilgrupas, C₃₋₈cikloalkilgrupas, heterociklilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas, vai, ņemti kopā ar slāpekļa atomu, pie kura tie ir saistīti, R18 un R19 var veidot eventuāli aizvietotu 3- līdz 8-locekļu heterociklilgrupu vai heteroarilgrupu, kas eventuāli satur vienu papildu heteroatomu vai heteroatomu grupu, kas izvēlēta no S, O, N vai NH;

R23 ir eventuāli aizvietota grupa, kas ir izvēlēta no lineāras virknes vai sazarotas C₁₋₈alkilgrupas, C₃₋₈cikloalkilgrupas, heterociklilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas,

R3, R4, R5 un R6 katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms, trifluormetilgrupa, trihlormetilgrupa, ciāngrupa, OR20 vai eventuāli aizvietota grupa, kas ir izvēlēta no lineāras virknes vai sazarotas C₁₋₈alkilgrupas un C₃₋₈cikloalkilgrupas, kur:

R20 ir eventuāli aizvietota grupa, kas ir izvēlēta no lineāras virknes vai sazarotas C₁₋₈alkilgrupas un C₃₋₈cikloalkilgrupas;

A ir -CON(Y), -CON(Y)O-, -CON(Y)N(Y)-, -CON(Y)SO₂-, -SO₂N(Y)-, -SO₂N(Y)O-, -SO₂N(Y)N(Y)-, -SO₂N(Y)CO-, -SO₂N(Y)CON(Y)-, -SO₂N(Y)SO₂-, -N(Y)CO-, -N(Y)SO₂-, -N(Y)CON(Y)-, -N(Y)CSN(Y)-, -N(Y)CON(Y)N(Y)-, -N(Y)COO-, -N(Y)CON(Y)SO₂-, -N(Y)SO₂N(Y)-, -C(R'R'')CON(Y)-, -C(R'R'')CSN(Y)-, -C(R'R'')CON(Y)O-, -C(R'R'')CON(Y)N(Y)-, -C(R'R'')CON(Y)SO₂-, -C(R'R'')SO₂N(Y)-, -C(R'R'')SO₂N(Y)O-, -C(R'R'')SO₂N(Y)N(Y)-, -C(R'R'')SO₂N(Y)CO-, -C(R'R'')SO₂N(Y)SO₂-, -C(R'R'')N(Y)CO-, -C(R'R'')N(Y)SO₂-, -C(R'R'')N(Y)CON(Y)-, -C(R'R'')N(Y)CSN(Y)-, -C(R'R'')N(Y)COO-, -C(R'R'')N(Y)SO₂N(Y)- vai -N(Y)C(R'R''), kur:

Y ir ūdeņraža atoms vai eventuāli aizvietota lineāras virknes vai sazarota C₁₋₃alkilgrupa;

un R' un R'' neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai eventuāli papildus aizvietota lineāras virknes vai sazarota C₁₋₈alkilgrupa, vai, ņemti

kopā ar oglekļa atomu, pie kura tie ir saistīti, R' un R'' var veidot eventuāli aizvietotu C₃₋₈cikloalkilgrupu;

R7 ir ūdeņraža atoms vai eventuāli aizvietota grupa, kas ir izvēlēta no lineāras virknes vai sazarotas C₁₋₈alkilgrupas, C₂₋₈alkenilgrupas vai C₃₋₈cikloalkilgrupas, C₂₋₈alkinilgrupas, C₃₋₈cikloalkenilgrupas, heterociklilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas; un tā farmaceitiski pieņemami sāļi.

2. Savienojums ar formulu (I), kā noteikts 1. pretenzijā, kur: m ir vesels skaitlis no 0 līdz 2.

3. Savienojums ar formulu (I), kā noteikts 1. vai 2. pretenzijā, kur:

A ir -CON(Y), -CON(Y)O-, -CON(Y)N(Y)-, -CON(Y)SO₂-, -SO₂N(Y)-, -N(Y)CO-, -N(Y)SO₂-, -N(Y)CON(Y)-, -N(Y)CSN(Y)-, -N(Y)COO-, -C(R'R'')CON(Y)-, -C(R'R'')N(Y)CO-, -C(R'R'')N(Y)CON(Y)-, kur: Y, R'' un R''' ir, kā noteikts 1. pretenzijā.

4. Savienojums ar formulu (I), kā noteikts pretenzijās no 1. līdz 3., kur:

R1 ir ūdeņraža atoms, trihlormetilgrupa, trifluormetilgrupa, halogēna atoms, ciāngrupa, OH, OR8, NR9R10, CONR12R13 vai eventuāli aizvietota grupa, kas ir izvēlēta no lineāras virknes vai sazarotas C₁₋₈alkilgrupas, C₂₋₈alkenilgrupas vai C₂₋₈alkinilgrupas, C₃₋₈cikloalkilgrupas, C₃₋₈cikloalkenilgrupas, heterociklilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas, kur:

R8, R9, R10, R12 un R13 ir, kā noteikts 1. pretenzijā.

5. Savienojums ar formulu (I), kā noteikts pretenzijās no 1. līdz 4., kur:

R1 ir ūdeņraža atoms, trihlormetilgrupa, trifluormetilgrupa, halogēna atoms un ciāngrupa.

6. Savienojums ar formulu (I), kā noteikts pretenzijās no 1. līdz 3., kur:

R2 ir ūdeņraža atoms vai NR14R15, kur:

R14 un R15 neatkarīgi ir ūdeņraža atoms vai eventuāli aizvietota grupa, kas ir izvēlēta no lineāras virknes vai sazarotas C₁₋₈alkilgrupas, C₃₋₈cikloalkilgrupas, heterociklilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas.

7. Savienojums ar formulu (I), kā noteikts pretenzijās no 1. līdz 3., kur:

R3, R4, R5 un R6 katrs neatkarīgi ir ūdeņraža atoms, halogēna atoms, trifluormetilgrupa, trihlormetilgrupa vai ciāngrupa.

8. Savienojums ar formulu (I), kā noteikts pretenzijās no 1. līdz 3., kur:

R7 ir eventuāli aizvietota grupa, kas ir izvēlēta no lineāras virknes vai sazarotas C₁₋₈alkilgrupas, C₃₋₈cikloalkilgrupas, C₃₋₈cikloalkenilgrupas, heterociklilgrupas, arilgrupas un heteroarilgrupas.

9. Savienojums ar formulu (I) vai tā farmaceitiski pieņemams sāls, kā noteikts pretenzijās no 1. līdz 8., kas ir izvēlēts no grupas, kas sastāv no:

1-[3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-3-(4-trifluormetilfenil)urīnvielas,

2,5-difluor-N-[3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]benzolsulfonamīda,

N-(4-hlorfenil)-3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)benzamīda,

N-(4-terc-butilfenil)-3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)benzamīda,

1-(4-hlor-3-trifluormetilfenil)-3-[3-[1-(2-fluoretil)-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il]fenil]urīnvielas,

furān-2-sulfonskābes [3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]amīda,

tiofēn-3-sulfonskābes [3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]amīda,

1-[3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-3-p-tolilurīnvielas,

1-(4-hlorfenil)-3-[3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]urīnvielas,

1-[3-(1-etil-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-3-(4-trifluormetilfenil)urīnvielas,

1-[3-(1-cianometil-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-3-(4-trifluormetilfenil)urīnvielas,

1-[3-[4-(2-aminopiridin-4-il)-1H-pirazol-3-il]fenil]-3-(4-trifluormetilfenil)urīnvielas,

1-[3-[1-(2-fluoretil)-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il]fenil]-3-(4-trifluormetilfenil)urīnvielas,

1-[3-[1-(2-hidroksietil)-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il]fenil]-3-(4-trifluormetilfenil)urīnvielas,

1-[3-(1-piperidin-4-il-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-3-(4-trifluormetilfenil)urīnvielas,

N-[3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-2-(4-trifluormetilfenil)acetamīda,

N-[4-(3-[3-(4-trifluormetilfenil)ureido]fenil)-1H-pirazol-4-il]piridin-2-il]acetamīda,

N-[2,4-difluor-3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, tiofēn-3-sulfonskābes [2,4-difluor-3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]amīda, furān-2-sulfonskābes [2,4-difluor-3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]amīda, propān-1-sulfonskābes [2,4-difluor-3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]amīda, 1-(4-*terc*-butilfenil)-3-[3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]urīnvielas, 1-[4-(cianodimetilmetil)fenil]-3-[3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]urīnvielas, 1-[2-fluor-5-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-3-(4-trifluorometilfenil)urīnvielas, 1-(2-fluor-4-trifluorometilfenil)-3-[3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]urīnvielas, ciklopropānsulfonskābes [2,4-difluor-3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]amīda, 2,2,2-trifluoretānsulfonskābes [2,4-difluor-3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]amīda, N-[2,4-difluor-3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-C,C,C-trifluorometānsulfonamīda, cikloheksānsulfonskābes [2,4-difluor-3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]amīda, 1-[3-(4-pirimidin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-3-(4-trifluorometilfenil)urīnvielas, 1-[3-[4-(2-aminopirimidin-4-il)-1H-pirazol-3-il]fenil]-3-(4-trifluorometilfenil)urīnvielas, N-[4-(3-[3-(4-trifluorometilfenil)ureido]fenil)-1H-pirazol-4-il]pirimidin-2-il]acetamīda, 2,5-difluor-N-[3-(4-pirimidin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]benzolsulfonamīda, N-[3-[4-(2-aminopirimidin-4-il)-1H-pirazol-3-il]fenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, N-(4-[3-[3-(2,5-difluorbenzolsulfonilamino)fenil]-1H-pirazol-4-il]pirimidin-2-il]acetamīda, N-[2,4-difluor-3-(4-pirimidin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, N-[3-[4-(2-aminopirimidin-4-il)-1H-pirazol-3-il]-2,4-difluorfenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, N-(4-[3-[3-(2,5-difluorbenzolsulfonilamino)-2,6-difluorfenil]-1H-pirazol-4-il]pirimidin-2-il]pirimidin-2-il]acetamīda, N-[4-(3-[3-(4-trifluorometilfenil)ureido]fenil)-1H-pirazol-4-il]piridin-2-il]propionamīda, N-[4-(3-[3-(4-trifluorometilfenil)ureido]fenil)-1H-pirazol-4-il]piridin-2-il]izobutiramīda, ciklopentānkarbonskābes [4-(3-[3-(4-trifluorometilfenil)ureido]fenil)-1H-pirazol-4-il]piridin-2-il]amīda, 2-[3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-N-(4-trifluorometilfenil)acetamīda, 4-hidroksi-N-[4-(3-[3-(4-trifluorometilfenil)ureido]fenil)-1H-pirazol-4-il]piridin-2-il]butiramīda, N-(4-[3-[3-(2,5-difluorbenzolsulfonilamino)fenil]-1H-pirazol-4-il]-piridin-2-il]acetamīda, N-(4-[3-[3-(2,5-difluorbenzolsulfonilamino)-2,6-difluorfenil]-1H-pirazol-4-il]piridin-2-il]acetamīda, 3-(4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)-N-(4-trifluorometilfenil)benzamīda, 4-piridin-4-il-3-[3-(4-trifluorometilfenil)ureido]fenil]pirazol-1-karbonskābes etilestera, 1-[3-(1-metil-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-3-(4-trifluorometilfenil)urīnvielas, 1-[3-(1-butil-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-3-(4-trifluorometilfenil)urīnvielas, 1-[3-(1-izobutil-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-3-(4-trifluorometilfenil)urīnvielas, N-[3-(1-etil-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)-2,4-difluorfenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, N-[2,4-difluor-3-(1-metil-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, N-[2,4-difluor-3-[4-(2-metilaminopirimidin-4-il)-1H-pirazol-3-il]fenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, N-[3-[4-(2-etilaminopirimidin-4-il)-1H-pirazol-3-il]-2,4-difluorfenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, N-[3-[4-(2-etilaminopirimidin-4-il)-1H-pirazol-3-il]fenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda,

N-[2,4-difluor-3-(1-izobutil-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)fenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, N-[3-(1-etil-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)-2,4-difluorfenil]-2-fluorbenzolsulfonamīda, N-[3-(1-etil-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)-2,4-difluorfenil]-3-fluorbenzolsulfonamīda, N-[3-(1-etil-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)-4-fluorfenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, N-[3-(1-etil-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)-2-fluorfenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, N-[3-[4-(2-aminopirimidin-4-il)-1-etil-1H-pirazol-3-il]-2,4-difluorfenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, N-[2,4-difluor-3-[1-(2-piperidin-1-iletil)-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il]fenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, N-[2,4-difluor-3-[1-(2-morfolin-4-iletil)-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il]fenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, N-(2,4-difluor-3-[1-[2-(4-metilpiperazin-1-il)etil]-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il]fenil)-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, N-[3-[1-(2-dimetilaminoetil)-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il]-2,4-difluorfenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda, (2,5-difluorbenzil)-[3-(1-etil-4-piridin-4-il-1H-pirazol-3-il)-2,4-difluorfenil]amīna, 4-[3-[3-(2,5-difluorbenziloksi)-2,6-difluorfenil]-1-etil-1H-pirazol-4-il]piridīna un N-[3-[4-(2-aminopirimidin-4-il)-1-etil-1H-pirazol-3-il]-2,4-difluorfenil]-2,5-difluorbenzolsulfonamīda.

10. *In vitro* metode RAF saimes aktivitātes inhibēšanai, kas ietver minētā receptora pakļaušanu kontaktam ar efektīvu daudzumu savienojuma, kā noteikts 1. pretenzijā.

11. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur terapeitiski efektīvu daudzumu savienojuma ar formulu (I) vai tā farmaceutiski pieņemama sāls, kā noteikts 1. pretenzijā, un vismaz vienu farmaceutiski pieņemamu palīgvielu, nesēju un/vai atšķaidītāju.

12. Farmaceutiskā kompozīcija saskaņā ar 11. pretenziju, kas turklāt satur vienu vai vairākus ķīmijterapijas līdzekļus.

13. Produkts vai komplekts, kas satur savienojumu ar formulu (I) vai tā farmaceutiski pieņemamu sāli, kā noteikts 1. pretenzijā, vai tā farmaceutisku kompozīciju, kā noteikts 11. pretenzijā, un vienu vai vairākus ķīmijterapijas līdzekļus, kā kombinēts preparāts vienlaicīgi, atsevišķai vai secīgi lietošanai pretvēža terapijā.

14. Savienojums ar formulu (I) vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kā noteikts 1. pretenzijā, izmantošanai par medikamentu.

15. Savienojums ar formulu (I) vai tā farmaceutiski pieņemams sāls, kā noteikts 1. pretenzijā, izmantošanai vēža ārstēšanas metodē.

Papildu aizsardzības sertifikāti

(Eiropas Parlamenta un Padomes Regulas (EK) Nr. 469/2009 (kodificētā versija) (06.05.2009) par papildu aizsardzības sertifikātu zālēm 11. panta 1. daļa; un Eiropas Parlamenta un Padomes Regulas (EK) Nr. 1610/96 (23.06.1996) par papildu aizsardzības sertifikāta ieviešanu attiecībā uz augu aizsardzības līdzekļiem 11. pants). Sertifikāta numurā "z" nozīmē zāles, bet "a" - augu aizsardzības līdzekli.

- | | |
|---|------------------------|
| (21) C/LV2009/0010/z | (22) 18.12.2009 |
| (54) Hinazolīna atvasinājumi | |
| (73) ASTRAZENECA AB, 15185 Södertälje, SE | |
| (74) Armīns PĒTERSONS, Aģentūra PĒTERSONA PATENTS, a/k 61, Rīga LV-1010, LV | |
| (92) EU/1/09/526/001, | 24.06.2009 |
| CH Nr. 56'154, | 02.03.2004 |
| (93) EU/1/09/526/001, | 24.06.2009 |
| CH Nr. 56'154, | 02.03.2004 |
| (94) 02.03.2019 | |
| (95) Gefitinibs vai tā farmaceitiski pieņemams sāls (IRESSA) | |
| (96) 96910134.4, | 23.04.1996 |
| (97) EP0823900, | 27.12.2000 |
-

(71) Pieteicējs
(72) Izgudrotājs
(73) Īpašnieks

(21) Pieteikuma numurs
(51) Klase

(71) Pieteicējs
(72) Izgudrotājs
(73) Īpašnieks

(21) Pieteikuma numurs
(51) Klase

(71) Pieteicējs
(72) Izgudrotājs
(73) Īpašnieks

(21) Pieteikuma numurs
(51) Klase

Izgudrojumu pieteikumu publikācijas

A
ANCĀNS, Dainis P-12-96 B01F13/00
ASSA ABLOY
Rychnov, s.r.o P-12-42 E05B31/00

B
BALTIŅŠ, Arturs P-11-68 F26B3/00
- F26B15/00
- B01J29/00
BALTROTORS, SIA P-11-62 F16F7/02
- B66C3/00
BIRMANS, Anatolijs P-11-69 C07C243/12
- A61K31/205
- A61P9/00
- C01B21/16
- C07C69/90
- C07D311/46
BIRZIETIS, Gints P-11-68 F26B3/00
- F26B15/00
- B01J29/00
BRĒMERS, Gunārs P-11-68 F26B3/00
- F26B15/00
- B01J29/00

D
DAUGAVIETIS, Māris P-12-105 C11B9/02
DAUGAVIETIS, Uldis P-12-105 C11B9/02

G
GAITNIEKS, Tālis P-12-70 C12N1/14
- A01N63/04

H
HOLDA, Jiri P-12-42 E05B31/00

K
KAĶĪTIS, Aivars P-12-96 B01F13/00
KALNIŅA, Solvita P-12-113 A21D13/08
KALVIŅŠ, Ivars P-11-69 C07C243/12
- A61K31/205
- A61P9/00
- C01B21/16
- C07C69/90
- C07D311/46
KANCEVIČA, Liene P-12-94 F24J2/00
- F24J2/40
KORHONEN, Kari P-12-70 C12N1/14
- A01N63/04
KRONBERGS, Ēriks P-12-95 B30B1/16
KUNKULBERGA, Daiga P-12-113 A21D13/08

L
LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE P-11-68 F26B3/00
- F26B15/00
- B01J29/00
- P-12-94 F24J2/00
- F24J2/40
- P-12-95 B30B1/16
- P-12-96 B01F13/00
- P-12-112 B65G33/24
- P-12-113 A21D13/08

LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTES AĢENTŪRA 'LAUKSAIMNIECĪBAS TEHNIKAS ZINĀTNISKAIS INSTITŪTS' P-11-68 F26B3/00
- F26B15/00
- B01J29/00

LATVIJAS VALSTS MEŽZINĀTNES INSTITŪTS 'SILAVA' P-12-105 C11B9/02
- P-12-70 C12N1/14
- A01N63/04
LAURS, Armīns P-12-112 B65G33/24

M

MARTINSONS, Andris P-11-62 F16F7/02
- B66C3/00
MIHAILOVA, Alīna P-12-70 C12N1/14
- A01N63/04

N

NULLE, Imants P-12-96 B01F13/00

O

OZOLLAPIŅŠ, Mārtiņš P-12-96 B01F13/00

P

PRIEKULIS, Juris P-12-112 B65G33/24
PUTĀNS, Henriks P-12-94 F24J2/00
- F24J2/40

R

REPŠA, Edgars P-12-95 B30B1/16
RUCIŅŠ, Adolfs P-11-68 F26B3/00
- F26B15/00
- B01J29/00

S

SALIŅŠ, Ansis P-12-112 B65G33/24
SPALVIS, Kaspars P-12-105 C11B9/02

Š

ŠĶĒLE, Arnolds P-11-68 F26B3/00
- F26B15/00
- B01J29/00

T

TETRA, SIA P-11-69 C07C243/12
- A61K31/205
- A61P9/00
- C01B21/16
- C07C69/90
- C07D311/46

V

VĒVERIS, Māris P-11-69 C07C243/12
- A61K31/205
- A61P9/00
- C01B21/16
- C07C69/90
- C07D311/46
VICINSKIS, Artis P-12-112 B65G33/24

Z

ZAGORSKA, Viktorija P-12-94 F24J2/00
- F24J2/40
ZIEMELIS, Imants P-12-94 F24J2/00
- F24J2/40

Izgudrojumu patentu publikācijas

A
ANCĀNS, Dainis P-12-96 B01F13/00
ANIMA LAB, SIA P-11-173 A61K35/20
- A23L1/09
- A23L1/305

B
BAGIROVS, Emīls P-10-66 G01N33/49
BAIDAK, Viktors P-10-66 G01N33/49
BALTROTORS, SIA P-11-18 B66C13/06
BEITĀNS, Ivars P-12-119 A63G31/16
- B64D25/02

F
FRIDRIHSONS, Jānis P-11-01 C02F1/32
- B01J47/00
- B01D36/00
- C02F1/30
- C02F1/42
- A01K63/04
- F21V33/00
- C02F1/30
- C02F1/42
- A01K63/04
- F21V33/00
FRIDRIHSONS, Māris P-11-16 C02F1/30
- C02F1/42
- A01K63/04
- F21V33/00

G
GIRGENSONE, Māra P-10-66 G01N33/49
GUSAREVS, Igors P-11-136 C02F11/12
- C02F11/18
- F26B21/06

I
INTERNATIONAL CLASSIC COSMOENERGY FEDERATION P-10-66 G01N33/49

J
JERMOLAJEVŠ, Jevgeņijs P-11-173 A61K35/20
- A23L1/09
- A23L1/305

K
KAĶĪTIS, Aivars P-12-96 B01F13/00
KANCEVIČA, Liene P-12-94 F24J2/00
- F24J2/40

KRASILŅIKOVA, Jelena P-10-66 G01N33/49
KRONBERGS, Ēriks P-12-95 B30B1/16

L
LATVIJAS LAUKSAIMNIECĪBAS UNIVERSITĀTE P-12-94 F24J2/00
- F24J2/40
- P-12-95 B30B1/16
- P-12-96 B01F13/00
- P-12-112 B65G33/24
LAURS, Armīns P-12-112 B65G33/24

M
MARTINSONS, Andris P-11-18 B66C13/06

N
NULLE, Imants P-12-96 B01F13/00

O
OZOLLAPIŅŠ, Mārtiņš P-12-96 B01F13/00

(71) Pieteicējs (72) Izgudrotājs (73) Īpašnieks	(21) Pieteikuma numurs	(51) Klase
P		
PEŠKOVA, Lilija	P-11-173	A61K35/20
-	-	A23L1/09
-	-	A23L1/305
PRIEKULIS, Juris	P-12-112	B65G33/24
PUTĀNS, Henriks	P-12-94	F24J2/00
-	-	F24J2/40
R		
REPŠA, Edgars	P-12-95	B30B1/16
RĪGAS STRADIŅA UNIVERSITĀTE	P-10-66	G01N33/49
-	P-11-173	A61K35/20
-	-	A23L1/09
-	-	A23L1/305
S		
SALIŅŠ, Ansis	P-12-112	B65G33/24
SCHULTHEISS, Joachim	P-12-68	A23K1/16
-	-	A23K1/18
-	-	A23K1/02
SERGELIS, Irina	P-10-66	G01N33/49
SF 17, SIA	P-12-68	A23K1/16
-	-	A23K1/18
-	-	A23K1/02
V		
VICINSKIS, Artis	P-12-112	B65G33/24
VĪTOLS, Guntis	P-11-173	A61K35/20
-	-	A23L1/09
-	-	A23L1/305
Z		
ZAGORSKA, Viktorija	P-12-94	F24J2/00
-	-	F24J2/40
ZIEMELIS, Imants	P-12-94	F24J2/00
-	-	F24J2/40
ZIEMELIS, Raitis	P-11-39	C05F11/00
-	-	C05F11/02
-	-	C05F15/00

(21) Pieteikuma numurs	(11) Publikācijas vai patenta numurs	(51) Klase	(21) Pieteikuma numurs	(11) Publikācijas vai patenta numurs	(51) Klase
Izgdrojumu pieteikumu publikācijas			Izgdrojumu patentu publikācijas		
P-11-62	14610	F16F7/02	P-10-66	14437	G01N33/49
-		B66C3/00	P-11-01	14555	C02F1/32
P-11-68	14612	F26B3/00	-		B01J47/00
-		F26B15/00	-		B01D36/00
-		B01J29/00	P-11-16	14576	C02F1/30
P-11-69	14606	C07C243/12	-		C02F1/42
-		A61K31/205	-		A01K63/04
-		A61P9/00	-		F21V33/00
-		C01B21/16	P-11-18	14574	B66C13/06
-		C07C69/90	P-11-31	14577	C02F1/30
-		C07D311/46	-		C02F1/42
P-12-42	14609	E05B31/00	-		A01K63/04
P-12-70	14608	C12N1/14	-		F21V33/00
-		A01N63/04	P-11-39	14579	C05F11/00
P-12-94	14611	F24J2/00	-		C05F11/02
-		F24J2/40	-		C05F15/00
P-12-95	14604	B30B1/16	P-11-136	14578	C02F11/12
P-12-96	14603	B01F13/00	-		C02F11/18
P-12-105	14607	C11B9/02	-		F26B21/06
P-12-112	14605	B65G33/24	P-11-173	14500	A61K35/20
P-12-113	14602	A21D13/08	-		A23L1/09
			-		A23L1/305
			P-12-68	14559	A23K1/16
			-		A23K1/18
			-		A23K1/02
			P-12-94	14611	F24J2/00
			-		F24J2/40
			P-12-95	14604	B30B1/16
			P-12-96	14603	B01F13/00
			P-12-112	14605	B65G33/24
			P-12-119	14571	A63G31/16
			-		B64D25/02

Reģistrētās preču zīmes

Publikācijas par reģistrētajām preču zīmēm sakārtotas to reģistrācijas numuru secībā. Katra publikācija satur visus datus, kas reģistrācijas brīdī iekļauti Valsts reģistra ziņās.

Preču zīmes reģistrācija ir spēkā 10 gadus, skaitot no pieteikuma datuma, ja tā netiek pirms šā termiņa dzēsta pēc preču zīmes īpašnieka iniciatīvas, atzīta par spēkā neesošu vai atcelta (likums „Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm”, 21. panta pirmā daļa). Ar dienu, kad publicēts paziņojums par preču zīmes reģistrāciju (datums, kas norādīts katras lappuses lappuses augšmalā), pilnā apjomā stājas spēkā izņēmuma tiesības uz reģistrēto zīmi, ieskaitot izņēmuma tiesības attiecībā pret citām personām (šā likuma 4. panta divpadsmitā daļa).

Ar publikācijas dienu iestājas arī iebildumu periods. Ieinteresētās personas, samaksājot attiecīgu nodevu, triju mēnešu laikā no šīs dienas var iesniegt Patentu valdes Apelācijas padomē rakstveida iebildumu pret zīmes reģistrāciju, to pienācīgi argumentējot un pamatojot ar atsaucēm uz likuma noteikumiem saskaņā ar likuma „Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm” 18. pantu.

Starptautiski pieņemtie kodi (INID kodi), kas izmantoti preču zīmju datu identificēšanai:

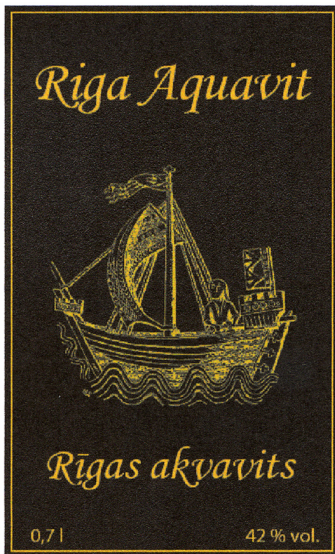
- | | |
|---|--|
| <p>(111) Reģistrācijas numurs
Registration number</p> <p>(116) Reģistrācijas atjaunojuma numurs, ja tas atšķiras no sākotnējā reģistrācijas numura
Renewal number where different from initial registration number</p> <p>(141) Reģistrācijas darbības pārtraukšanas datums
Date of the termination of the registration</p> <p>(151) Reģistrācijas datums
Registration date</p> <p>(210) Pieteikuma numurs
Application number</p> <p>(220) Pieteikuma datums
Filing date of the application</p> <p>(230) Izstādes prioritātes dati
Exhibition priority data</p> <p>(300) Konvencijas prioritātes dati:
pieteikuma numurs, pieteikuma datums, valsts kods
Convention priority data:
application number, filing date, code of country</p> <p>(350) Senioritātes dati (attiecībā uz Latviju):
reģistrācijas numurs, reģistrācijas datums
Seniority data (in relation to Latvia):
registration number, registration date</p> <p>(399) Ziņas par pārreģistrēto dokumentu, kas bija spēkā PSRS (pārreģistrētajām zīmēm)
Data relating to the registration previously in force in SU (for re-registered marks)</p> <p>(511) Preču un pakalpojumu starptautiskās klasifikācijas (Nicas klasifikācijas) indeksi; preču un/vai pakalpojumu saraksts
Indication of the International Classification of Goods and Services (Nice Classification); list of goods and/or services</p> <p>(526) Zīmes elementi, kas izslēgti no aizsardzības (disklamācija)
Elements excluded from protection (disclaimer)</p> <p>(531) Zīmju figurālo elementu starptautiskās klasifikācijas (Vīnes klasifikācijas - CFE) indeksi
Indication of the International Classification of the Figurative Elements of Marks (Vienna Classification - CFE)</p> <p>(540) Zīmes attēls
Reproduction of the mark</p> <p>(551) Norāde, ka šī zīme ir kolektīvā preču zīme
Indication that the mark is a collective mark</p> <p>(554) Telpiska zīme
Three-dimensional mark</p> <p>(555) Hologrāfiska zīme
Hologram mark</p> <p>(556) Skaņu zīme, tās raksturojums
Sound mark, including characteristics</p> <p>(571) Zīmes apraksts
Description of mark</p> | <p>(580) Reģistrācijas grozījumu ieraksta datums (īpašumtiesību pāreja, grozījumi vārdos, nosaukumos vai adresēs, reģistrācijas darbības pārtraukšana u.tml.)
Date of recording of a transaction in respect of the registration (change in ownership, change in name or address, termination of protection, etc.)</p> <p>(591) Norāde par zīmes aizsardzību krāsās
Indication concerning colours claimed</p> <p>(600) Juridiski saistītu pieteikumu dati, piemēram, dati par bij. PSRS pieteikumu, uz kuru saskaņā ar LR Ministru Padomes 1992. gada 28. februāra lēmumu Nr. 72 pamatots Latvijas pieteikums, vai Kopienas preču zīmes pieteikumu
References to legally related applications, e.g., data of the SU application, on which LV application is based according to the provisions of the Decision of the Council of Ministers of the Republic of Latvia No. 72, adopted on February 28, 1992, or a Community Trade Mark application</p> <p>(641) Sākotnējā pieteikuma dati (sadalīta pieteikuma gadījumā)
Initial application data (in case of divided application)</p> <p>(646) Sākotnējās reģistrācijas dati (sadalītas reģistrācijas gadījumā)
Initial registration data (in case of divided registration)</p> <p>(732) Zīmes īpašnieks, adrese, valsts kods
Name and address of the owner of the mark, code of country</p> <p>(740) Pārstāvis (patentpilnvarotais, preču zīmju aģents), adrese
Representative (patent attorney, trademark agent), address</p> <p>(791) Licenciāts, adrese, valsts kods
Name and address of the licensee, code of country</p> <p>(881) Nacionālās reģistrācijas, kas aizstāta ar starptautisko reģistrāciju, numurs un datums
Number and date of the national registration replaced by an international registration</p> <p>(885) Starptautiskās reģistrācijas, kas pārveidota par nacionālo reģistrāciju, numurs un datums
Number and date of the international registration transformed into a national registration</p> |
|---|--|

(111) **Reģ. Nr.** M 65 368 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
(210) **Pieteik.** M-11-1158 (220) **Pieteik.dat.** 06.09.2011

SWIPE

- (732) **Īpašn.** NOKIA CORPORATION; Keilalahdentie 4, 02150 Espoo, FI
- (740) **Pārstāvis** Ieva ŠTĀLA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010
- (511) **9** mobilie telefoni, viedtālruni; piederumi un rezerves daļas mobilajiem telefoniem un viedtālruniem

(111) **Reģ. Nr.** M 65 369 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-11-965 (220) **Pieteik.dat.** 21.09.2011
 (531) **CFE ind.** 8.3.9; 25.1.17; 29.1.12



(591) **Krāsu salikums** zeltains, melns
 (732) **Īpašn.** Valeri PESELEV; Meyerhof str. 5, 24106 Kiel, DE
 (740) **Pārstāvis** Ludmila IVANOVA, Patentu aģentūra TESIO; Kronvalda bulvāris 3, Rīga LV-1010
 (511) **33** akvavīts no Rīgas

(111) **Reģ. Nr.** M 65 370 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-11-1181 (220) **Pieteik.dat.** 13.09.2011

FAVORITE

(732) **Īpašn.** BISOKS, SIA; Kalnciema iela 74a, Rīga LV-1046, LV
 (740) **Pārstāvis** Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra 'KDK'; Dzērbenes iela 27, Rīga LV-1006
 (511) **25** apģērbi; zeķes, tai skaitā īszeķes

(111) **Reģ. Nr.** M 65 371 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-11-1599 (220) **Pieteik.dat.** 29.12.2011
 (531) **CFE ind.** 24.9.1; 24.9.5; 24.9.16



(732) **Īpašn.** VIP FASHION STYLE, SIA; Krišjāņa Barona iela 70-2, Rīga LV-1001, LV
 (511) **35** apģērbi, apavu un to aksesuāru mazumtirdzniecības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 65 372 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-9 (220) **Pieteik.dat.** 05.01.2012
 (531) **CFE ind.** 1.1.1; 1.1.2; 1.1.10; 27.5.8; 29.1.12



(591) **Krāsu salikums** ziels, pelēks
 (732) **Īpašn.** ENERGO STAR, SIA; Mālkalnes prospekts 26-16, Ogre, Ogres nov. LV-5001, LV
 (511) **37** būvniecība; elektroenerģijas ražošanas un pārvades iekārtu, līniju, tīklu montāža, remonts un tehniskā apkope; sakaru iekārtu montāža, remonts un tehniskā apkope; torņu un mastu montāža
42 projektēšanas pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 65 373 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-27 (220) **Pieteik.dat.** 10.01.2012

tao

(732) **Īpašn.** CONSULTING AGENCY "TIMUR OSTROVSKIY & PARTNERS", SIA; Republikas laukums 3-408, Rīga LV-1010, LV
 (740) **Pārstāvis** Jūlija SUŠKO; Republikas laukums 3-408, Rīga LV-1010
 (511) **35** darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi
36 apdrošināšana; finanšu lietas; darījumi ar naudu; nekustamā īpašuma lietas
42 zinātniskie un tehnoloģiskie pakalpojumi, izpēte un projektēšana šajās jomās; rūpnieciskā izpēte un izstrāde; datoru aparatūras un programmatūras projektēšana, izstrāde un pilnveidošana
43 apgāde ar uzturu; viesu izmitināšana
45 juridiskie pakalpojumi; drošības pakalpojumi personu un īpašuma aizsardzībai

(111) **Reģ. Nr.** M 65 374 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-28 (220) **Pieteik.dat.** 10.01.2012

coachtao

(732) **Īpašn.** CONSULTING AGENCY "TIMUR OSTROVSKIY & PARTNERS", SIA; Republikas laukums 3-408, Rīga LV-1010, LV
 (740) **Pārstāvis** Jūlija SUŠKO; Republikas laukums 3-408, Rīga LV-1010
 (511) **35** darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana; biroja darbi
36 apdrošināšana; finanšu lietas; darījumi ar naudu; nekustamā īpašuma lietas
42 zinātniskie un tehnoloģiskie pakalpojumi, izpēte un projektēšana šajās jomās; rūpnieciskā izpēte un izstrāde; datoru aparatūras un programmatūras projektēšana, izstrāde un pilnveidošana
43 apgāde ar uzturu; viesu izmitināšana
45 juridiskie pakalpojumi; drošības pakalpojumi personu un īpašuma aizsardzībai

(111) **Reģ. Nr.** M 65 375 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-63 (220) **Pieteik.dat.** 18.01.2012
 (531) **CFE ind.** 15.7.1; 29.1.12



(591) **Krāsu salikums** gaiši zaļš, zaļš
 (732) **Īpašn.** Pēteris URTĀNS; Stokholmas iela 60, Rīga LV-1014, LV
 (511) **44** smadzeņu darbības uzlabošanas treniņi

(111) **Reģ. Nr.** M 65 376 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-67 (220) **Pieteik.dat.** 18.01.2012

TAZOVSKY

(732) **Īpašn.** S.C. P.P. DISTRIBUTORS ROMANIA S.R.L.; 24, Alexandru Donici Street, 2-4th floor, district 2, Bucharest, RO
 (740) **Pārstāvis** Ieva JUDINSKA-BANDENIECE, Zvērinātu advokātu birojs "KRODERE & JUDINSKA"; Dzirnau iela 60-32, Rīga LV-1050
 (511) **33** alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

(111) **Reģ. Nr.** M 65 377 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-68 (220) **Pieteik.dat.** 18.01.2012

Intelligently Distilled

(732) **Īpašn.** S.C. P.P. DISTRIBUTORS ROMANIA S.R.L.; 24, Alexandru Donici Street, 2-4th floor, district 2, Bucharest, RO
 (740) **Pārstāvis** Ieva JUDINSKA-BANDENIECE, Zvērinātu advokātu birojs "KRODERE & JUDINSKA"; Dzirnau iela 60-32, Rīga LV-1050
 (511) **33** alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

(111) **Reģ. Nr.** M 65 378 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-69 (220) **Pieteik.dat.** 18.01.2012

Intelligently Distilled Premium Vodka

(732) **Īpašn.** S.C. P.P. DISTRIBUTORS ROMANIA S.R.L.; 24, Alexandru Donici Street, 2-4th floor, district 2, Bucharest, RO
 (740) **Pārstāvis** Ieva JUDINSKA-BANDENIECE, Zvērinātu advokātu birojs "KRODERE & JUDINSKA"; Dzirnau iela 60-32, Rīga LV-1050
 (511) **33** alkoholiskie dzērieni, proti, degvīns

(111) **Reģ. Nr.** M 65 379 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-70 (220) **Pieteik.dat.** 18.01.2012
 (531) **CFE ind.** 1.1.1; 1.1.2; 1.1.10; 29.1.14



(591) **Krāsu salikums** sarkans, pelēks, melns, balts
 (732) **Īpašn.** S.C. P.P. DISTRIBUTORS ROMANIA S.R.L.; 24, Alexandru Donici Street, 2-4th floor, district 2, Bucharest, RO
 (740) **Pārstāvis** Ieva JUDINSKA-BANDENIECE, Zvērinātu advokātu birojs "KRODERE & JUDINSKA"; Dzirnau iela 60-32, Rīga LV-1050
 (511) **33** alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

(111) **Reģ. Nr.** M 65 380 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-71 (220) **Pieteik.dat.** 18.01.2012
 (531) **CFE ind.** 1.1.1; 1.1.2; 1.1.10; 27.1.6; 29.1.13



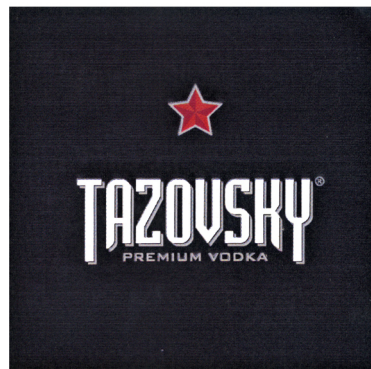
(591) **Krāsu salikums** sarkans, pelēks, melns
 (732) **Īpašn.** S.C. P.P. DISTRIBUTORS ROMANIA S.R.L.; 24, Alexandru Donici Street, 2-4th floor, district 2, Bucharest, RO
 (740) **Pārstāvis** Ieva JUDINSKA-BANDENIECE, Zvērinātu advokātu birojs "KRODERE & JUDINSKA"; Dzirnau iela 60-32, Rīga LV-1050
 (511) **33** alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

(111) **Reģ. Nr.** M 65 381 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-72 (220) **Pieteik.dat.** 18.01.2012
 (531) **CFE ind.** 1.1.1; 1.1.2; 1.1.10



(732) **Īpašn.** S.C. P.P. DISTRIBUTORS ROMANIA S.R.L.; 24, Alexandru Donici Street, 2-4th floor, district 2, Bucharest, RO
 (740) **Pārstāvis** Ieva JUDINSKA-BANDENIECE, Zvērinātu advokātu birojs "KRODERE & JUDINSKA"; Dzirnau iela 60-32, Rīga LV-1050
 (511) **33** alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

(111) **Reģ. Nr.** M 65 382 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-73 (220) **Pieteik.dat.** 18.01.2012
 (531) **CFE ind.** 1.1.1; 1.1.2; 1.1.10; 27.5.24; 29.1.14



(591) **Krāsu salikums** sarkans, pelēks, melns, balts
 (732) **Īpašn.** S.C. P.P. DISTRIBUTORS ROMANIA S.R.L.; 24, Alexandru Donici Street, 2-4th floor, district 2, Bucharest, RO
 (740) **Pārstāvis** Ieva JUDINSKA-BANDENIECE, Zvērinātu advokātu birojs "KRODERE & JUDINSKA"; Dzirnau iela 60-32, Rīga LV-1050

(511) **33** alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

(111) **Reģ. Nr.** M 65 383 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
(210) **Pieteik.** M-12-156 (220) **Pieteik.dat.** 06.02.2012

177

(732) **Īpašn.** LATTELECOM, SIA; Dzirnāvu iela 105, Rīga LV-1011, LV
(740) **Pārstāvis** Ludmila IVANOVA, Patentu aģentūra TESIO; Kronvalda bulvāris 3, Rīga LV-1010
(511) **35** reklāmas materiālu izplatīšana; datu un informācijas vākšana, glabāšana, analīze un atjaunināšana, ciktāl tas attiecas uz šo klasi; datu apkopošana un sistematizēšana datu bāzēs
38 telekomunikāciju pakalpojumi, konsultācijas un informācijas sniegšana šajā jomā

(111) **Reģ. Nr.** M 65 384 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
(210) **Pieteik.** M-12-231 (220) **Pieteik.dat.** 22.02.2012

KURZEMNIEKU

(732) **Īpašn.** SALDUS MAIZNIEKS, SIA; Kuldīgas iela 88, Saldus, Saldus nov. LV-3801, LV
(511) **30** maize, maizes un konditorejas izstrādājumi; milti un labības produkti

(111) **Reģ. Nr.** M 65 385 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
(210) **Pieteik.** M-12-239 (220) **Pieteik.dat.** 23.07.2012
(531) **CFE ind.** 26.11.2; 26.11.8; 29.1.11



CBL Bank

(591) **Krāsu salikums** pelēks
(732) **Īpašn.** CITADELE BANKA, AS; Republikas laukums 2A, Rīga LV-1010, LV
(511) **36** apdrošināšana; finanšu lietas; darījumi ar naudu; nekustamā īpašuma lietas

(111) **Reģ. Nr.** M 65 386 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
(210) **Pieteik.** M-12-259 (220) **Pieteik.dat.** 29.02.2012

YMWAS

(732) **Īpašn.** KRKA, tovarena zdravil, d.d., Novo mesto; Šmarješka cesta 6, SI-8501 Novo mesto, SI
(740) **Pārstāvis** Ieva ŠTĀLA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010
(511) **5** farmaceitiskie preparāti

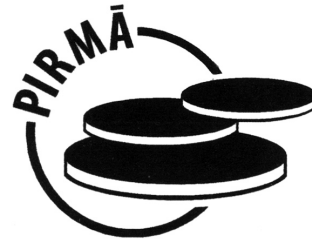
(111) **Reģ. Nr.** M 65 387 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
(210) **Pieteik.** M-12-287 (220) **Pieteik.dat.** 06.03.2012

MINT STREAM

(732) **Īpašn.** PHILIP MORRIS BRANDS SARL; Quai Jeanrenaud 3, CH-2000 Neuchâtel, CH
(740) **Pārstāvis** Vladimirs ANOHINS, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010

(511) **34** tabaka; neapstrādāta vai apstrādāta tabaka; tabakas izstrādājumi, tai skaitā cigāri, cigaretes, cigarillas; tabaka cigarešu uztīšanai, pīpju tabaka, košļājamā tabaka, šņaucamā tabaka, tabaka ar krustnagliņu piedevu, zelējamā tabaka zviedru gaumē "snus"; tabakas aizstājēji (izņemot medicīniskiem nolūkiem paredzētos); smēķēšanas piederumi, tai skaitā cigarešu papīrs un cigarešu sagataves, cigarešu filtri, kārbas tabakai, cigarešu etvijas un pelnu trauki, pīpes, ierīces cigarešu uztīšanai, šķiltavas; sērkokčiņi

(111) **Reģ. Nr.** M 65 388 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
(210) **Pieteik.** M-12-303 (220) **Pieteik.dat.** 18.07.2012
(531) **CFE ind.** 24.5.7; 26.1.1; 26.1.3; 26.1.16; 26.1.19



Skupka24h.lv

(732) **Īpašn.** SAUSAMS, SIA; Aleksandra Čaka iela 66, Rīga LV-1011, LV
(740) **Pārstāvis** Sergejs KUZMINS; Stabu iela 58, Rīga LV-1011
(511) **36** darījumi ar naudu

(111) **Reģ. Nr.** M 65 389 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
(210) **Pieteik.** M-12-372 (220) **Pieteik.dat.** 30.03.2012
(531) **CFE ind.** 20.1.11; 27.5.24



(732) **Īpašn.** TIKKURILA OYJ; Kuninkaalantie 1, FI-01300 Vantaa, FI
(740) **Pārstāvis** Ieva ŠTĀLA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010
(511) **2** krāsas, pernicas, lakas; pretkorozijas līdzekļi, koksnes konservēšanas līdzekļi; krāsvielas; kodnes; neapstrādāti dabiskie sveķi; lokšņveida un pulverveida metāli makslinieciskiem un dekoratīviem nolūkiem un iespieddarbiem; pārklājumi, saistvielas, gruntis, tepes un pildvielas

(111) **Reģ. Nr.** M 65 390 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
(210) **Pieteik.** M-12-401 (220) **Pieteik.dat.** 11.04.2012

RAMDACORDIA

(732) **Īpašn.** NOVARTIS AG; CH-4002 Basel, CH
(740) **Pārstāvis** Vladimirs ANOHINS, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010
(511) **5** farmaceitiskie preparāti

(111) **Reģ. Nr.** M 65 391 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-404 (220) **Pieteik.dat.** 12.04.2012
 (531) **CFE ind.** 5.5.20; 5.5.21; 29.1.12



(591) **Krāsu salikums** brūns, balts
 (732) **Īpašn.** G.A.L., SIA; Daugavas iela 27a, Mārupe, Mārupes nov. LV-2167, LV
 (511) **29** gaļa, gaļas produkti un izstrādājumi, gaļas konservi; mājputnu gaļa, mājputnu gaļas produkti un izstrādājumi, mājputnu gaļas konservi; medījumi, medījumu gaļas produkti un izstrādājumi, medījumu gaļas konservi
30 maize, maizes un konditorejas izstrādājumi

(111) **Reģ. Nr.** M 65 392 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-410 (220) **Pieteik.dat.** 13.04.2012
 (531) **CFE ind.** 1.5.1; 1.5.10; 1.15.15; 29.1.12



(591) **Krāsu salikums** zils, melns
 (732) **Īpašn.** BGS, SIA; Ūnijas iela 8 k-9, Rīga LV-1084, LV
 (511) **1** ķīmikālijas rūpnieciskiem nolūkiem

(111) **Reģ. Nr.** M 65 393 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-425 (220) **Pieteik.dat.** 18.04.2012

RIGHT PEOPLE

(732) **Īpašn.** Aļona SMIRNOVA; Marsa gatve 5-13, Rīga LV-1082, LV
 (511) **16** fotogrāfijas
41 apmācība, proti, kursi un apmācība vizāžas un fotogrāfēšanas jomās

(111) **Reģ. Nr.** M 65 394 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-455 (220) **Pieteik.dat.** 25.04.2012
 (531) **CFE ind.** 5.7.13; 26.1.1; 26.1.4; 26.1.15; 26.1.21; 29.1.13



(591) **Krāsu salikums** tumši sarkans, zaļš, balts

(732) **Īpašn.** SAIME, Lauksaimniecības pakalpojumu kooperatīvā sabiedrība; Melsila iela 21-25, Rīga LV-1046, LV
 (511) **29** gaļa, zivis, mājputni un medījumi; gaļas ekstrakti; konservēti, saldēti, žāvēti (kaltēti) un termiski apstrādāti augļi un dārzeņi; želejas, ievārījumi, kompoti; olas; piens un piena produkti; pārtikas eļļas un tauki
30 kafija, tēja, kakao, kafijas aizstājēji; rīsi; tapioka un sāgo; milti un labības produkti; maize, maizes un konditorejas izstrādājumi; saldējums; cukurs, medus, melases sīrups; raugs, cepamais pulveris; sāls; sinepes; etiķis, garšvielu mērces; garšvielas; pārtikas ledus
31 graudi un lauksaimniecības, dārzkopības, mežkopības produkcija, kas nav ietverta citās klasēs; dzīvnieki; svaigi augļi un dārzeņi; sēklas; augi un ziedi; dzīvnieku barība; iesals
32 alus; minerālūdeņi, gāzēti ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai
33 alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)

(111) **Reģ. Nr.** M 65 395 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-459 (220) **Pieteik.dat.** 26.04.2012

INTERIORISM

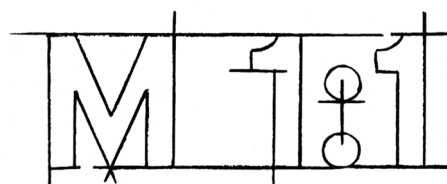
(732) **Īpašn.** Natālija REITERE; Ķiršu iela 12, Baloži, Ķekavas nov. LV-2112, LV
 (511) **16** iespiedprodukcija
35 suvenīru, mākslas darbu un interjera priekšmetu tirdzniecība; komercizstāžu organizēšana
41 apmācība; kultūras pasākumu organizēšana
42 interjera dizaina pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 65 396 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-497 (220) **Pieteik.dat.** 08.05.2012
 (531) **CFE ind.** 5.3.2; 5.3.14; 5.7.7; 27.5.4; 29.1.15



(591) **Krāsu salikums** tumši brūns, brūns, gaiši brūns, tumši sarkans, sarkans, balts
 (732) **Īpašn.** Silvestrs VAIVARS; Bērzu iela 2-54, Aizkraukle, Aizkraukles nov. LV-5101, LV
 (740) **Pārstāvis** Vasilijs LUKEVIČS; "Daugava", Sērenes pag., Jaunjelgavas nov. LV-5123
 (511) **29** gaļa, zivis, mājputni un medījumi; gaļas ekstrakti; konservēti, saldēti, žāvēti (kaltēti) un termiski apstrādāti augļi un dārzeņi; želejas, ievārījumi, kompoti; olas

(111) **Reģ. Nr.** M 65 397 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-504 (220) **Pieteik.dat.** 09.05.2012
 (531) **CFE ind.** 24.17.7; 27.7.11



- (732) **Īpašn.** RBSSKALS, AS; Vienības gatve 85-3, Rīga LV-1004, LV
 (511) **35** darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana
36 nekustamā īpašuma lietas; nekustamā īpašuma apsaimniekošana
37 būvniecība; remonts; labiekārtošanas (iekārtu uzstādīšanas) darbi

(111) **Reģ. Nr.** M 65 398 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-505 (220) **Pieteik.dat.** 09.05.2012
 (531) **CFE ind.** 27.5.1; 29.1.13

RBSSKALS

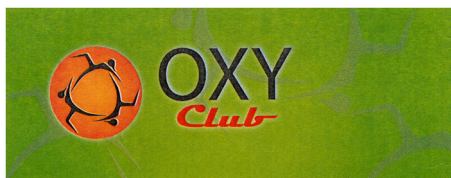
- (591) **Krāsu salikums** melns, zils, dzeltens
 (732) **Īpašn.** RBSSKALS, AS; Vienības gatve 85-3, Rīga LV-1004, LV
 (511) **35** darījumu vadīšana; uzņēmumu pārvaldīšana
36 nekustamā īpašuma lietas; nekustamā īpašuma apsaimniekošana
37 būvniecība; remonts; labiekārtošanas (iekārtu uzstādīšanas) darbi

(111) **Reģ. Nr.** M 65 399 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-511 (220) **Pieteik.dat.** 09.05.2012
 (531) **CFE ind.** 26.4.2; 26.4.22; 29.1.14

svaigBAGETE

- (591) **Krāsu salikums** zaļš, tumši zaļš, sinepju krāsa, balts, melns
 (732) **Īpašn.** STATOIL FUEL & RETAIL LATVIA, SIA; Dunties iela 6, Rīga LV-1013, LV
 (740) **Pārstāvis** Natālija ANOHINA, Aģentūra 'TRIA ROBIT'; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010
 (511) **30** maize un maizes izstrādājumi, to skaitā sviestmaizes un sendviči

(111) **Reģ. Nr.** M 65 400 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-517 (220) **Pieteik.dat.** 11.05.2012
 (531) **CFE ind.** 2.1.8; 2.1.23; 26.1.1; 26.1.3; 26.1.14; 29.1.14



- (591) **Krāsu salikums** dzeltenīgi zaļš, zaļš, oranžs, melns, sarkans, iezālgani pelēks
 (732) **Īpašn.** Edgars RUĢELIS; Pērnavas iela 10-72, Rīga LV-1012, LV
 (511) **35** kosmētisko līdzekļu tirdzniecības pakalpojumi
44 veselības un skaistumkopšanas pakalpojumi cilvēkam

(111) **Reģ. Nr.** M 65 401 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-523 (220) **Pieteik.dat.** 14.05.2012

LAUMA LINGERIE

- (732) **Īpašn.** LAUMA LINGERIE, AS; Ziemeļu iela 19, Liepāja LV-3405, LV
 (511) **35** sieviešu veļas mazumtirdzniecības un vairumtirdzniecības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 65 402 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-533 (220) **Pieteik.dat.** 17.05.2012
 (531) **CFE ind.** 5.1.16; 6.19.1; 25.1.15; 26.1.2; 26.1.15; 26.4.6; 26.4.10; 29.1.15



- (591) **Krāsu salikums** gaiši brūns, smilškrāsa, tumši zaļš, dzeltens, sarkans, gaiši zils, melns, balts
 (732) **Īpašn.** LATVIJAS BALZAMS, A/S; A.Čaka iela 160, Rīga LV-1012, LV
 (740) **Pārstāvis** Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra 'KDK'; Dzērbenes iela 27, Rīga LV-1006
 (511) **33** alkoholiskie dzērieni, proti, sidrs

(111) **Reģ. Nr.** M 65 403 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-538 (220) **Pieteik.dat.** 18.05.2012
 (531) **CFE ind.** 15.1.13; 29.1.13



WINERGY

- (591) **Krāsu salikums** zaļš, gaiši zaļš, dzeltenzaļš
 (732) **Īpašn.** WINERGY, SIA; Palasta iela 10, Rīga LV-1050, LV
 (511) **37** būvniecība; remonts; labiekārtošanas (iekārtu uzstādīšanas) darbi; konsultācijas saistībā ar būvniecību, remontu un labiekārtošanas (iekārtu uzstādīšanas) darbiem
39 elektroenerģijas sadale
40 elektroenerģijas ražošana

(111) **Reģ. Nr.** M 65 404 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-540 (220) **Pieteik.dat.** 21.05.2012
 (531) **CFE ind.** 5.7.10; 5.7.17; 5.7.22; 5.9.1; 25.1.15; 26.1.2; 26.1.3; 27.5.19; 29.1.15



- (591) **Krāsu salikums** oranžs, dzeltens, sarkans, rozā, tumši zils, gaiši zils
 (732) **Īpašn.** CIDO GRUPA, SIA; Ostas iela 4, Rīga LV-1005, LV
 (740) **Pārstāvis** Inese GREĶE-GREBŅEVA; Ostas iela 4, Rīga LV-1005
 (511) **32** minerālūdeņi, gāzēti ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai

- (111) **Reģ. Nr.** M 65 405 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-561 (220) **Pieteik.dat.** 24.05.2012
 (531) **CFE ind.** 3.1.8; 3.1.19; 3.1.24; 26.1.1; 26.1.3; 26.1.15; 26.1.21; 29.1.15



- (591) **Krāsu salikums** brūns, tumši oranžs, oranžs, melns, balts
 (732) **Īpašn.** Frank CAREY; Grēcinieku iela 1, Rīga LV-1050, LV
 (740) **Pārstāvis** Kristaps LINDE; Daudzses iela 6-21, Rīga LV-1004
 (511) **43** bāru pakalpojumi

- (111) **Reģ. Nr.** M 65 406 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-563 (220) **Pieteik.dat.** 24.05.2012
 (531) **CFE ind.** 1.7.12; 1.11.12; 8.1.18; 19.3.3; 25.1.19; 26.1.20; 29.1.15



- (554) **Telpiska zīme**
 (591) **Krāsu salikums** tumši zils, zils, tumši brūns, sarkans, oranžs, dzeltens, gaiši dzeltens, smilškrāsa, zeltains, balts
 (732) **Īpašn.** LAIMA, AS; Sporta iela 2, Rīga LV-1145, LV
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010
 (511) **30** saldējums

- (111) **Reģ. Nr.** M 65 407 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-564 (220) **Pieteik.dat.** 24.05.2012
 (531) **CFE ind.** 5.7.6; 8.1.18; 19.3.3; 25.1.19; 26.1.20; 29.1.15



- (554) **Telpiska zīme**
 (591) **Krāsu salikums** tumši zaļš, zaļš, brūns, sarkans, smilškrāsa, gaiši dzeltens, zeltains, balts
 (732) **Īpašn.** LAIMA, AS; Sporta iela 2, Rīga LV-1145, LV
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010
 (511) **30** saldējums

- (111) **Reģ. Nr.** M 65 408 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-571 (220) **Pieteik.dat.** 28.06.2006

RIOSAN

- (600) Kopienas preču zīmes 005167044 daļēja konversija
 (732) **Īpašn.** NYCOMED GMBH; Byk-Gulden-Str. 2, 78467 Konstanz, DE
 (740) **Pārstāvis** Natālija ANOHINA, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010
 (511) **5** kuņģa un zarnu trakta ārstniecības preparāti, diētiskie preparāti medicīniskiem nolūkiem, visi iepriekšminētie preparāti paredzēti cilvēkam; probiotiskie uztura bagātinātāji, proti, probiotisko baktēriju kultūras

- (111) **Reģ. Nr.** M 65 409 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-573 (220) **Pieteik.dat.** 25.05.2012
 (531) **CFE ind.** 25.1.25; 27.5.22



- (732) **Īpašn.** COTEA, SIA; Zalves iela 75, Rīga LV-1046, LV
 (740) **Pārstāvis** Dmitrijs POHOMOV; Džohara Dudajeva gatve 5-86, Rīga LV-1035
 (511) **3** ziepes; ķermeņa kopšanas un skaistumkopšanas līdzekļi; ēteriskās eļļas; kosmētiskās eļļas, masāžas eļļas, ne medicīniskiem nolūkiem; kosmētiskie līdzekļi vannai, kosmētiskās pēdēvas vannai, vannas sāļi, ne medicīniskiem nolūkiem; matu kopšanas līdzekļi, šampūni; sejas kopšanas līdzekļi; krēmi, losjoni un pienīgi, kas ietverti šajā klasē

- (111) **Reģ. Nr.** M 65 410 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-815 (220) **Pieteik.dat.** 11.07.2012

AFTERDOG

- (732) **Īpašn.** Andris KIRŠENTĀLS; "Mūdas", Žocene, Rojas nov. LV-3264, LV
 (740) **Pārstāvis** Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010

- (511) **16** no papīra pulpas izgatavotas kastes dzīvnieku izkārņījumu savākšanai
35 no papīra pulpas izgatavotu kastu dzīvnieku izkārņījumu savākšanai mazumtirdzniecības un vairumtirdzniecības pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 65 411 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-884 (220) **Pieteik.dat.** 26.07.2012
 (531) **CFE ind.** 21.1.9; 29.1.12



- (591) **Krāsu salikums** sarkans, balts
 (732) **Īpašn.** ALFOR, SIA; Pliņciema iela 12, Mārupe, Mārupes novads LV-2167, LV
 (511) **41** izpriecās; azartspēļu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 65 412 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-910 (220) **Pieteik.dat.** 02.08.2012

МИЛЛИОН

- (732) **Īpašn.** LATGALES REKLĀMA, SIA; Rīgas iela 26, Daugavpils LV-5401, LV
 (740) **Pārstāvis** Natālija ANOHINA, Aģentūra 'TRIA ROBIT'; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010
 (511) **16** iespiedprodukcija, arī avīzes, žurnāli un fotogrāfijas
35 reklāma; reklāmas materiālu sagatavošana publicēšanai, proti, reklāmas tekstu rediģēšana; reklāmas tekstu publicēšana; darījumu vadīšana; laikrakstu un žurnālu abonēšanas organizēšana; preču noieta veicināšana trešajām personām
39 laikrakstu un žurnālu piegāde
41 grāmatu, laikrakstu un žurnālu izdošana; tekstu materiālu (izņemot reklāmas materiālus) sagatavošana publicēšanai, proti, rediģēšana, un publicēšana; radio un televīzijas programmu sagatavošana un montāža; iestudējumu veidošana
42 grafiskā dizaina pakalpojumi; datorprogrammēšana

(111) **Reģ. Nr.** M 65 413 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-926 (220) **Pieteik.dat.** 09.08.2012
 (531) **CFE ind.** 8.7.25; 29.1.14



- (591) **Krāsu salikums** zaļš, dzeltens, pelēks, balts
 (732) **Īpašn.** SALAS ZIVIS, SIA; Lidoņu iela 26-45, Rīga LV-1055, LV
 (740) **Pārstāvis** Vladimirs ANOHINS, Aģentūra 'TRIA ROBIT'; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010
 (511) **30** atdzēsēti un saldēti ēdieni, gatavi lietošanai un/vai pusfabrikātu veidā, kas ietverti šajā klasē; pelmeņi un vareņiki; pankūkas, arī ar pildījumu; picas; sviestmaizes

(111) **Reģ. Nr.** M 65 414 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-958 (220) **Pieteik.dat.** 20.08.2012

GOLD BONUS

- (732) **Īpašn.** Sergejs OMEĻINSKIS; Melīdas iela 3-44, Rīga LV-1015, LV
 (511) **14** cēlmetāli un to sakausējumi, no cēlmetāliem izgatavoti vai ar tiem pārklāti izstrādājumi, kas nav ietverti citās klasēs; juvelierizstrādājumi, rotaslietas, dārgakmeņi; pulksteņi un hronometriskie instrumenti
35 juvelierizstrādājumu mazumtirdzniecības un vairumtirdzniecības pakalpojumi
40 cēlmetālu apstrāde

(111) **Reģ. Nr.** M 65 415 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-11-1557 (220) **Pieteik.dat.** 19.01.2012
 (531) **CFE ind.** 26.4.1; 26.4.5; 26.4.24



- (732) **Īpašn.** Valērija ČERNOUSOVA; Upeņu iela 15-50c, Rīga LV-1084, LV
 (511) **44** skaistumkopšanas pakalpojumi cilvēkam

(111) **Reģ. Nr.** M 65 416 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-11-1572 (220) **Pieteik.dat.** 16.12.2011
 (531) **CFE ind.** 26.4.6; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** gaiši zils, zils, balts
 (732) **Īpašn.** OFFICE GID, SIA; Mūkusalas iela 41b-8, Rīga LV-1004, LV
 (740) **Pārstāvis** Jeļena BLOHINA; Maskavas iela 291 k-5-87, Rīga LV-1063
 (511) **3** mazgāšanas un balināšanas līdzekļi; tīrīšanas, pulēšanas, attaukošanas un abrazīvie līdzekļi; ziepes
16 papīrs, kartons un izstrādājumi no šiem materiāliem, kas nav ietverti citās klasēs; iespiedprodukcija; sintētiskie iesaiņojuma materiāli (kas nav ietverti citās klasēs)
17 plastmasu pusfabrikāti

(111) **Reģ. Nr.** M 65 417 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-13 (220) **Pieteik.dat.** 05.01.2012
 (531) **CFE ind.** 2.1.1; 2.1.8; 2.1.16; 26.4.4; 26.4.14; 27.5.24; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** oranžs, melns, balts
 (732) **Īpašn.** Māris NEIKŠĀNS; Liepu iela 5, Bauska LV-3901, LV
 (511) **37** automašīnu remonts; automašīnu būvniecība; automašīnu pārbūve sportam
41 auto vadīšanas teorētiskā un praktiskā apmācība; sporta sacensību, treniņu un testu organizēšana

(111) **Reģ. Nr.** M 65 418 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-143 (220) **Pieteik.dat.** 01.02.2012

AVA Riga

- (732) **Īpašn.** AVA RIGA, SIA; Pavasara gatve 5-110, Rīga LV-1082, LV
 (740) **Pārstāvis** Vladimirs ANOHINS, Aģentūra 'TRIA ROBIT'; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010
 (511) **44** ārstnieciskā aprūpe; veselības un skaistumkopšanas pakalpojumi cilvēkam

(111) **Reģ. Nr.** M 65 419 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-228 (220) **Pieteik.dat.** 22.02.2012
 (531) **CFE ind.** 8.1.10; 8.1.12; 29.1.14



- (591) **Krāsu salikums** gaiši brūns, brūns, salātzaļš, balts
 (732) **Īpašn.** SAFIE, SIA; Valdeķu iela 54 k-4-6, Rīga LV-1058, LV
 (511) **30** konditorejas izstrādājumi, maize un maizes izstrādājumi, šokolādes izstrādājumi
35 konditorejas izstrādājumu mazumtirdzniecības un vairumtirdzniecības pakalpojumi
43 kafējnīcu pakalpojumi

(111) **Reģ. Nr.** M 65 420 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-334 (220) **Pieteik.dat.** 21.03.2012
 (531) **CFE ind.** 6.1.2; 6.1.4



- (732) **Īpašn.** RIMI LATVIA, SIA; Augusta Deglava iela 161, Rīga LV-1021, LV
 (511) **30** kafija, tēja, kakao

(111) **Reģ. Nr.** M 65 421 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-402 (220) **Pieteik.dat.** 11.04.2012

FAZER MUIŽAS

- (732) **Īpašn.** OY KARL FAZER AB; P.O. Box 4, FI-00941 Helsinki, FI

- (740) **Pārstāvis** Ieva ŠTĀLA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010
 (511) **30** kafija, tēja, kakao, kafijas aizstājēji; rīsi; tapioka un sāgo; milti un labības produkti; maize, maizes un konditorejas izstrādājumi; saldējums; cukurs, medus, melases sīrups; raugs, cepamais pulveris; sāls; sinepes; etiķis, garšvielu mērces; garšvielas; pārtikas ledus

(111) **Reģ. Nr.** M 65 422 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-430 (220) **Pieteik.dat.** 18.04.2012

b.a.L.L.

- (732) **Īpašn.** B.A.L.L., SIA; Brīvības iela 155, Rīga LV-1012, LV
 (511) **35** sporta un tūrisma preču mazumtirdzniecības un vairumtirdzniecības pakalpojumi
41 sporta un kultūras pasākumu organizēšana

(111) **Reģ. Nr.** M 65 423 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-431 (220) **Pieteik.dat.** 18.04.2012
 (531) **CFE ind.** 26.1.1; 26.1.17; 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** sarkans, melns, balts
 (732) **Īpašn.** B.A.L.L., SIA; Brīvības iela 155, Rīga LV-1012, LV
 (511) **35** sporta un tūrisma preču mazumtirdzniecības un vairumtirdzniecības pakalpojumi
41 sporta un kultūras pasākumu organizēšana

(111) **Reģ. Nr.** M 65 424 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-435 (220) **Pieteik.dat.** 13.07.2011

FINÍSIMO

- (600) Kopienas preču zīmes 010120368 konversija
 (732) **Īpašn.** JOSE CANEPA Y COMPAÑIA LIMITADA; Camino Lo Sierra n° 1500 Cerrillos, Santiago, CL
 (740) **Pārstāvis** Ieva ŠTĀLA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga LV-1010
 (511) **33** vīni

(111) **Reģ. Nr.** M 65 425 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-449 (220) **Pieteik.dat.** 24.04.2012
 (531) **CFE ind.** 8.7.8; 19.3.9; 25.12.1; 26.1.1; 26.1.4; 26.1.16; 29.1.14



- (591) **Krāsu salikums** oranžs, dzeltens, melns, balts

(732) **Īpašn.** DUOS, SIA; Staiceles iela 15-71, Rīga LV-1035, LV
(511) **43** apgāde ar uzturu

(111) **Reģ. Nr.** M 65 426 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
(210) **Pieteik.** M-12-452 (220) **Pieteik.dat.** 25.04.2012
(531) **CFE ind.** 7.5.2; 7.5.5; 25.1.18; 29.1.15



(591) **Krāsu salikums** tumši brūns, brūns, gaiši brūns, dzeltens, zils, sarkans, melns, balts
(732) **Īpašn.** SUVENĪRI, SIA; Bākūžu iela 13a-1, Rīga LV-1024, LV
(511) **6** suvenīri - metāla kārbas

(111) **Reģ. Nr.** M 65 427 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
(210) **Pieteik.** M-12-453 (220) **Pieteik.dat.** 25.04.2012
(531) **CFE ind.** 24.11.8; 27.5.4; 29.1.11



(591) **Krāsu salikums** zeltaini dzeltens
(732) **Īpašn.** SUVENĪRI, SIA; Bākūžu iela 13a-1, Rīga LV-1024, LV
(511) **6** suvenīri - metāla kārbas

(111) **Reģ. Nr.** M 65 428 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
(210) **Pieteik.** M-12-479 (220) **Pieteik.dat.** 07.05.2012
(531) **CFE ind.** 7.15.5; 7.15.8; 24.17.25; 26.4.5; 26.4.6; 29.1.14



(591) **Krāsu salikums** brūns, gaiši brūns, gaiši dzeltens, melns
(732) **Īpašn.** RIMI LATVIA, SIA; Augusta Deglava iela 161, Rīga LV-1021, LV
(511) **4** sveces un daktis apgaismošanai
5 uztura bagātinātāji cilvēkam un dzīvniekiem
21 mājturības un virtuves piederumi, ierīces, tīrnes un trauki; ķemmes un sūkļi; tīrīšanas un apkopšanas rīki un ierīces
28 spēles un rotaļlietas
29 konservēti, saldēti, žāvēti (kaltēti) un termiski apstrādāti augļi un dārzeņi; želejas, ievārījumi, kompoti; olas; piens un piena produkti; pārtikas eļļas un tauki; gaļa, zivis, mājputni un medījumi; gaļas ekstrakti
30 kafija, tēja, kakao, kafijas aizstājēji; rīsi; milti un labības produkti; maize, maizes un konditorejas izstrādājumi; saldējums; cukurs, medus, melases sīrups; garšvielas; etiķis; garšvielu mērces
31 svaigi augļi un dārzeņi; sēklas
32 alus; minerālūdeņi, gāzēti ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai

33 alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)
35 reklāma

(111) **Reģ. Nr.** M 65 429 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
(210) **Pieteik.** M-12-480 (220) **Pieteik.dat.** 07.05.2012

KLĒTS

(732) **Īpašn.** RIMI LATVIA, SIA; Augusta Deglava iela 161, Rīga LV-1021, LV
(511) **4** sveces un daktis apgaismošanai
5 uztura bagātinātāji cilvēkam un dzīvniekiem
21 mājturības un virtuves piederumi, ierīces, tīrnes un trauki; ķemmes un sūkļi; tīrīšanas un apkopšanas rīki un ierīces
28 spēles un rotaļlietas
29 konservēti, saldēti, žāvēti (kaltēti) un termiski apstrādāti augļi un dārzeņi; želejas, ievārījumi, kompoti; olas; piens un piena produkti; pārtikas eļļas un tauki; gaļa, zivis, mājputni un medījumi; gaļas ekstrakti
30 kafija, tēja, kakao, kafijas aizstājēji; rīsi; milti un labības produkti; maize, maizes un konditorejas izstrādājumi; saldējums; cukurs, medus, melases sīrups; garšvielas; etiķis; garšvielu mērces
31 svaigi augļi un dārzeņi; sēklas
32 alus; minerālūdeņi, gāzēti ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai
33 alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)
35 reklāma

(111) **Reģ. Nr.** M 65 430 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
(210) **Pieteik.** M-12-813 (220) **Pieteik.dat.** 10.07.2012

КАРИКОР КАПИКОР

(732) **Īpašn.** OLAINFARM, AS; Rūpnīcu iela 5, Olaine, Olaines novads LV-2114, LV
(511) **5** farmaceitiskie preparāti

(111) **Reģ. Nr.** M 65 431 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
(210) **Pieteik.** M-11-1373 (220) **Pieteik.dat.** 31.10.2011

MeGenius

(732) **Īpašn.** Zara LANE; 17 Capstan Way, London SE16 5HG, GB
(740) **Pārstāvis** Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra 'KDK'; Dzērbenes iela 27, Rīga LV-1006
(511) **35** reklāma; reklāmas publicēšana Internetā; informācijas kompilēšana datoru datu bāzēs; ziņu arhīvu veidošana Internetā; izstāžu organizēšana reklāmas un komercnolūkos; darījumu vadīšana; datorizētas informācijas ievadīšana, apstrāde, kontrole, glabāšana un uzlabošana, ciktāl tā attiecas uz šo klasi
36 finanšu lietas; darījumi ar naudu; minēto pakalpojumu sniegšana, izmantojot Internetu vai citus datu tīklus; konsultāciju sniegšana finanšu jomā
41 tekstu, izņemot reklāmas, publicēšana Internetā tiešsaistes režīmā; lejupielādējami Interneta uzziņu katalogi un videokatalogi; tiešsaistes elektronisko publikāciju nodrošināšana; izstāžu un konkursu organizēšana izglītošanas un izklaides nolūkos; spēļu pakalpojumi tiešsaistes režīmā; informācijas sniegšana izglītības un izklaides jomā; izklaides pasākumu plānošana un organizēšana

(111) **Reģ. Nr.** M 65 432 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-11-1374 (220) **Pieteik.dat.** 31.10.2011
 (531) **CFE ind.** 1.1.4; 2.1.16; 2.1.23; 27.3.2; 29.1.12



- (591) **Krāsu salikums** zils, oranžs
 (732) **Īpašn.** Zara LANE; 17 Capstan Way, London SE16 5HG, GB
 (740) **Pārstāvis** Ņina DOLGICERE, Patentu aģentūra 'KDK'; Dzērbenes iela 27, Rīga LV-1006
 (511) **35** reklāma; reklāmas publicēšana Internetā; informācijas kompilēšana datoru datu bāzēs; ziņu arhīvu veidošana Internetā; izstāžu organizēšana reklāmas un komercnolūkos; darījumu vadīšana; datorizētas informācijas ievadīšana, apstrāde, kontrole, glabāšana un uzlabošana, ciktāl tā attiecas uz šo klasi
36 finanšu lietas; darījumi ar naudu; minēto pakalpojumu sniegšana, izmantojot Internetu vai citus datu tīklus; konsultāciju sniegšana finanšu jomā
41 tekstu, izņemot reklāmas, publicēšana Internetā tiešsaistes režīmā; lejupielādējami Interneta uzziņu katalogi un videokatalogi; tiešsaistes elektronisko publikāciju nodrošināšana; izstāžu un konkursu organizēšana izglītošanas un izklaides nolūkos; spēļu pakalpojumi tiešsaistes režīmā; informācijas sniegšana izglītības un izklaides jomā; izklaides pasākumu plānošana un organizēšana

(111) **Reģ. Nr.** M 65 433 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-476 (220) **Pieteik.dat.** 03.05.2012
 (531) **CFE ind.** 26.4.1; 26.4.4; 26.4.5; 26.4.24

CND 
 Shellac

- (732) **Īpašn.** CREATIVE NAIL DESIGN, INC.; 1125 Joshua Way, Vista, CA 92083, US
 (740) **Pārstāvis** Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra 'INTELS LATVIJA'; Akadēmijas laukums 1, Rīga LV-1050
 (511) **3** nagu kopšanas līdzekļi, nagu emaljas, nagu stiprināšanas līdzekļi, nagu spodrināšanas līdzekļi, nagu lakas
11 ultravioleto staru lampas, kas nav paredzētas medicīniskiem nolūkiem

(111) **Reģ. Nr.** M 65 434 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-477 (220) **Pieteik.dat.** 03.05.2012

CND SHELLAC

- (732) **Īpašn.** CREATIVE NAIL DESIGN, INC.; 1125 Joshua Way, Vista, CA 92083, US
 (740) **Pārstāvis** Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra 'INTELS LATVIJA'; Akadēmijas laukums 1, Rīga LV-1050
 (511) **3** nagu kopšanas līdzekļi, nagu emaljas, nagu stiprināšanas līdzekļi, nagu spodrināšanas līdzekļi, nagu lakas

11 ultravioleto staru lampas, kas nav paredzētas medicīniskiem nolūkiem

(111) **Reģ. Nr.** M 65 435 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-543 (220) **Pieteik.dat.** 22.05.2012

Santa un Barbara

- (732) **Īpašn.** JAVIS, SIA; Malnavas iela 18-42, Rīga LV-1057, LV
 (511) **3** mazgāšanas un balināšanas līdzekļi; tīrīšanas, pulēšanas, attaukošanas un abrazīvie līdzekļi; ziepes; parfimērijas izstrādājumi, ēteriskās eļļas, kosmētiskie un matu kopšanas līdzekļi; zobu kopšanas līdzekļi
16 papīrs, kartons un izstrādājumi no šiem materiāliem; iespiedprodukcija; grāmatu iesiešanas materiāli; fotogrāfijas; rakstāmlietas; līmvielas kancelejas vai mājturības vajadzībām; materiāli māksliniekiem; otas; rakstāmmašīnas un kancelejas preces (izņemot mēbeles); mācību un uzskates līdzekļi (izņemot aparatūru); sintētiskie iesaiņojuma materiāli; iespiedburti; klišejas
21 mājturības un virtuves piederumi, ierīces, tīrīšanas un trauki; ķemmes un sūkļi; suku (izņemot otas); materiāli suku izstrādājumiem; tīrīšanas un apkopšanas rīki un ierīces; tērauda skaidas (tīrīšanai); neapstrādāts vai daļēji apstrādāts stikls (izņemot stiklu celtniecības vajadzībām); izstrādājumi no stikla, porcelāna, fajansa un keramikas
26 mežģīnes un izšuvumi, lentes, pītas lentes; pogas, āķi un cilpiņas, adatas; mākslīgie ziedi
29 gaļa, zivis, mājputni un medījumi; gaļas ekstrakti; konservēti, saldēti, žāvēti (kalvēti) un termiski apstrādāti augļi un dārzeņi; želejas, ievārijumi, kompoti; olas; piens un piena produkti; pārtikas eļļas un tauki
30 kafija, tēja, kakao, kafijas aizstājēji; rīsi; tapioka un sāgo; milti un labības produkti; maize, maizes konditorejas izstrādājumi; saldējums; cukurs, medus, melases sīrups; raugs, cepamais pulveris; sāls; sinepes; etiķis, garšvielu mērces; garšvielas; pārtikas ledus
31 graudi un lauksaimniecības, dārzkopības, mežkopības produkcija; dzīvnieki; svaigi augļi un dārzeņi; sēklas; augi un ziedi; dzīvnieku barība; iesals
32 alus; minerālūdeņi, gāzēti ūdeņi un citi bezalkoholiskie dzērieni; augļu dzērieni un augļu sulas; sīrupi un citas sastāvdaļas dzērienu pagatavošanai
33 alkoholiskie dzērieni (izņemot alu)
34 tabaka; smēķēšanas piederumi; sērkokčiņi
43 apgāde ar uzturu; viesu izmitināšana

(111) **Reģ. Nr.** M 65 436 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-545 (220) **Pieteik.dat.** 22.05.2012

meteoprog

- (732) **Īpašn.** METEOPROG.LV, SIA; Zigfrīda Annas Meierovica bulvāris 16-12, Rīga LV-1050, LV
 (740) **Pārstāvis** Andrejs GAILĀNS; Zigfrīda Annas Meierovica bulvāris 16-12, Rīga LV-1050
 (511) **35** komerciālas informācijas aģentūru pakalpojumi; reklāmas aģentūru pakalpojumi; plašību iznomāšana reklāmas izvietojšanai; automatizēto datu bāzu apkalpošana; reklāmas maketēšana; mārketinga pakalpojumi; tekstu apstrāde; reklāmas laika noma masu informācijas līdzekļos; reklāmas materiālu iznomāšana; reklāmas tekstu publicēšana; reklāmas materiālu izplatīšana; reklāmas materiālu izsūtīšana; reklāmas tekstu rediģēšana; reklāma; interaktīva reklāma datortīklos
38 pieejas nodrošināšana datu bāzēm; pieejas nodrošināšana diskusiju forumiem Internetā; apsveikuma karšu nosūtīšana tiešsaistē; ziņu pārraide; ziņu un attēlu pārraide ar datora palīdzību; digitālo failu pārraide; elektroniskais pasts

- 42 ūdens analīze; datorsistēmu analīze; ķīmiskā analīze; tehnisko projektu izpēte; datorprogrammu uzstādīšana; meteoroloģiskā informācija; pētījumi apkārtējās vides aizsardzības jomā; konsultācijas datortehnikas izstrādāšanas un attīstības jomā; konsultācijas datorprogrammu jautājumos; datorprogrammu modernizācija; datorsistēmu monitorings ar attālināto pieeju; datorprogrammu apkalpošana; dokumentu digitalizēšana (skenēšana); datu vai dokumentu pārnese no fiziska nesēja uz elektronisko; tīmekļa vietņu izvietošana Internetā; datorprogrammu izstrāde; tīmekļa vietņu izveide un tehniskā apkalpošana trešo personu vajadzībām

(111) **Reģ. Nr.** M 65 437 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-895 (220) **Pieteik.dat.** 27.07.2012
 (531) **CFE ind.** 29.1.13



- (591) **Krāsu salikums** oranžs, tumši zils, balts
 (732) **Īpašn.** RĪGAS PIENSAIMNIEKS, SIA; Valmieras iela 2, Rīga LV-1009, LV
 (740) **Pārstāvis** Vladimirs ANOHINS, Aģentūra 'TRIA ROBIT'; Vīlandes iela 5, Rīga LV-1010
 (511) **29** gaļa, zivis, mājputni un medījumi, izstrādājumi no šiem produktiem; gaļas ekstrakti; konservēti, saldēti, žāvēti (kaltēti) un termiski apstrādāti augļi un dārzeņi; želejas, ievārījumi, kompoti; olas, piens un piena produkti, tai skaitā biezpiena sieriņi, deserti, jogurti, kefīrs, sviests, biezpiens, svaigs siers; pārtikas eļļas un tauki
30 kafija, tēja, kakao, kafijas aizstājēji; rīsi; tapioka un sāgo; milti un labības produkti; maize, maizes un konditorejas izstrādājumi; saldējums; medus, melases sīrups; raugs, cepamais pulveris; sāls; sinepes; etiķis, garšvielu mērces; garšvielas; pārtikas ledus

(111) **Reģ. Nr.** M 65 438 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-411 (220) **Pieteik.dat.** 13.04.2012

SP PETER HOTEL

- (732) **Īpašn.** STRATĒĢISKĀS INVESTĪCIJAS, SIA; Valņu iela 45, Rīga LV-1010, LV
 (740) **Pārstāvis** Edvīns DRABA; Alberta iela 12-5, Rīga LV-1010
 (511) **43** apgāde ar uzturu; viesu izmitināšana

(111) **Reģ. Nr.** M 65 439 (151) **Reģ. dat.** 20.11.2012
 (210) **Pieteik.** M-12-880 (220) **Pieteik.dat.** 24.07.2012
 (531) **CFE ind.** 26.15.1



- (732) **Īpašn.** LATVENERGO, A/S; Pulkveža Brieža iela 12, Rīga LV-1230, LV
 (740) **Pārstāvis** Kristīne BUHOLTE; Pulkveža Brieža iela 12, Rīga LV-1230
 (511) **4** elektroenerģija

Preču zīmju pieteikumu numerācijas rādītājs

(210) Pieteikuma numurs	(111) Reģistrācijas numurs
M-11-965	M 65 369
M-11-1158	M 65 368
M-11-1181	M 65 370
M-11-1373	M 65 431
M-11-1374	M 65 432
M-11-1557	M 65 415
M-11-1572	M 65 416
M-11-1599	M 65 371
M-12-9	M 65 372
M-12-13	M 65 417
M-12-27	M 65 373
M-12-28	M 65 374
M-12-63	M 65 375
M-12-67	M 65 376
M-12-68	M 65 377
M-12-69	M 65 378
M-12-70	M 65 379
M-12-71	M 65 380
M-12-72	M 65 381
M-12-73	M 65 382
M-12-143	M 65 418
M-12-156	M 65 383
M-12-228	M 65 419
M-12-231	M 65 384
M-12-239	M 65 385
M-12-259	M 65 386
M-12-287	M 65 387
M-12-303	M 65 388
M-12-334	M 65 420
M-12-372	M 65 389
M-12-401	M 65 390
M-12-402	M 65 421
M-12-404	M 65 391
M-12-410	M 65 392
M-12-411	M 65 438
M-12-425	M 65 393
M-12-430	M 65 422
M-12-431	M 65 423
M-12-435	M 65 424
M-12-449	M 65 425
M-12-452	M 65 426
M-12-453	M 65 427
M-12-455	M 65 394
M-12-459	M 65 395
M-12-476	M 65 433
M-12-477	M 65 434
M-12-479	M 65 428
M-12-480	M 65 429
M-12-497	M 65 396
M-12-504	M 65 397
M-12-505	M 65 398
M-12-511	M 65 399
M-12-517	M 65 400
M-12-523	M 65 401
M-12-533	M 65 402
M-12-538	M 65 403
M-12-540	M 65 404
M-12-543	M 65 435
M-12-545	M 65 436
M-12-561	M 65 405
M-12-563	M 65 406
M-12-564	M 65 407
M-12-571	M 65 408
M-12-573	M 65 409
M-12-813	M 65 430
M-12-815	M 65 410
M-12-880	M 65 439
M-12-884	M 65 411
M-12-895	M 65 437
M-12-910	M 65 412
M-12-926	M 65 413
M-12-958	M 65 414

Preču zīmju īpašnieku rādītājs

(732) Īpašnieks	(210) Pieteikuma numurs	(732) Īpašnieks	(210) Pieteikuma numurs
ALFOR, SIA	M-12-884	SUVENĪRI, SIA	M-12-452
AVA RIGA, SIA	M-12-143		M-12-453
B.A.L.L., SIA	M-12-430	TIKKURILA OYJ	M-12-372
	M-12-431	URTĀNS, Pēteris	M-12-63
BGS, SIA	M-12-410	VAIVARS, Silvestrs	M-12-497
BISOXS, SIA	M-11-1181	VIP FASHION STYLE, SIA	M-11-1599
CAREY, Frank	M-12-561	WINERGY, SIA	M-12-538
CIDO GRUPA, SIA	M-12-540		
CITADELE BANKA, AS	M-12-239		
CONSULTING AGENCY "TIMUR OSTROVSKIY & PARTNERS", SIA	M-12-27		
	M-12-28		
COTEA, SIA	M-12-573		
CREATIVE NAIL DESIGN, INC.	M-12-476		
	M-12-477		
ČERNOUSOVA, Valērija	M-11-1557		
DUOS, SIA	M-12-449		
ENERGO STAR, SIA	M-12-9		
G.A.L., SIA	M-12-404		
JAVIS, SIA	M-12-543		
JOSE CANEPA Y COMPAÑIA LIMITADA	M-12-435		
KIRŠENTĀLS, Andris	M-12-815		
KRKA, tovarna zdravil, d.d., Novo mesto	M-12-259		
LAIMA, AS	M-12-563		
	M-12-564		
LANE, Zara	M-11-1373		
	M-11-1374		
LATGALES REKLĀMA, SIA	M-12-910		
LATTELECOM, SIA	M-12-156		
LATVENERGO, A/S	M-12-880		
LATVIJAS BALZAMS, A/S	M-12-533		
LAUMA LINGERIE, AS	M-12-523		
METEOPROG.LV, SIA	M-12-545		
NEIKŠĀNS, Māris	M-12-13		
NOKIA CORPORATION	M-11-1158		
NOVARTIS AG	M-12-401		
NYCOMED GMBH	M-12-571		
OFFICE GID, SIA	M-11-1572		
OLAINFARM, AS	M-12-813		
OMEĻINSKIS, Sergejs	M-12-958		
OY KARL FAZER AB	M-12-402		
PESELEV, Valeri	M-11-965		
PHILIP MORRIS BRANDS SARL	M-12-287		
RBSSKALS, AS	M-12-504		
	M-12-505		
REITERE, Natālija	M-12-459		
RIMI LATVIA, SIA	M-12-334		
	M-12-479		
	M-12-480		
RĪGAS PIENSAIMNIEKS, SIA	M-12-895		
RUĢELIS, Edgars	M-12-517		
S.C. P.P. DISTRIBUTORS ROMANIA S.R.L.	M-12-67		
	M-12-68		
	M-12-69		
	M-12-70		
	M-12-71		
	M-12-72		
	M-12-73		
SAFIE, SIA	M-12-228		
SAIME, Lauksaimniecības pakalpojumu kooperatīvā sabiedrība	M-12-455		
SALAS ZIVIS, SIA	M-12-926		
SALDUS MAIZNIEKS, SIA	M-12-231		
SAUSAMS, SIA	M-12-303		
SMIRNOVA, Aļona	M-12-425		
STATOIL FUEL & RETAIL LATVIA, SIA	M-12-511		
STRATĒĢISKĀS INVESTĪCIJAS, SIA	M-12-411		

Preču zīmju rādītājs pēc preču un pakalpojumu klasēm

(511) Nicas klasifikācijas indekss	(111) Reģistrācijas numurs	(511) Nicas klasifikācijas indekss	(111) Reģistrācijas numurs
1	M 65 392	33	M 65 402
2	M 65 389		M 65 424
3	M 65 409		M 65 428
	M 65 416		M 65 429
	M 65 433		M 65 435
	M 65 434	34	M 65 387
	M 65 435		M 65 435
4	M 65 428	35	M 65 371
	M 65 429		M 65 373
	M 65 439		M 65 374
5	M 65 386		M 65 383
	M 65 390		M 65 395
	M 65 408		M 65 397
	M 65 428		M 65 398
	M 65 429		M 65 400
	M 65 430		M 65 401
6	M 65 426		M 65 410
	M 65 427		M 65 412
9	M 65 368		M 65 414
11	M 65 433		M 65 419
	M 65 434		M 65 422
14	M 65 414		M 65 423
16	M 65 393		M 65 428
	M 65 395		M 65 429
	M 65 410		M 65 431
	M 65 412		M 65 432
	M 65 416		M 65 436
	M 65 435	36	M 65 373
17	M 65 416		M 65 374
21	M 65 428		M 65 385
	M 65 429		M 65 388
	M 65 435		M 65 397
25	M 65 370		M 65 398
26	M 65 435		M 65 431
28	M 65 428		M 65 432
	M 65 429	37	M 65 372
29	M 65 391		M 65 397
	M 65 394		M 65 398
	M 65 396		M 65 403
	M 65 428		M 65 417
	M 65 429	38	M 65 383
	M 65 435		M 65 436
	M 65 437	39	M 65 403
30	M 65 384		M 65 412
	M 65 391	40	M 65 403
	M 65 394		M 65 414
	M 65 399	41	M 65 393
	M 65 406		M 65 395
	M 65 407		M 65 411
	M 65 413		M 65 412
	M 65 419		M 65 417
	M 65 420		M 65 422
	M 65 421		M 65 423
	M 65 428		M 65 431
	M 65 429		M 65 432
	M 65 435	42	M 65 372
	M 65 437		M 65 373
31	M 65 394		M 65 374
	M 65 428		M 65 395
	M 65 429		M 65 412
	M 65 435		M 65 436
32	M 65 394	43	M 65 373
	M 65 404		M 65 374
	M 65 428		M 65 405
	M 65 429		M 65 419
	M 65 435		M 65 425
33	M 65 369		M 65 435
	M 65 376		M 65 438
	M 65 377	44	M 65 375
	M 65 378		M 65 400
	M 65 379		M 65 415
	M 65 380		M 65 418
	M 65 381	45	M 65 373
	M 65 382		M 65 374
	M 65 394		

GROZĪJUMI PATENTU REĢISTRĀ

Patenta īpašnieka maiņa

(LR Patentu likuma 51. panta 2. daļa)

(11) **LV 10083**
 (73) Merck & Cie; Weissshausmatte, 6460 Altdorf, CH
 (74) Baiba KRAVALE, Patentu birojs „ALFA-PATENTS”;
 Virānes iela 2, Rīga, LV-1035, LV
 Ieraksts Valsts reģistrā: 09.11.2012

(11) **LV 13066**
 (73) RŪPNIECĪBAS MEHĀNIKAS UN BIOLOĢISKO
 KOMPLEKSU ZINĀTNISKĀS PĒTNIECĪBAS
 CENTRS, SIA; „Lāmiņas”, Katlakalna,
 Ķekavas pag., Ķekavas nov., LV-2123, LV
 (74) Evita DMITRIJEVA; Tizzas iela 9/4 dz. 18, Rīga,
 LV-1024, LV
 Ieraksts Valsts reģistrā: 23.10.2012

(11) **EP 1 263 664**
 (73) PHILIP MORRIS BRANDS Sàrl;
 Quai Jeanrenaud 3, CH-2000 Neuchâtel, CH
 (74) Aleksandra FORTŪNA, „FORAL Intelektuālā
 īpašuma aģentūra”, SIA; a/k 98, Rīga, LV-1050, LV
 Ieraksts Valsts reģistrā: 22.10.2012

(11) **EP 1 558 580**
 (73) WARNER CHILCOTT COMPANY, LLC; Union
 Street, KM 1.1, Fajardo, 00738 Puerto Rico, US
 (74) Baiba KRAVALE, Patentu birojs „ALFA-PATENTS”;
 Virānes iela 2, Rīga, LV-1035, LV
 Ieraksts Valsts reģistrā: 09.11.2012

Patenta īpašnieka nosaukuma maiņa

(LR Patentu likuma 47. panta 3. daļa)

(11) **EP 0 773 941, EP 0 858 343, EP 0 862 654,
 EP 0 868 525, EP 0 877 750, EP 0 883 415,
 EP 0 906 278, EP 0 920 505, EP 0 922 040,
 EP 0 927 037, EP 0 956 861, EP 0 969 816,
 EP 0 975 369, EP 1 002 084, EP 1 003 861,
 EP 1 019 392, EP 1 021 439, EP 1 039 908,
 EP 1 041 990, EP 1 043 024**
 (73) MERCK SHARP & DOHME CORP.; One Merck
 Drive, Whitehouse Station, NJ 08889, US
 Ieraksts Valsts reģistrā: 09.11.2012

(11) **EP 1 628 241**
 (73) KHS GMBH; Juchostrasse 20, D-44143 Dortmund,
 DE
 Ieraksts Valsts reģistrā: 07.11.2012

Licences

(LR Patentu likuma 52. panta 4. daļa)

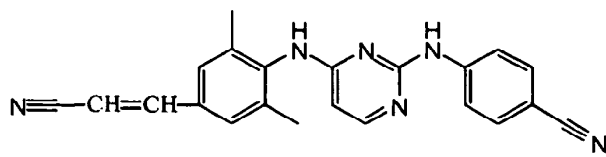
(11) **LV 14276**
 (73) LATVIJAS VALSTS MEŽZINĀTNES INSTITŪTS
 „SILAVA”; Rīgas iela 111, Salaspils, Salaspils nov.,
 LV-2169, LV
 Licenciāts: PINE EFFECT, SIA; Tērbatas iela 90-12, Rīga,
 LV-1011, LV
 Licences veids: vienkārša licence
 Licences darbības laiks: no 12.10.2012 līdz 12.10.2022, ja
 vien tas netiek izbeigts agrāk Likumā vai Licences
 līgumā noteiktajā kārtībā
 Licences darbības vieta: Latvijas Republikas teritorija
 Ieraksts Valsts reģistrā: 12.10.2012

Labojumi

(LR Patentu likuma 47. panta 3. daļa)

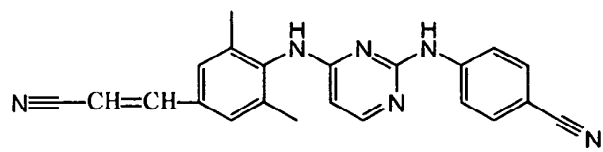
(11) **EP 1 419 152**

(57) 1. 4-[[4-[(2-ciānetenil)-2,6-dimetilfenil]amino]-2-pirimidinil]amino]benzonitrila savienojums ar šādu struktūru:



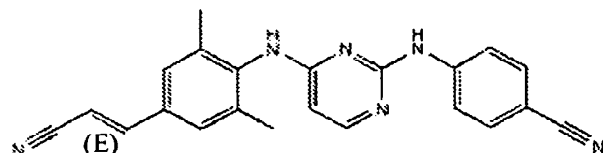
tā *N*-oksīds, farmaceutiski pieņemams pievienošanas sāls, ceturtais amīns vai stereoķīmiski izomēra forma.

2. Savienojums saskaņā ar 1. pretenziju, kur savienojums ir 4-[[4-[(2-ciānetenil)-2,6-dimetilfenil]amino]-2-pirimidinil]amino]benzonitrila stereoķīmiski izomēra forma ar šādu struktūru:



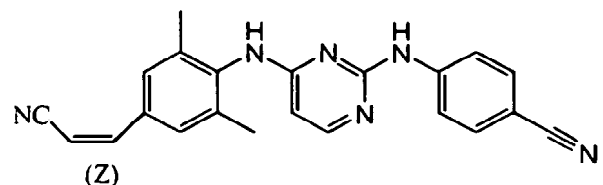
tā *N*-oksīds, farmaceutiski pieņemams pievienošanas sāls vai ceturtais amīns.

3. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur savienojums ir 4-[[4-[(2-ciānetenil)-2,6-dimetilfenil]amino]-2-pirimidinil]amino]benzonitrils (E) ar šādu struktūru:



tā *N*-oksīds, farmaceutiski pieņemams pievienošanas sāls vai ceturtais amīns.

7. Savienojums saskaņā ar 1. vai 2. pretenziju, kur savienojums ir 4-[[4-[(2-ciānetenil)-2,6-dimetilfenil]amino]-2-pirimidinil]amino]benzonitrils (Z) ar šādu struktūru:



tā *N*-oksīds, farmaceutiski pieņemams pievienošanas sāls vai ceturtais amīns.

9. Savienojums saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai izmantošanai par medikamentu.

10. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai izmantošana medikamenta ražošanai, kas paredzēts HIV (cilvēka imūndeficīta vīrusa) infekcijas profilaksei vai ārstēšanai.

13. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur farmaceutiski pieņemamu nesēju un kā aktīvo ingredientu savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai terapeitiski efektīvu daudzumu.

16. Paņēmiens farmaceutiskās kompozīcijas saskaņā ar 13. pretenziju iegūšanai, kas raksturīgs ar to, ka savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai terapeitiski efektīvs daudzums tiek rūpīgi samaisīts ar farmaceutiski pieņemamu nesēju.

17. Produkts, kas satur (a) savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai un (b) citu antiretrovīrusu savienojumu, kā kombinēts preparāts vienlaicīgai, atsevišķai vai secīgai lietošanai HIV infekcijas ārstēšanā.

18. Farmaceutiska kompozīcija, kas satur farmaceutiski pieņemamu nesēju un kā aktīvos ingredientus (a) savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai un (b) citu antiretrovīrusu savienojumu.

19. Savienojuma saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai un cita antiretrovīrusu savienojuma kombinācija.

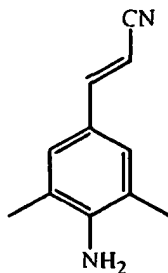
20. Produkts, farmaceitiskā kompozīcija vai kombinācija saskaņā ar 17., 18. vai 19. pretenziju, kur cits antiretrovīrusu savienojums ir nukleozīdu reversās (atgriezeniskās) transkriptāzes inhibītors.

21. Produkts, farmaceitiskā kompozīcija vai kombinācija saskaņā ar 20. pretenziju, kur nukleozīdu reversās transkriptāzes inhibītors ir izvēlēts no zidovudīna, didanozīna, zalcitabīna, lamivudīna, stavudīna vai abakavīra.

22. Produkts, farmaceitiskā kompozīcija vai kombinācija saskaņā ar 17., 18. vai 19. pretenziju, kur cits antiretrovīrusu savienojums ir nukleotīdiem līdzīgu savienojumu reversās transkriptāzes inhibītors.

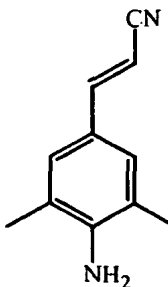
24. Produkts, farmaceitiskā kompozīcija vai kombinācija saskaņā ar 17., 18. vai 19. pretenziju, kur cits antiretrovīrusu savienojums ir proteāzes inhibītors.

26. Savienojums ar šādu formulu:



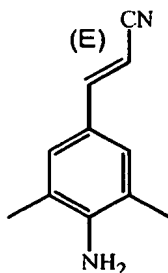
tā *N*-oksīds, farmaceitiski pieņemams pievienošanas sāls, ceturtējais amīns vai stereoķīmiski izomēra forma.

28. Savienojums saskaņā ar 26. pretenziju, kur savienojums ir savienojuma



stereoķīmiski izomēra forma vai tā farmaceitiski pieņemams pievienošanas sāls.

30. Savienojums saskaņā ar 29. pretenziju, kur savienojums ir



33. Cietā dispersija, kas satur:

(a) savienojumu saskaņā ar jebkuru no 1. līdz 8. pretenzijai un (b) vienu vai vairākus farmaceitiski pieņemamus ūdenī šķīstošus polimērus.

42. Cietā dispersija saskaņā ar jebkuru no 33. līdz 40. pretenzijai, kur cietā dispersija ir sistēma ar domēniem vai maziem reģioniem, kuros amorfs, mikrokristālisks vai kristālisks (a) vai amorfs, mikrokristālisks vai kristālisks (b), vai abi ir vairāk vai mazāk vienmērīgi disperģēti citā fāzē, kas satur (b) vai (a), vai cietā šķīdumā, kas satur (a) un (b).

43. Daļiņa, kas sastāv no cietās dispersijas saskaņā ar jebkuru no 33. līdz 42. pretenzijai.

47. Paņēmiens cietās dispersijas saskaņā ar jebkuru no 33. līdz 46. pretenzijai iegūšanai, kas ietver šādus soļus: divu komponentu (a) un (b) šķīdināšanu piemērotā šķīdinātājā un iegūtā šķīduma izsmidzināšanu caur izsmidzināšanas žāvētavas

sprauslu, kam seko šķīdinātāja izvaicēšana no iegūtajām pilītēm paaugstinātās temperatūrās.

Ieraksts Valsts reģistrā: 09.03.2010

GROZĪJUMI PAPILDU AIZSARDZĪBAS SERTIFIKĀTU VALSTS REĢISTRĀ

Papildu aizsardzības sertifikāta īpašnieka maiņa

(Regulas (EEK) Nr. 1768/92 14. pants)

- (21) C/LV2004/0001/z, C/LV2007/0001/z, C/LV2007/0006/z, C/LV2008/0010/z, C/LV2008/0012/z, C-04-0001
- (73) SCHERING CORPORATION; 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, NJ 07033, US
- (74) Nīna DOLGICERE, Patentu aģentūra „KDK”; Dzērbenes iela 27, Rīga, LV-1006, LV

Ieraksts Valsts reģistrā: 05.11.2012

Papildu aizsardzības sertifikāta īpašnieka nosaukuma maiņa

(Regulas (EEK) Nr. 1768/92 14. pants)

- (21) C/LV2004/0001/z, C/LV2006/0003/z, C/LV2007/0001/z, C/LV2007/0006/z, C/LV2008/0010/z, C/LV2008/0012/z, C/LV2010/0011/z, C-04-0001
- (73) MERCK SHARP & DOHME CORP.; One Merck Drive, Whitehouse Station, NJ 08889, US

Ieraksts Valsts reģistrā: 06.11.2012

GROZĪJUMI VALSTS DIZAINPARAUGU REĢISTRĀ

Reģistrācijas atjaunošana

(LR Dizainparaugu likuma 31. pants, Pārejas noteikumu 7. punkts)

Tiek norādīts dizainparauga reģistrācijas numurs un reģistrācijas atjaunošanas datums

D 10 750	21.11.2012
D 15 121	14.03.2012

Dizainparauga izslēgšana no reģistra

(LR Dizainparaugu likuma 40. pants)

Tiek norādīts dizainparauga reģistrācijas numurs un reģistrācijas beigu datums

D 10 281	13.03.2012
D 10 667	04.02.2012
D 15 119	16.02.2012
D 15 122	30.03.2012
D 15 129	16.02.2012

GROZĪJUMI VALSTS PREČU ZĪMJU REĢISTRĀ

Zīmes īpašnieka maiņa

(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 25. pants)

- (111) M 10 401, M 10 402
- (732) BASF SE; Carl-Bosch-Strasse 38, Ludwigshafen am Rhein, DE

(740) (580)	Valentīna SERGEJEVA; a/k 16, Rīga, LV-1083, LV 06.11.2012	(111) (732)	M 15 516 COLGATE-PALMOLIVE EUROPE SARL; 13-15 Cours de Rive, 1204 Geneva, CH
(111) (732)	M 10 487 CARGOTEC FINLAND OY; Valmetinkatu 5, 33900 Tampere, FI	(740) (580)	Māra UZULĒNA, Patentu birojs "ALFA-PATENTS"; Virānes iela 2, Rīga, LV-1035, LV 26.10.2012
(740) (580)	Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV 07.11.2012	(111) (732)	M 18 817, M 18 818 DEICHMANN SE; Deichmannweg 9, 45359 Essen, DE
(111) (732)	M 11 016 SOCIETE BIC; 14, rue Jeanne d'Asnières, 92110 Clichy, FR	(740) (580)	Vladimirs ANOHINS, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV 11.10.2012
(740) (580)	Natālija ANOHIA, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV 12.10.2012	(111) (732)	M 30 550, M 31 186 VOXX INTERNATIONAL CORPORATION; 180 Marcus Blvd., Hauppauge, NY 11788, US
(111) (732)	M 11 320, M 31 718, M 34 740 PERNOD RICARD DENMARK A/S; Kanonbadsvej 8, DK-1437 Copenhagen K, DK	(740) (580)	Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV 31.10.2012
(740) (580)	Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV 31.10.2012	(111) (732)	M 30 753 PHILIP MORRIS BRANDS SARL; Quai Jeanrenaud 3, CH-2000 Neuchâtel, CH
(111) (732)	M 12 599 LEAF SUOMI OY; P.O. Box 406 (Lemminkäisenkatu 32), 20101 Turku, FI	(740) (580)	Vladimirs ANOHINS, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV 01.11.2012
(740) (580)	Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV 25.10.2012	(111) (732)	M 32 554 JOH. WINKLHOFER BETEILIGUNGS GMBH & CO. KG; Albert-Roßhaupter-Straße 53, 81369 München, DE
(111) (732)	M 13 149, M 17 183, M 17 184, M 18 813, M 19 478, M 31 692, M 32 689 CERVEZAS CUAUHTÉMOC MOCTEZUMA, SA de CV; Ave. Alfonso Reyes 2202 Nte, Colonia Bella Vista, 64410 Monterrey, Nuevo León, MX	(740) (580)	Aleksandra FORTŪNA, "FORAL Intelektuālā Ipašuma aģentūra", SIA; a/k 98, Rīga, LV-1050, LV 24.10.2012
(740) (580)	Māra UZULĒNA, Patentu birojs "ALFA-PATENTS"; Virānes iela 2, Rīga, LV-1035, LV 23.10.2012	(111) (732)	M 42 658, M 42 659, M 45 698, M 47 751, M 55 617, M 60 518, M 62 896, M 62 954, M 62 032 MEPHA SCHWEIZ AG; Dornacherstrasse 114, 4147 Aesch, CH
(111) (732)	M 13 463 INSTITUT CAMEANE; 23 rue des Jeuneurs, 75002 Paris, FR	(740) (580)	Arnolds ZVIRGZDS, Agency ARNOPATENTS, SIA; Brīvības iela 162/2-17, Rīga, LV-1012, LV 23.10.2012
(740) (580)	Gatis MERŽVINSKIS, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV 31.10.2012	(111) (732)	M 50 517 OBEDINENNIE PIVOVARNI HEINEKEN, Obschestvo s ogranichennoy otvetstvennostyu; ul. Telmana 24, līter "A", 193230 Sankt-Peterburg, RU
(111) (732)	M 13 649 LVMH SWISS MANUFACTURES SA; rue Louis-Joseph-Chevrolet 6a, La Chaux-de-Fonds, CH	(740) (580)	Valentīna SERGEJEVA; a/k 16, Rīga, LV-1083, LV 24.10.2012
(740) (580)	Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV 22.10.2012	(111) (732)	M 51 255 THOMSON REUTERS GLOBAL RESOURCES; Neuhofstrasse 1, 6340 Baar, CH
(111) (732)	M 13 748, M 13 750 ASAHI KASEI CHEMICALS CORPORATION; 1-105 Kanda Jinbocho, Chiyoda-ku, Tokyo, 101-8101, JP	(740) (580)	Aleksandra FORTŪNA, "FORAL Intelektuālā Ipašuma aģentūra", SIA; a/k 98, Rīga, LV-1050, LV 26.10.2012
(740) (580)	Natālija ANOHINA, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV 10.10.2012	(111) (732)	M 52 145 WILLIAM GRANT & SONS IRISH BRANDS LIMITED; 4th Floor, Block D, Iveagh Court, Harcourt Road, Dublin 2, IE
(111) (732)	M 14 955 YAMABIKO CORPORATION; 7-2, Suehirocho 1-chome, Ohme, Tokyo, JP	(740) (580)	Natālija ANOHINA, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV 23.10.2012
(740) (580)	Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV 22.10.2012	(111) (732)	M 53 365, M 53 989, M 53 990, M 54 094, M 54 095 MSD INTERNATIONAL GMBH; Weyrstrasse 20, 6000 Luzern 6, CH

(740)	Nina DOLGICERE, Patentu aģentūra "KDK"; Dzērbenes iela 27, Rīga, LV-1006, LV	(111)	M 12 513	(732)	TEIJIN ARAMID B.V.; Velperweg 76, 6824 BM Arnhem, NL	(580)	06.11.2012
(580)	29.10.2012						
(111)	M 60 863, M 60 867, M 60 868, M 62 350, M 62 351, M 62 432, M 62 433, M 63 852, M 63 853, M 63 854, M 63 855, M 63 856, M 63 857, M 63 858, M 63 859, M 64 367, M 64 368, M 64 369, M 64 370, M 64 371	(111)	M 12 656	(732)	NORMA LEBENSMITTELFILIALBETRIEB STIFTUNG & CO. KG; Heisterstr. 4, 90441 Nürnberg, DE	(580)	06.11.2012
(732)	LATVIJAS PIENS, SIA; Langervaldes iela 7, Jelgava, LV-3002, LV	(580)	06.11.2012				
(580)	16.10.2012						
(111)	M 62 051	(111)	M 12 861	(732)	BASF SE; Carl-Bosch-Strasse 38, 67056 Ludwigshafen, DE	(580)	06.11.2012
(732)	ADORABOR LIMITED; 69 Arch. Makariou III Ave., Tlais Tower, Nicosia, CY	(580)	06.11.2012				
(740)	Ināra ŠMĪDEBERGA, Aģentūra "INTELS LATVIJA"; Akadēmijas laukums 1, Rīga, LV-1050, LV	(111)	M 14 273	(732)	ABB FRANCE; 3 avenue du Canada, Immeuble Athos, Les Ulis, 91978 Courtaboeuf, FR	(580)	01.11.2012
(580)	09.11.2012						
(111)	M 62 565	(111)	M 14 358	(732)	TARKETT SA; 2, rue de l'Egalité, F-92748 Nanterre Cedex, FR	(580)	31.10.2012
(732)	AT MILK HOLDING LTD; 7A, Efesou Street, 6036 Larnaca, CY	(580)	31.10.2012				
(740)	Vladimirs ANOHINS, Aģentūra "TRIA ROBIT"; Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV	(111)	M 15 644	(732)	GALLY S.P.A.; Fraz. Melotti 19/A, 10084 Forno Canavese (Torino), IT	(580)	31.10.2012
(580)	30.10.2012						
(111)	M 63 435, M 63 436	(111)	M 30 226	(732)	MASTER LOCK COMPANY LLC; P.O. Box 927, 137 W. Forest Hill Avenue, Oak Creek, Wisconsin 53154, US	(580)	05.11.2012
(732)	CITADELE BANKA, AS; Republikas laukums 2A, Rīga, LV-1010, LV	(580)	05.11.2012				
(580)	08.11.2012						
(111)	M 64 036	(111)	M 31 328	(732)	BARTON & GUESTIER; Chateau Magnol, 87 rue du Dehez, 33290 Blanquefort, FR	(580)	05.11.2012
(732)	FONTAINE ENT., SIA; Dzirnau iela 4, Liepāja, LV-3401, LV	(580)	05.11.2012				
(580)	06.11.2012						
(111)	M 64 721, M 64 722	(111)	M 41 811, M 41 812, M 45 187	(732)	JANSSEN BIOTECH, INC.; 800 Ridgeview Drive, Horsham, PA 19044, US	(580)	07.11.2012
(732)	AMSERV GRUPI AS; Pärnu mnt 232, 11314 Tallinn, EE	(580)	07.11.2012				
(740)	Kristīne OSTROVSKA, Aģentūra "PĒTERSONA PATENTS"; Ausekļa iela 2-2, Rīga, LV-1010, LV						
(580)	31.10.2012						
Zīmes īpašnieka nosaukuma maiņa							
(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 17. panta 2. daļa)							
(111)	M 11 790	(111)	M 52 499	(732)	SUSHI POINT, SIA; Palasta iela 10, Rīga, LV-1050, LV	(580)	22.10.2012
(732)	XYLEM WATER SOLUTIONS AB; 361 80 Emmaboda, SE	(580)	22.10.2012				
(580)	29.10.2012						
(111)	M 12 329	(111)	M 61 272	(732)	BANK 'SEVERNÝ MORSKOY PUT', Otkritoe aktsionernoje obschestvo; ul. Sadovnicheskaya, d. 71, str. 11, 113035 Moskva, RU	(580)	22.10.2012
(732)	ALCATEL LUCENT; 3, avenue Octave Gréard, 75007 Paris, FR	(580)	22.10.2012				
(580)	01.11.2012						
(111)	M 12 495, M 12 499	Zīmes īpašnieka adreses maiņa					
(732)	YOPLAIT MARQUES; 170 bis, Boulevard du Montparnasse, 75014 Paris, FR	(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 17. panta 2. daļa)					
(580)	22.10.2012						
(111)	M 12 510	(111)	M 11 082, M 11 087, M 11 100	(732)	KODAK; 108-112, avenue de la Liberte, 94700 Maisons Alfort, FR	(580)	07.11.2012
(732)	CORDENKA GMBH & CO. KG; Industrie Center Oberburg, 63784 Oberburg, DE	(580)	07.11.2012				
(580)	12.10.2012						

(111)	M 11 092	(111)	M 32 665, M 32 666
(732)	KODAK; 108-112, avenue de la Liberte, 94700 Maisons Alfort, FR	(732)	REHAU AG + Co; Rheniumhaus, 95111 Rehau, DE
(580)	08.11.2012	(580)	12.10.2012
(111)	M 11 724, M 11 731, M 11 854, M 11 859, M 11 861, M 11 862, M 11 863, M 11 881, M 11 885, M 11 898, M 11 900, M 11 921, M 11 926, M 11 927, M 11 928, M 11 929, M 11 931, M 12 070, M 12 086, M 12 174, M 12 226, M 12 227	(111)	M 51 432, M 53 290, M 53 291
(732)	Bayer Aktiengesellschaft; Kaiser-Wilhelm-Allee, 51373 Leverkusen, DE	(732)	RIMI LATVIA, SIA; Augusta Deglava iela 161, Rīga, LV-1021, LV
(580)	06.11.2012	(580)	23.10.2012
(111)	M 11 848, M 11 852, M 11 853, M 11 888, M 11 897, M 11 905, M 11 910, M 11 914, M 11 915, M 11 932, M 12 066, M 12 076, M 13 931	(111)	M 51 774
(732)	Bayer Aktiengesellschaft; Kaiser-Wilhelm-Allee, 51373 Leverkusen, DE	(732)	PERFEKTA C, SIA; Vidrižu iela 1, Rīga, LV-1006, LV
(580)	08.11.2012	(580)	24.10.2012
(111)	M 12 073	(111)	M 52 731
(732)	MANPOWER, INC.; 100 Manpower Place, Milwaukee, WI, US	(732)	VIPIS OÜ; Veldi tee 2, Veneküla küla, Rae vald, 75325 Harjumaa, EE
(580)	12.10.2012	(580)	25.10.2012
(111)	M 12 739, M 17 264, M 32 903, M 40 432, M 40 996, M 41 003, M 52 782	(111)	M 54 628, M 54 951, M 57 040, M 54 041
(732)	DEL MONTE CORPORATION; One Maritime Plaza, San Francisco, CA 94111, US	(732)	DEPO DIY, SIA; "Jaunbūmaņi", Dreiliņi, Stopiņu nov., LV-2130, LV
(580)	31.10.2012	(580)	25.10.2012
(111)	M 13 154	(111)	M 55 943, M 55 944, M 61 775, M 61 797, M 61 798, M 61 799
(732)	FISKARS CORPORATION; Hämeentie 135 A, 00560 Helsinki, FI	(732)	DIGITĀLĀS EKONOMIKAS ATTĪSTĪBAS CENTRS, SIA; Maskavas iela 459, Rīga, LV-1063, LV
(580)	12.10.2012	(580)	02.11.2012
(111)	M 13 295	Reģistrāciju atjaunošana	
(732)	THE DRAMBUIE LIQUEUR CO. LTD.; Springburn Bond, Carlisle Street, Glasgow, Scotland, G21 1EQ, GB	(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 21. panta 2. daļa)	
(580)	25.10.2012	Tiek norādīts zīmes reģistrācijas numurs un reģistrācijas atjauno- šanas datums	
(111)	M 14 925, M 14 926, M 14 927	M 10 942	02.10.2012
(732)	INTERLEMO HOLDING S.A. (Interlemo Holding AG) (Interlemo Holding Ltd); Chemin des Champs- Courbes 28, 1024 Ecublens, CH	M 10 945	02.10.2012
(580)	25.10.2012	M 10 949	02.10.2012
(111)	M 15 516	M 11 443	21.10.2012
(732)	SANEX NEDERLAND B.V.; Leeuwendseweg 5 f, 1382 LV Weesp, NL	M 11 593	02.11.2012
(580)	25.10.2012	M 11 594	02.11.2012
(111)	M 16 596	M 11 595	02.11.2012
(732)	ALLIED VAN LINES, INC. (Delaware corp.); 700 Oakmont Lane, Westmont, Illinois 60599, US	M 11 596	02.11.2012
(580)	31.10.2012	M 11 602	02.11.2012
(111)	M 30 844	M 11 664	02.11.2012
(732)	MOTT'S LLP; 5301 Legacy Drive, Plano, TX 75024, US	M 11 665	02.11.2012
(580)	12.10.2012	M 11 666	02.11.2012
(111)	M 31 614	M 11 698	02.11.2012
(732)	FOSSIL, INC.; 901 S. Central Expressway, Richardson, Texas 75080, US	M 11 699	02.11.2012
(580)	31.10.2012	M 11 703	02.11.2012
		M 11 704	02.11.2012
		M 11 705	02.11.2012
		M 11 706	02.11.2012
		M 11 707	02.11.2012
		M 11 708	02.11.2012
		M 11 782	02.11.2012
		M 11 783	02.11.2012
		M 11 785	02.11.2012
		M 11 786	02.11.2012
		M 11 787	02.11.2012
		M 11 788	02.11.2012
		M 11 981	02.11.2012
		M 11 983	02.11.2012
		M 11 994	02.11.2012
		M 11 999	02.11.2012
		M 12 000	02.11.2012
		M 12 001	02.11.2012
		M 12 002	02.11.2012
		M 12 003	02.11.2012

M 12 004	02.11.2012	M 13 772	16.11.2012
M 12 005	02.11.2012	M 13 773	19.11.2012
M 12 072	02.11.2012	M 13 774	19.11.2012
M 12 073	02.11.2012	M 13 777	20.11.2012
M 12 137	02.11.2012	M 13 784	23.11.2012
M 12 138	02.11.2012	M 13 787	23.11.2012
M 12 139	02.11.2012	M 13 789	26.11.2012
M 12 140	02.11.2012	M 13 792	26.11.2012
M 12 141	02.11.2012	M 13 799	26.11.2012
M 12 142	02.11.2012	M 13 801	26.11.2012
M 12 143	02.11.2012	M 13 803	26.11.2012
M 12 147	02.11.2012	M 13 804	26.11.2012
M 12 148	02.11.2012	M 13 806	26.11.2012
M 12 149	02.11.2012	M 14 263	30.11.2012
M 12 150	02.11.2012	M 14 264	30.11.2012
M 12 196	02.11.2012	M 14 272	30.11.2012
M 12 197	02.11.2012	M 14 273	30.11.2012
M 12 310	14.10.2012	M 14 274	30.11.2012
M 12 315	14.10.2012	M 14 277	30.11.2012
M 12 316	14.10.2012	M 14 278	30.11.2012
M 12 317	14.10.2012	M 14 279	30.11.2012
M 12 322	19.10.2012	M 14 280	30.11.2012
M 12 329	03.11.2012	M 14 281	30.11.2012
M 12 357	02.11.2012	M 14 282	30.11.2012
M 12 358	02.11.2012	M 14 283	30.11.2012
M 12 370	09.11.2012	M 14 915	02.11.2012
M 12 375	10.11.2012	M 14 916	02.11.2012
M 12 376	11.11.2012	M 14 917	02.11.2012
M 12 377	11.11.2012	M 14 918	02.11.2012
M 12 378	11.11.2012	M 14 919	02.11.2012
M 12 380	11.11.2012	M 16 060	19.11.2012
M 12 381	11.11.2012	M 16 061	30.11.2012
M 12 382	11.11.2012	M 16 062	30.11.2012
M 12 599	02.11.2012	M 16 063	30.11.2012
M 12 600	02.11.2012	M 16 416	30.11.2012
M 12 601	02.11.2012	M 16 417	30.11.2012
M 12 604	11.11.2012	M 18 071	02.11.2012
M 12 605	11.11.2012	M 18 573	02.11.2012
M 12 606	11.11.2012	M 19 406	11.11.2012
M 12 607	12.11.2012	M 19 514	23.11.2012
M 12 617	12.11.2012	M 30 011	02.11.2012
M 12 618	12.11.2012	M 30 018	02.11.2012
M 12 619	12.11.2012	M 30 132	04.11.2012
M 12 622	17.11.2012	M 30 226	31.08.2012
M 12 623	17.11.2012	M 30 550	03.11.2012
M 12 624	17.11.2012	M 30 564	02.11.2012
M 12 625	17.11.2012	M 30 753	19.10.2012
M 12 626	17.11.2012	M 30 759	02.11.2012
M 12 627	17.11.2012	M 30 761	02.11.2012
M 12 628	17.11.2012	M 30 765	02.11.2012
M 12 629	17.11.2012	M 30 767	02.11.2012
M 12 825	17.11.2012	M 30 774	02.11.2012
M 13 154	02.11.2012	M 30 775	02.11.2012
M 13 159	03.11.2012	M 30 776	02.11.2012
M 13 169	23.11.2012	M 30 777	02.11.2012
M 13 171	23.11.2012	M 30 786	02.11.2012
M 13 172	23.11.2012	M 30 789	02.11.2012
M 13 175	24.11.2012	M 30 794	02.11.2012
M 13 177	25.11.2012	M 30 795	02.11.2012
M 13 179	25.11.2012	M 30 797	02.11.2012
M 13 401	29.10.2012	M 30 798	02.11.2012
M 13 402	29.10.2012	M 30 799	02.11.2012
M 13 432	30.11.2012	M 30 806	02.11.2012
M 13 434	30.11.2012	M 30 809	02.11.2012
M 13 436	30.11.2012	M 30 819	25.11.2012
M 13 580	13.11.2012	M 30 824	25.11.2012
M 13 581	13.11.2012	M 30 825	25.11.2012
M 13 588	16.11.2012	M 31 147	01.10.2012
M 13 589	16.11.2012	M 31 150	09.11.2012
M 13 592	17.11.2012	M 31 159	11.11.2012
M 13 756	16.11.2012	M 31 160	11.11.2012
M 13 758	16.11.2012	M 31 163	11.11.2012
M 13 759	16.11.2012	M 31 164	11.11.2012
M 13 760	16.11.2012	M 31 165	11.11.2012

M 31 167 11.11.2012
 M 31 179 16.11.2012
 M 31 184 17.11.2012
 M 31 186 20.11.2012
 M 31 232 12.10.2012
 M 31 241 30.11.2012
 M 31 242 30.11.2012
 M 31 252 30.11.2012
 M 31 285 20.11.2012
 M 31 286 20.11.2012
 M 31 287 25.11.2012
 M 31 329 12.11.2012
 M 31 330 19.11.2012
 M 31 383 02.11.2012
 M 31 384 02.11.2012
 M 31 410 30.11.2012
 M 31 411 30.11.2012
 M 31 412 30.11.2012
 M 31 500 11.11.2012
 M 31 541 20.11.2012
 M 31 584 02.11.2012
 M 31 586 02.11.2012
 M 31 651 28.11.2012
 M 31 653 30.11.2012
 M 31 657 30.11.2012
 M 31 733 25.11.2012
 M 32 130 02.11.2012
 M 32 170 25.11.2012
 M 32 283 11.11.2012
 M 32 342 12.11.2012
 M 32 378 02.11.2012
 M 32 401 16.10.2012
 M 32 456 10.11.2012
 M 32 624 02.11.2012
 M 32 625 02.11.2012
 M 32 626 02.11.2012
 M 32 653 02.11.2012
 M 32 656 30.11.2012
 M 33 710 23.11.2012
 M 35 059 19.11.2012
 M 35 614 10.11.2012
 M 36 411 02.11.2012
 M 50 753 08.11.2012
 M 50 754 08.11.2012
 M 50 772 05.11.2012
 M 50 902 21.11.2012
 M 51 151 12.04.2012
 M 51 281 08.11.2012
 M 51 282 08.11.2012
 M 51 432 07.10.2012
 M 51 473 09.11.2012
 M 51 583 18.10.2012
 M 51 774 30.10.2012
 M 51 833 12.11.2012
 M 51 834 13.11.2012
 M 51 955 15.11.2012
 M 51 956 15.11.2012
 M 51 957 05.11.2012
 M 51 958 05.11.2012
 M 51 962 08.11.2012
 M 51 963 08.11.2012
 M 51 964 08.11.2012
 M 51 965 08.11.2012
 M 51 967 13.11.2012
 M 51 975 14.11.2012
 M 51 976 15.11.2012
 M 51 977 15.11.2012
 M 51 978 15.11.2012
 M 51 979 15.11.2012
 M 51 981 21.11.2012
 M 51 983 21.11.2012
 M 51 984 26.11.2012
 M 52 006 04.11.2012
 M 52 007 08.11.2012

M 52 011 26.11.2012
 M 52 012 26.11.2012
 M 52 079 28.10.2012
 M 52 080 28.10.2012
 M 52 081 28.10.2012
 M 52 082 28.10.2012
 M 52 083 28.10.2012
 M 52 084 28.10.2012
 M 52 094 08.11.2012
 M 52 095 08.11.2012
 M 52 099 08.11.2012
 M 52 107 15.11.2012
 M 52 119 26.11.2012
 M 52 127 27.11.2012
 M 52 129 27.11.2012
 M 52 133 29.11.2012
 M 52 134 29.11.2012
 M 52 136 29.11.2012
 M 52 252 24.10.2012
 M 52 257 20.11.2012
 M 52 324 01.11.2012
 M 52 329 15.11.2012
 M 52 330 15.11.2012
 M 52 332 15.11.2012
 M 52 333 15.11.2012
 M 52 339 29.11.2012
 M 52 340 29.11.2012
 M 52 431 15.11.2012
 M 52 699 21.11.2012
 M 52 729 03.10.2012
 M 52 730 16.11.2012
 M 52 731 17.10.2012
 M 52 734 11.11.2012
 M 53 019 28.10.2012
 M 53 020 28.10.2012
 M 53 290 09.09.2012
 M 53 291 09.09.2012
 M 53 974 12.11.2012

Zīmes reģistrācijas izslēgšana no Reģistra

(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 33. panta 1. daļa)

Tiek norādīts zīmes reģistrācijas numurs un reģistrācijas darbības pārtraukšanas datums

M 30 024 22.04.2012
 M 30 025 22.04.2012
 M 30 027 22.04.2012
 M 30 028 22.04.2012
 M 30 029 22.04.2012
 M 30 030 22.04.2012
 M 30 036 22.04.2012
 M 30 041 22.04.2012
 M 30 042 22.04.2012
 M 30 043 22.04.2012
 M 30 048 22.04.2012
 M 30 049 22.04.2012
 M 30 055 22.04.2012
 M 30 057 22.04.2012
 M 30 062 22.04.2012
 M 31 801 22.04.2012
 M 31 802 22.04.2012
 M 31 803 22.04.2012
 M 31 804 22.04.2012
 M 31 805 22.04.2012
 M 32 397 22.04.2012
 M 49 834 22.04.2012
 M 49 835 22.04.2012
 M 49 996 26.04.2012
 M 50 159 18.04.2012
 M 50 168 23.04.2012

M 50 403	12.04.2012	10	
M 50 404	12.04.2012	visas preces svītrotas 14.10.2012	
M 50 494	30.04.2012	(580) 22.10.2012	
M 50 670	17.04.2012		
M 50 760	29.04.2012	(111) M 12 316	
M 50 878	12.04.2012	(511) 9, 16, 37, 41, 42	
M 50 881	17.04.2012	līdzšinējā redakcija	
M 50 882	19.04.2012	10	
M 50 885	23.04.2012	visas preces svītrotas 14.10.2012	
M 50 888	25.04.2012	(580) 22.10.2012	
M 50 986	15.04.2012		
M 50 990	26.04.2012		
M 51 043	10.04.2012	(111) M 18 332	
M 51 046	23.04.2012	(511) 3, 9	
M 51 055	26.04.2012	līdzšinējā redakcija	
M 51 085	12.04.2012	14	
M 51 086	12.04.2012	visas preces svītrotas	
M 51 152	12.04.2012	18, 28	
M 51 153	12.04.2012	līdzšinējā redakcija	
M 51 154	16.04.2012	(580) 25.10.2012	
M 51 155	16.04.2012		
M 51 157	22.04.2012	(111) M 64 946	
M 51 158	24.04.2012	(511) 30	
M 51 159	24.04.2012	visas preces svītrotas	
M 51 160	24.04.2012	32	
M 51 161	24.04.2012	līdzšinējā redakcija	
M 51 164	29.04.2012	(580) 01.11.2012	
M 51 165	30.04.2012		
M 51 166	30.04.2012	(111) M 65 092	
M 51 167	30.04.2012	(511) 9	
M 51 242	22.04.2012	līdzšinējā redakcija	
M 51 320	10.04.2012	28	
M 51 321	11.04.2012	elektroniskai, magnētiskai vai biometriskai atmiņas	
M 51 322	11.04.2012	videi pielāgoti elektroniskie un mehāniskie spēļu	
M 51 328	25.04.2012	automāti (ar vai bez laimestu izmaksas funkcijām),	
M 51 330	29.04.2012	kas iedarbināmi ar monētām, banknotēm,	
M 51 331	29.04.2012	žetoniem vai taloniem un paredzēti izmantošanai	
M 51 332	30.04.2012	kazino un spēļu zālēs; spēļu automātu korpusi;	
M 51 391	12.04.2012	ar monētām iedarbināmi elektriskie, elektroniskie	
M 51 392	12.04.2012	un mehāniskie bingo spēles un loteriju automāti,	
M 51 394	17.04.2012	arī komerciāliem nolūkiem; spēļu galdi; visas	
M 51 397	24.04.2012	iepriekšminētās preces nav paredzētas	
M 51 440	22.04.2012	izmantošanai fitnesa nodarbībās	
M 51 486	11.04.2012	41	
M 51 487	12.04.2012	visi pakalpojumi svītroti	
M 51 488	30.04.2012	(580) 09.11.2012	
M 51 489	30.04.2012		
M 51 634	24.04.2012		
M 51 675	22.04.2012		
M 51 676	22.04.2012		
M 51 677	25.04.2012		
M 51 871	24.04.2012		
M 52 024	16.04.2012		
M 52 026	23.04.2012		
M 52 027	30.04.2012		
M 52 028	30.04.2012		
M 52 029	30.04.2012		
M 52 236	11.04.2012		
M 52 486	16.04.2012		
M 52 487	16.04.2012		
M 53 025	24.04.2012		
M 53 026	24.04.2012		
M 53 027	24.04.2012		
M 53 400	18.04.2012		
M 54 034	24.04.2012		

Zīmes elementu maiņa
(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 17. panta 2. daļa)

(111) **M 43 827**
(540)



(531) 2.1.8; 2.1.20; 25.1.19; 27.5.2; 29.1.12
(591) sarkans, balts
(580) 02.11.2012

Grozījumi preču sarakstā

(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 17. panta 2. daļa)

(111) **M 12 315, M 12 317**
(511) 9
līdzšinējā redakcija

Pārstāvja maiņa

(LR likuma Par preču zīmēm un ģeogrāfiskās izcelsmes norādēm 17. panta 2. daļa)

(111) **M 14 821, M 14 826, M 14 827, M 14 828,**
M 14 829, M 14 847, M 15 821, M 17 368,
M 17 369, M 17 371, M 17 372, M 17 373,

M 17 375, M 17 376, M 17 378, M 17 379,
M 17 382, M 17 385, M 17 927, M 18 128,
M 18 348, M 18 349, M 19 473, M 31 766,
M 31 769, M 31 770, M 32 497, M 32 848,
M 33 293, M 33 294, M 34 077, M 34 391,
M 34 392, M 34 393, M 34 394, M 34 395,
M 34 397, M 34 398, M 34 964, M 34 965,
M 34 966, M 34 967, M 34 970, M 34 971,
M 34 986, M 34 987, M 35 056, M 35 122,
M 35 384, M 35 677, M 36 103
(740) Natālija ANOHINA, Aģentūra "TRIA ROBIT";
Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
(580) 07.11.2012

(111) M 32 335
(740) Natālija ANOHINA, Aģentūra "TRIA ROBIT";
Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
(580) 06.11.2012

(111) M 37 488, M 37 489, M 37 542, M 38 509,
M 38 510, M 38 511, M 38 512, M 38 513,
M 38 514, M 38 515, M 38 516, M 38 517,
M 38 518, M 38 519, M 38 520, M 38 521,
M 38 522, M 38 523, M 38 569, M 39 419,
M 39 420, M 39 422, M 39 430, M 39 431,
M 39 432, M 39 447, M 39 816, M 40 047,
M 40 048, M 40 049, M 40 313, M 40 314,
M 41 704, M 41 786, M 41 819, M 42 016,
M 42 568, M 42 569, M 42 570, M 42 571,
M 42 572, M 42 573, M 43 114, M 43 115,
M 43 675, M 44 628, M 44 777, M 51 707,
M 53 420, M 53 421, M 54 649, M 55 863,
M 55 866, M 58 637
(740) Natālija ANOHINA, Aģentūra "TRIA ROBIT";
Vīlandes iela 5, Rīga, LV-1010, LV
(580) 08.11.2012

Pamanīto kļūdu labojums Vēstnesī 8/2012

1249. lappuse, Patenta darbības termiņa izbeigšanās (LR Patentu likuma 18. panta 1. daļa),

LV 10083 *publikāciju uzskatīt par kļūdu*

Pamanīto kļūdu labojums Vēstnesī 10/2012

1401. lappuse, EP 1 051 174 publikācija

jābūt:

(51) ... (87) ... – *kā iespiests*

(73) ETHYPHARM, 194, Bureaux de la Colline,
92213 Saint-Claud cedex, FR

(72) *un tālāk – kā iespiests*

1501. lappuse, Zīmes īpašnieka nosaukuma maiņa, M 11 211,
M 11 288 publikācija

jābūt:

(111) **M 11 288, M 13 211**

(732) *un tālāk – kā iespiests*

Atbildīgā par izdevumu K. Libarte
Reģistrācijas apliecība Nr. 000701174