



Національний орган інтелектуальної власності
Державне підприємство «Український інститут інтелектуальної власності»

ПРОМИСЛОВА ВЛАСНІСТЬ

ВИНАХОДИ. КОРИСНІ МОДЕЛІ.
КОМПОНУВАННЯ НАПІВПРОВІДНИКОВИХ ВИРОБІВ

Том 1

Офіційний бюлетень

Заснований 1993 року

Бюлетень № 22

Відомості, вміщені в даному бюлетені,
вважаються опублікованими 2 червня 2021 р.



Офіційний бюлетень «Промислова власність»

УДК 347.77

Офіційний бюлетень вміщує наступну інформацію:

відомості про заявки на винаходи, відомості про державну реєстрацію винаходів, відомості про державну реєстрацію корисних моделей, відомості про державну реєстрацію компонувань напівпровідникових виробів, сповіщення щодо реєстрацій винаходів, корисних моделей та компонувань напівпровідникових виробів, зміни до відомостей, що занесені до державних реєстрів винаходів, корисних моделей, компонувань напівпровідникових виробів, відомості про видачу дублікатів патентів, відомості про видачу дублікатів свідоцтв, зміни внаслідок виправлення помилок та інші відомості, що стосуються реєстрації винаходів, корисних моделей та компонувань напівпровідникових виробів. Бюлетень може містити розділ «Офіційні повідомлення».

Державне підприємство «Український інститут інтелектуальної власності»
вул. Глазунова, 1, м. Київ-42, 01601, Україна, тел.: (044) 494-06-44, e-mail: office@ukrpatent.org

МІЖНАРОДНІ ЦИФРОВІ КОДИ ДЛЯ ІДЕНТИФІКАЦІЇ БІБЛІОГРАФІЧНИХ ДАНИХ (ІНІД)
СТОСОВНО ВІНАХОДІВ (КОРИСНИХ МОДЕЛЕЙ) ВІДПОВІДНО ДО СТАНДАРТУ ВОІВ ST. 9

- | | |
|--|--|
| (11) номер реєстрації, що є номером патенту | (54) назва винаходу (корисної моделі) |
| (21) номер заявки | (57) формула винаходу (корисної моделі) |
| (22) дата подання заявки | (62) номер та дата подання попередньої заявки, з якої виділено заявку, позначену кодом (21) |
| (23) інші дати | (66) номер (номери) та дата (дати) подання попередньої (попередніх) заявки (заявок), діловодство за якою (якими) припинено |
| (24) дата, з якої є чинними права на винахід (корисну модель) | (71) ім'я або повне найменування заявника (заявників) |
| (31) номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції | (72) ім'я винахідника (винахідників) |
| (32) дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції | (73) ім'я або повне найменування, адреса володільця (володільців) патенту та двобуквений код держави |
| (33) двобуквений код держави - учасниці Паризької конвенції чи регіональної організації, до якої подана попередня заявка | (85) дата переходу міжнародної заявки до національної фази відповідно до Договору про патентну кооперацію |
| (41) дата публікації відомостей про прийняту до розгляду заявку та номер бюлетеня | (86) номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору про патентну кооперацію |
| (46) дата публікації відомостей про державну реєстрацію та номер бюлетеня | |
| (51) індекс (індекси) Міжнародної патентної класифікації | |

ОФІЦІЙНІ ПОВІДОМЛЕННЯ

Зміни до відомостей про представників у справах інтелектуальної власності

Кукшина Тетяна Архипівна. Реєстр. № 88

Телефон: +38 (044) 585-96-61, +38 (044) 585-96-62, +38 (044) 585-96-68,
+38 (067) 443-16-56
E-Mail: ip@kip.ua

Гайсинський Еммануїл Тодросович. Реєстр. № 111

Телефон: +38 (067) 531-41-31
E-Mail: pts@sat.poltava.ua

Гайсинська Алла Іванівна. Реєстр. № 168

Телефон: +38 (067) 975-81-86
E-Mail: pts@sat.poltava.ua

Кривенко Юрій Юрійович. Реєстр. № 255

Телефон: +38 (056) 409-61-29, +38 (067) 791-04-10, +38 (096) 686-27-27
E-Mail: intelpatservice@gmail.com, 2062712312@ukr.net
Адреса для листування: вул. Пушкіна, 44, Криворізький національний університет, науково-дослідна частина, патентний відділ, Кривенко Ю.Ю, м. Кривий Ріг, Дніпропетровська обл., 50002, Україна

Канюка Артем Володимирович. Реєстр. № 404

Телефон: +38 (097) 414-10-65
E-Mail: pts@sat.poltava.ua

Крутько Юлія Олександрівна. Реєстр. № 431

Факс: +38 (044) 585-96-64
E-Mail: ip@kip.ua

ВІДОМОСТІ ПРО ЗАЯВКИ НА ВИНАХОДИ

Розділ А:

Життєві потреби людини

А 01

(21) а 2020 02716 (51) МПК
(22) 05.05.2020 A01B 61/04 (2006.01)
A01C 7/20 (2006.01)
(71) ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ "ЛОЗІВСЬКІ МАШИНИ ІННОВАЦІЙНИЙ ЦЕНТР" (UA)
(72) Бучко Ігор Георгійович (UA)
(54) СТИЙКА СОШНИКА

(21) а 2021 00777 (51) МПК (2021.01)
(22) 16.08.2019 A01C 5/06 (2006.01)
A01B 79/00
A01C 7/00
A01C 7/06 (2006.01)
A01C 7/20 (2006.01)
A01C 23/02 (2006.01)
G01B 11/24 (2006.01)
A01C 21/00

(31) 62/722,386
(32) 24.08.2018
(33) US
(85) 24.03.2021
(86) PCT/IB2019/056949, 16.08.2019
(71) ПРЕСІЖН ПЛАНТИНГ ЛЛК (US)
(72) Стрнад Майкл (US), Мінаріч Ніколас (US)
(54) СИСТЕМИ, СПОСОБИ ТА АПАРАТИ ВИМІРЮВАННЯ ГЛИБИНИ СІЛЬСЬКОГОСПОДАРСЬКОЇ БОРОЗНИ

(21) а 2021 01053 (51) МПК (2021.01)
(22) 19.09.2019 A01N 63/00
A01P 7/04 (2006.01)
C07K 14/32 (2006.01)
C12N 15/82 (2006.01)

(31) 62/734,335
(32) 21.09.2018
(33) US
(85) 12.04.2021
(86) PCT/US2019/051951, 19.09.2019
(71) НОВОЗІМЕС БІОАГ А/С (DK)
(72) Ліленд Джаррод (US), Рассел Калум (US)

(54) ПЕСТИЦИДНІ КОМБІНАЦІЇ YERSINIA ТА BACILLUS

(21) а 2021 01051 (51) МПК (2021.01)
(22) 23.09.2019 A01N 63/00
A01P 7/04 (2006.01)
C07K 14/005 (2006.01)
C07K 14/195 (2006.01)
C12N 15/82 (2006.01)

(31) 62/735,300
(32) 24.09.2018
(33) US
(85) 12.04.2021
(86) PCT/US2019/052406, 23.09.2019
(71) НОВОЗІМЕС БІОАГ А/С (DK)
(72) Ліленд Джаррод (US)
(54) ПЕСТИЦИДНІ КОМБІНАЦІЇ YERSINIA ТА ВІРУСІВ КОМАХ

(21) а 2021 01270 (51) МПК (2021.01)
(22) 24.09.2019 A01N 63/00
C07K 14/325 (2006.01)
C12N 15/82 (2006.01)

(31) 62/736,236
(32) 25.09.2018
(33) US
(85) 15.03.2021
(86) PCT/US2019/052782, 24.09.2019
(71) МОНСАНТО ТЕКНОЛОДЖІ ЛЛС (US)
(72) Боуен Девід Дж. (US), Чай Кетрін А. (US), Ціхе Тодд А. (US), Хау Арлін Р. (US), Фласінські Станіслав (US)
(54) НОВІ КОМАХОПРИГНІЧУВАЛЬНІ БІЛКИ

А 23

(21) а 2019 11513 (51) МПК (2021.01)
(22) 28.11.2019 A23B 4/00

(71) ГЕЛІХ АННА ОЛЕКСАНДРІВНА (UA)
(72) Геліх Анна Олександрівна (UA), Головка Тетяна Миколаївна (UA), Головка Микола Павлович (UA), Василенко Ольга Олександрівна (UA), Філон Андрій Михайлович (UA), Самілик Марина Михайлівна (UA), Применко Владислав Геннадійович (UA)
(54) ПАСТА НА ОСНОВІ ПРІСНОВОДНИХ МОЛЮСКІВ

(21) а 2019 11554 (51) МПК (2021.01)
(22) 02.12.2019 A23L 17/00

(71) ЗАГУМЬОННИЙ ГЕННАДІЙ ВОЛОДИМИРОВИЧ (UA)
(72) Загумьонний Геннадій Володимирович (UA)
(54) ЗАКУСКА РИБНА

A 24

(21) а 2021 01374 (51) МПК (2021.01)
(22) 10.02.2017 A24F 47/00

(31) 62/294,271
(32) 11.02.2016
(33) US
(62) а 2018 09142, 10.02.2017
(71) ДЖУУЛ ЛЕБЗ, ІНК. (US)
(72) Хаттон Ніколас Джей (US), Крістенсен Стівен (US)
(54) ВИПАРНІ ПРИСТРОЇ ЗІ ЗДАТНІСТЮ РОЗРІЗНЯТИ ВИДУВАННЯ

A 41

(21) а 2019 11516 (51) МПК (2021.01)
(22) 28.11.2019 A41F 1/00
A41D 13/00
A44B 11/00
F41H 1/00
A47G 25/90 (2006.01)

(71) ЄВТУШЕНКО ЮРІЙ ВІКТОРОВИЧ (UA)
(72) Євтушенко Юрій Вікторович (UA), Романчук Тамара Анатоліївна (UA)
(54) ПРИСТРІЙ ДЛЯ ПОЄДНАННЯ РЕМЕНІВ

A 61

(21) а 2020 04977 (51) МПК (2021.01)
(22) 04.01.2019 A61K 9/00
A61K 9/14 (2006.01)
A61K 35/74 (2015.01)

(31) 62/614,151
(32) 05.01.2018
(33) US
(31) 62/683,850
(32) 12.06.2018
(33) US
(85) 03.08.2020
(86) РСТ/US2019/012376, 04.01.2019
(71) НЮБІЙОТА ЛЛК (US)
(72) Аллен-Веркое Емма (CA)
(54) КОМПОЗИЦІЇ, ЯКІ ВКЛЮЧАЮТЬ СПІЛЬНО ОБРА-
НУ МІКРОБІОТУ, ТА СПОСОБИ ЇХ ЗАСТОСУВА-
ННЯ

(21) а 2021 01015 (51) МПК
(22) 30.07.2019 A61K 31/185 (2006.01)
A61K 31/19 (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01)

(31) 62/713,061
(32) 01.08.2018
(33) US
(85) 01.03.2021
(86) РСТ/US2019/044023, 30.07.2019
(71) АЛЗХЕОН, ІНК. (US)
(72) Хей Джон (US), Кочіс Петр (US), Толар Мартін (US),
Фланцрайх Ніл Уільям (US)
(54) СПОСОБИ ЛІКУВАННЯ НЕЙРОДЕГЕНЕРАТИВ-
НИХ РОЗЛАДІВ

(21) а 2021 02131 (51) МПК
(22) 22.04.2019 A61K 31/232 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61K 47/06 (2006.01)

(31) 62/735,670
(32) 24.09.2018
(33) US
(31) 62/735,680
(32) 24.09.2018
(33) US
(31) 62/758,387
(32) 09.11.2018
(33) US
(31) 62/813,888
(32) 05.03.2019
(33) US
(31) 62/818,514
(32) 14.03.2019
(33) US
(85) 22.04.2021
(86) РСТ/US2019/028553, 22.04.2019
(71) АМАРИН ФАРМАСЬЮТИКАЛЗ АЙРЛЕНД ЛІМІ-
ТЕД (ІЕ)
(72) Соні Пареш (US)
(54) СПОСОБИ ЗНИЖЕННЯ РИЗИКУ СЕРЦЕВО-СУ-
ДИННИХ ЯВИЩ У СУБ'ЄКТА

(21) а 2021 00610 (51) МПК (2021.01)
(22) 28.08.2019 A61K 31/506 (2006.01)
A61K 31/438 (2006.01)
A61P 1/16 (2006.01)
A61P 3/04 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)
A61P 35/00
A61K 45/06 (2006.01)

(31) 62/726,172
(32) 31.08.2018
(33) US
(31) 62/883,860
(32) 07.08.2019
(33) US
(85) 31.03.2021
(86) РСТ/IB2019/057259, 28.08.2019
(71) ПФАЙЗЕР ІНК. (US)
(72) Еслер Вільям Пол (US), Росс Трентон Томас (US)
(54) КОМБІНАЦІЇ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ NASH/NAFLD ТА
ПОВ'ЯЗАНИХ ЗАХВОРЮВАНЬ

(21) а 2021 00663 (51) МПК
(22) 09.11.2012
A61K 31/519 (2006.01)
A61K 31/38 (2006.01)
C07D 495/04 (2006.01)
C07D 497/04 (2006.01)

(31) 61/651,878
(32) 25.05.2012
(33) US
(31) 61/615,092
(32) 23.03.2012
(33) US
(31) 61/559,023
(32) 11.11.2011
(33) US
(31) 61/675,513
(32) 25.07.2012
(33) US
(62) а 2017 03473, 09.11.2012
(71) ГІЛІАД АПОЛЛО, ЛІС (US)
(72) Харріман Джеральдін С. (US), Массе Крейг Е. (US),
Харвуд Джеймс (US), Бхат Сатеш (US), Грінвуд
Джеремі Роберт (US)
(54) ІНГІБІТОРИ АСС ТА ЇХ ЗАСТОСУВАННЯ

(21) а 2021 02094 (51) МПК (2021.01)
(22) 19.09.2019
A61K 31/4439 (2006.01)
A61K 31/47 (2006.01)
A61K 31/496 (2006.01)
A61K 31/498 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)
A61K 35/00

(31) 62/734,501
(32) 21.09.2018
(33) US
(85) 20.04.2021
(86) РСТ/ЕР2019/075222, 19.09.2019
(71) ЯНССЕН ФАРМАЦЕВТИКА НВ (BE)
(72) Буссоларі Жаклін Сірілло (US)
(54) ЛІКУВАННЯ ХОЛАНГІОКАРЦИНОМИ

(21) а 2021 00808 (51) МПК
(22) 22.02.2021
A61K 36/48 (2006.01)

(71) ХАРКІВСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ МЕДИЧНИЙ УНІ-
ВЕРСИТЕТ (UA)
(72) Гонтова Тетяна Миколаївна (UA), Гапоненко Вален-
тина Петрівна (UA), Левашова Ольга Леонідівна (UA)
(54) СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ КОНЦЕНТРАТУ РОСЛИН-
НОГО ПОХОДЖЕННЯ З АНАБОЛІЧНОЮ ТА ІМУ-
НОТРОПНОЮ ДІЄЮ

(21) а 2021 01891 (51) МПК (2021.01)
(22) 18.09.2019
A61K 39/12 (2006.01)
C07K 19/00
C12N 15/62 (2006.01)
A61P 31/20 (2006.01)

(31) 18195280.5
(32) 18.09.2018
(33) EP
(31) 201910239547.X
(32) 27.03.2019
(33) CN
(85) 12.04.2021
(86) РСТ/NL2019/050614, 18.09.2019
(71) СТИХТИНГ ВАГЕНІНГЕН РІСЕРЧ (NL)
(72) Віллемсенс Петрус Теодорус Джоханнес (NL), Пе-
етерс Бернардус Петрус Хубертус (NL)
(54) ВАКЦИНА ПРОТИ ВІРУСУ АФРИКАНСЬКОЇ ЧУМИ
СВИНЕЙ

(21) а 2021 01359 (51) МПК
(22) 09.11.2016
A61K 39/395 (2006.01)
C07K 16/40 (2006.01)
A61P 7/02 (2006.01)
A61P 37/02 (2006.01)

(31) 62/252,814
(32) 09.11.2015
(33) US
(31) 62/406,726
(32) 11.10.2016
(33) US
(62) а 2018 06416, 09.11.2016
(71) ОМЕРОС КОРПОРЕЙШН (US), ЮНІВЕРСІТІ ОФ
ЛЕСТЕР (GB)
(72) Демопулос Грегорі А. (US), Дадлер Томас (US),
Швебле Ханс-Вільгельм (GB)
(54) СПОСОБИ ЛІКУВАННЯ СТАНІВ, ПОВ'ЯЗАНИХ З
MASP-2-ЗАЛЕЖНОЮ АКТИВАЦІЄЮ КОМПЛЕМЕ-
НТУ

(21) а 2021 01453 (51) МПК (2021.01)
(22) 18.09.2019
A61P 37/00
C07D 401/08 (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01)
C07D 413/08 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)
C07D 417/08 (2006.01)
A61K 31/435 (2006.01)

(31) 62/734,486
(32) 21.09.2018
(33) US
(85) 20.04.2021
(86) РСТ/ІВ2019/057856, 18.09.2019
(71) ПФАЙЗЕР ІНК. (US)
(72) Герштенбергер Брайан Стефен (US), Ломбардо Ві-
нсент Мішель (US), Муссоу Джеймс Джон (US), Шнурт
Марк Едвард (US), Флік Ендрю Крістофер (US),
Кунг Деніел Вей-Сунг (US), Нухант Філіпп Марсель
(US), Робінсон Дж. Ральф Пелтон (US), Шмітт Де-
ніел Коплі (US), Торарсенсен Етлі (US), Труджілло
Джон Ісідро (US), Юнвала Раймонд Ял (US), Ву Хю-
іксіан (US)
(54) N-ЗАМІЩЕНІ ДІОКСОЦИКЛОБУТЕНІЛАМІНО-3-ГІД-
РОКСИПІКОЛІНАМІДИ, ПРИЙНЯТНІ ЯК ІНГІБІТО-
РИ CCR6

(21) **а 2021 01985** (51) МПК
 (22) 18.09.2019 A61P 37/06 (2006.01)
 A61K 31/4025 (2006.01)
 A61K 45/06 (2006.01)

(31) 18195251.6
 (32) 18.09.2018
 (33) EP
 (85) 15.04.2021
 (86) PCT/EP2019/074918, 18.09.2019
 (71) Ф. ХОФФМАНН-ЛЯ РОШ АГ (CH)
 (72) Кляйн Крістіан (CH), Колб Фабріс Ален Андре (CH),
 Манчестер Янг Маріанн (CH), Ахмед Сієд Сохаїл
 (CH), Маттос де Альмейда Бесса Юліана (CH)
 (54) **ЗАСТОСУВАННЯ ІНГІБІТОРУ КАТЕПСИНУ S ПРОТИ
 УТВОРЕННЯ АНТИТІЛ ДО ЛІКАРСЬКОГО ЗАСОБУ**

A 63

(21) **а 2021 00060** (51) МПК
 (22) 11.01.2021 A63B 23/12 (2006.01)
 A63B 23/16 (2006.01)

(71) **ВАСИЛЬЄВ ОЛЕКСІЙ ВАЛЕНТИНОВИЧ (UA)**
 (72) Васильєв Олексій Валентинович (UA)
 (54) **ТРЕНАЖЕР ДЛЯ РОЗВИТКУ М'ЯЗІВ ТА СУХО-
 ЖИЛЬ ВЕРХНІХ КІНЦІВОК (ВАРІАНТИ)**

Розділ В:

Виконання операцій. Транспортування

В 01

(21) **а 2020 07368** (51) МПК (2021.01)
(22) 07.08.2019 **B01L 3/00**

(31) RA201800617
(32) 21.09.2018
(33) DK
(85) 17.12.2020
(86) PCT/IB2019/056707, 07.08.2019
(71) ФОСС АНАЛІТИКАЛ А/С (DK)
(72) Вістісен Расмус (DK), Енгелл Якоб Фредерік Шьон-дорфф (DK)
(54) ПРИСТРІЙ ДЛЯ ВІДБОРУ ЗРАЗКА, СИСТЕМА, ЩО МІСТИТЬ ПРИСТРІЙ ДЛЯ ВІДБОРУ ЗРАЗКА, ТА СПОСІБ

В 07

(21) **а 2021 00513** (51) МПК
(22) 08.02.2021 **B07B 1/06** (2006.01)
B07B 1/40 (2006.01)

(71) ВІННИЦЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ АГРАРНИЙ УНІВЕРСИТЕТ (UA)

(72) Ярошенко Леонід Вікторович (UA), Видмиш Андрій Андрійович (UA)

(54) ПОВІТРЯНО-РЕШІТЧАСТИЙ ВІБРОСЕПАРАТОР

В 65

(21) **а 2021 00353** (51) МПК (2021.01)
(22) 01.07.2019 **B65G 69/04** (2006.01)
B01J 8/00

(31) 18/56161
(32) 04.07.2018
(33) FR
(85) 01.02.2021
(86) PCT/EP2019/067629, 01.07.2019
(71) КРЕАЛІСТ-ГРУП (FR)
(72) Пусен Бернар (FR), Пусен Гійом (FR)
(54) СИСТЕМА ЗАВАНТАЖЕННЯ З КОМПЕНСОВАНОЮ ВИТРАТОЮ

Розділ С:**Хімія. Металургія****С 01**

(21) а 2020 00409 (51) МПК
(22) 24.01.2020 C01B 13/11 (2006.01)

(71) ГУБАРЄВ ГЕОРГІЙ ГЕННАДІЙОВИЧ (UA)
(72) Губарєв Георгій Геннадійович (UA)
(54) ЕЛЕКТРОДНА СИСТЕМА ГЕНЕРАТОРА ОЗОНУ З СПІРАЛЬНИМИ ЦИЛІНДРИЧНИМИ ЕЛЕКТРОДАМИ

(21) а 2021 02036 (51) МПК (2021.01)
(22) 16.09.2019 C01B 37/00
C01B 39/02 (2006.01)

(31) 18196479.2
(32) 25.09.2018
(33) EP
(85) 21.04.2021
(86) PCT/EP2019/074707, 16.09.2019
(71) ЕВОНІК ОПЕРЕЙШНС ГМБХ (DE)
(72) Шмідт Франц (DE), Антон Йохан (DE), Паскалі Маттіас (DE), Хайнрот Андреа (DE), Віланд Штефан (DE), Морелль Хайко (DE), Кресс Петер (DE), Хагеманн Міхаель Герхард (CN), Лі Чжень (DE), Хаберкорн Юліан Домінік (DE), Райнсдорф Арне (DE)
(54) СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ПОРОШКОПОДІБНИХ ПОРИСТИХ КРИСТАЛІЧНИХ СИЛІКАТІВ МЕТАЛІВ З ВИКОРИСТАННЯМ ПОЛУМЕНЕВОГО РОЗПИЛЮВАЛЬНОГО ПІРОЛІЗУ

С 02

(21) а 2020 07998 (51) МПК (2021.01)
(22) 14.12.2020 C02F 1/52 (2006.01)
C02F 9/04 (2006.01)
B09B 3/00

(71) ІНСТИТУТ КОЛОЇДНОЇ ХІМІЇ ТА ХІМІЇ ВОДИ ІМ. А.В. ДУМАНСЬКОГО НАЦІОНАЛЬНОЇ АКАДЕМІЇ НАУК УКРАЇНИ (UA)
(72) Мешкова-Клименко Наталія Аркадіївна (UA), Гречаник Сергій Вікентійович (UA), Кулішенко Олексій Юхимович (UA)
(54) СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ КОАГУЛЯНТУ ДЛЯ ОЧИСТКИ ВОДИ

С 07

(21) а 2021 00493 (51) МПК (2021.01)
(22) 08.02.2021 C07D 249/00
A61K 31/41 (2006.01)

(71) ЗАПОРІЗЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ МЕДИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ (UA), ЗОЗУЛИНЕЦЬ ДАР'Я МИКОЛАЇВНА (UA), КАПЛАУШЕНКО АНДРІЙ ГРИГОРОВИЧ (UA), ПРУГЛО ЄВГЕНІЙ СЕРГІЙОВИЧ (UA)
(72) Зозулинець Дар'я Миколаївна (UA), Каплаушенко Андрій Григорович (UA), Пругло Євгеній Сергійович (UA)
(54) ЦИНК (II) 2-((4-АМІНО-5-(ХІНОЛІН-2-ІЛ)-4Н-1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ІЛТІО)АЦЕТАТ, ЩО ЗДАТНИЙ ЗНИЖУВАТИ РІВЕНЬ ГЛЮКОЗИ В КРОВІ

(21) а 2021 00490 (51) МПК (2021.01)
(22) 08.02.2021 C07D 249/00
A61K 31/41 (2006.01)

(71) ЗАПОРІЗЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ МЕДИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ (UA), ДОВБНЯ ДМИТРО ВІТАЛІЙОВИЧ (UA), КАПЛАУШЕНКО АНДРІЙ ГРИГОРОВИЧ (UA), ПРУГЛО ЄВГЕНІЙ СЕРГІЙОВИЧ (UA)
(72) Довбня Дмитро Віталійович (UA), Каплаушенко Андрій Григорович (UA), Пругло Євгеній Сергійович (UA)
(54) ЦИНК (II) 2-((5-(3,4-ДИМЕТОКСИФЕНІЛ)-3Н-1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ІЛТІО)АЦЕТАТ, ЩО ЗДАТНИЙ ЗНИЖУВАТИ РІВЕНЬ ГЛЮКОЗИ В КРОВІ

(21) а 2021 01109 (51) МПК
(22) 23.09.2019 C07D 307/50 (2006.01)

(31) 18196303.4
(32) 24.09.2018
(33) EP
(85) 24.03.2021
(86) PCT/EP2019/075542, 23.09.2019
(71) АРБАФЛЕЙМ ТЕКНОЛОДЖІ АС (NO)
(72) Бруслетто Руне (NO)
(54) СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ФУРФУРОЛУ

(21) а 2020 08456 (51) МПК (2021.01)
(22) 28.04.2006 C07K 14/51 (2006.01)
C07K 16/00
C12N 15/13 (2006.01)
A61K 39/395 (2006.01)
A61P 19/00

(31) 60/677,583
(32) 03.05.2005
(33) US
(31) 60/776,847
(32) 24.02.2006
(33) US
(31) 60/782,244
(32) 13.03.2006
(33) US
(31) 60/792,645
(32) 17.04.2006
(33) US
(31) 11/411,003
(32) 25.04.2006
(33) US
(62) а 2012 02580, 28.04.2006
(71) ЮСБ ФАРМА С.А. (BE), ЕМДЖЕН ІНК. (US)

(72) Пашті Крістофер (US), Робінсон Мартін Кім (GB), Грехам Кевін (US), Генрі Елістер Джеймс (GB), Хоффманн Келлі Сью (US), Летам Джон (US), Лоусон Еластейр (GB), Лу Сіен Сень (US), Поуплвелл Енді (US), Шень Венянь (US), Уінклер Девід (US), Уінтерс Аарон Джордж (US)

(54) АГЕНТИ, ЯКІ ЗВ'ЯЗУЮТЬ СКЛЕРОСТИН

(21) а 2021 00253 (51) МПК
(22) 25.06.2019 C07K 14/71 (2006.01)
G01N 33/574 (2006.01)

(31) 62/689,530
(32) 25.06.2018
(33) US
(85) 25.01.2021
(86) РСТ/US2019/038971, 25.06.2019
(71) СПЕКТРУМ ФАРМАСЬЮТИКАЛС, ІНК. (US)
(72) Редді Гуру (US)
(54) КОМБІНАЦІЯ ПОЗІОТИНІБУ З ЦИТОТОКСИЧНИМ АГЕНТОМ І/АБО ІНШИМ МОЛЕКУЛЯРНО-НАЦІЛЕНИМ АГЕНТОМ Й ЇЇ ВИКОРИСТАННЯ

(21) а 2021 00395 (51) МПК
(22) 16.07.2019 C07K 16/18 (2006.01)
C12P 21/08 (2006.01)
A61K 39/395 (2006.01)
C12N 15/13 (2006.01)
C12N 5/10 (2006.01)

(31) 201810782196.2
(32) 17.07.2018
(33) CN
(85) 17.02.2021
(86) РСТ/CN2019/096159, 16.07.2019
(71) ДЖАНГСУ ХЕНГРУЙ МЕДІСІН КО., ЛТД. (CN), ШАНХАЙ ХЕНГРУЙ ФАРМАСЬЮТИКАЛ КО., ЛТД. (CN)
(72) Ін Хуа (CN), Жанг Лінг (CN), Ши Цзиньпін (CN), Жанг Сяомін (CN), Сун Джякан (CN), Ху Ціюе (CN), Тао Вейкан (CN)
(54) АНТИ-БЕТА-АМІЛОЇД АНТИТІЛО, ЙОГО АНТИГЕН-ЗВ'ЯЗУЮЧИЙ ФРАГМЕНТ ТА ЙОГО ЗАСТОСУВАННЯ

C 08

(21) а 2021 02072 (51) МПК
(22) 20.09.2019 C08J 11/24 (2006.01)
C08L 67/02 (2006.01)

(31) 62/734,421
(32) 21.09.2018
(33) US
(31) 62/831,787
(32) 10.04.2019
(33) US
(85) 20.04.2021
(86) РСТ/US2019/052263, 20.09.2019
(71) ПРЕМІРР ПЛАСТИКС ІНК. (US)

(72) Перротт Меттью Крейг' (US), Луфт Джеймс Крістофер (US), Маттіас Майкл Дін (US), Шупінг Дональд Б. (US)

(54) ПРОЦЕС І СИСТЕМА ДЛЯ ДЕПОЛІМЕРІЗАЦІЇ ПЛАСТМАСИ

C 12

(21) а 2021 02095 (51) МПК (2021.01)
(22) 24.09.2019 C12N 15/82 (2006.01)
C12N 15/54 (2006.01)
C12N 9/10 (2006.01)
A01N 57/20 (2006.01)
A01H 5/00
A01H 5/06 (2018.01)
C12Q 1/6895 (2018.01)
A01H 1/04 (2006.01)

(31) 18196607.8
(32) 25.09.2018
(33) EP
(85) 20.04.2021
(86) РСТ/EP2019/075633, 24.09.2019
(71) КВС СААТ СЕ ЕНД КО. КГАА (DE)
(72) Чарнецькі Олаф (DE), Герц Майк (DE), Лейн Йенс Крістоф (DE), Вурбс Девід (DE)
(54) СПОСІБ БОРОТЬБИ З БУР'ЯКОМ БУР'ЯНИСТИМ ТА ІНШИМИ БУР'ЯНАМИ

(21) а 2021 00608 (51) МПК
(22) 11.07.2019 C12N 15/113 (2010.01)
A61K 31/712 (2006.01)
A61K 31/7125 (2006.01)

(31) 18183477.1
(32) 13.07.2018
(33) EP
(85) 12.02.2021
(86) РСТ/EP2019/068639, 11.07.2019
(71) Ф. ХОФФМАНН-ЛЯ РОШ АГ (CH)
(72) Беррера Марко (CH), Фельбер Джозефін (CH), Хофлак Жан-Крістоф (CH), Каммлер Сюзанн (DK), Кам-Тонг Тоні (CH), Леонард Брайан (CH), Педерсен Люкке (DK), Тропбергер Філіпп (CH), Тріятні Міріам (CH), Тьорлі Даніель Джеремі (CH), Валльє Ангеліна (CH), Чжан Дзітао Девід (CH)
(54) ОЛІГОНУКЛЕОТИДИ ДЛЯ МОДУЛЯЦІЇ ЕКСПРЕСІЇ RTEL1

(21) а 2021 01738 (51) МПК
(22) 18.09.2019 C12N 15/113 (2010.01)
(31) 62/733,152
(32) 19.09.2018
(33) US
(85) 19.04.2021
(86) РСТ/US2019/051743, 18.09.2019

(71) АЙОНІС ФАРМАСУТИКАЛЗ, ІНК. (US)
(72) Фрайер С'юзан М. (US), Бьюї Гююн-Гоа (US)
(54) МОДУЛЯТОРИ ЕКСПРЕСІЇ PNPLA3

C22C 38/04 (2006.01)
C22C 38/06 (2006.01)

(21) а 2020 07521 (51) МПК
(22) 24.07.2019 C12R 1/01 (2006.01)
A61K 35/74 (2015.01)

(31) 1812079.0
(32) 24.07.2018
(33) GB
(31) 1905470.9
(32) 17.04.2019
(33) GB

(85) 22.01.2021
(86) РСТ/ЕР2019/069984, 24.07.2019
(71) БІОГАЙА АБ (SE)
(72) Рос Штефан (SE), Мьольстам Бо (SE)
(54) ВИБІР І ЗАСТОСУВАННЯ БАКТЕРІЙ, ЯКІ ЗАБЕЗ-
ПЕЧУЮТЬ МЕЛАТОНІН ДЛЯ ЗНИЖЕННЯ ДИТЯ-
ЧИХ КОЛЬОК

C 21

(21) а 2020 07296 (51) МПК (2021.01)
(22) 16.11.2020 C21C 1/02 (2006.01)
C21C 7/00
C21C 7/072 (2006.01)

(71) ІНСТИТУТ ЧОРНОЇ МЕТАЛУРГІЇ ІМ. З.І. НЕКРА-
СОВА НАЦІОНАЛЬНОЇ АКАДЕМІЇ НАУК УКРАЇНИ (UA)
(72) Шевченко Анатолій Пилипович (UA), Кисляков Во-
лодимир Геннадійович (UA), Двоскін Борис Вульфо-
вич (UA), Маначин Іван Олександрович (UA), Вер-
гун Олександр Сергійович (UA), Шевченко Сергій
Анатолійович (UA), Башмаков Олександр Михай-
лович (UA)
(54) ПРИСТРІЙ ДЛЯ ІНЖЕКТУВАННЯ ЗЕРНИСТИХ І
ПОРОШКОВИХ РЕАГЕНТІВ У РІДКИЙ РОЗПЛАВ

(21) а 2021 02067 (51) МПК
(22) 17.09.2019 C21D 8/02 (2006.01)
C21D 9/46 (2006.01)
C22C 38/02 (2006.01)

(31) РСТ/ІВ2018/057253

(32) 20.09.2018

(33) ІВ

(85) 20.04.2021

(86) РСТ/ІВ2019/057795, 17.09.2019

(71) АРСЕЛОРМІТТАЛ (LU)

(72) Алібейгі Саманех (FR)

(54) ХОЛОДНОКАТАНИЙ СТАЛЕВИЙ ЛИСТ З ПОК-
РИТТЯМ ТА СПОСІБ ЙОГО ОДЕРЖАННЯ

(21) а 2021 02062 (51) МПК
(22) 09.09.2019 C21D 8/12 (2006.01)
C22C 38/02 (2006.01)
C22C 38/04 (2006.01)
C22C 38/06 (2006.01)

(31) РСТ/ІВ2018/057246

(32) 20.09.2018

(33) ІВ

(85) 19.04.2021

(86) РСТ/ІВ2019/057571, 09.09.2019

(71) АРСЕЛОРМІТТАЛ (LU)

(72) Саркар Суджай (FR)

(54) ГАРЯЧЕКАТАНИЙ СТАЛЕВИЙ ЛИСТ З ВИСОКИМ
ВІДНОШЕННЯМ ЗБІЛЬШЕННЯ ОТВОРУ І СПО-
СІБ ЙОГО ВИРОБНИЦТВА

C 22

(21) а 2019 11538 (51) МПК
(22) 29.11.2019 C22B 1/14 (2006.01)
C22B 1/24 (2006.01)

(71) ПРИВАТНЕ АКЦІОНЕРНЕ ТОВАРИСТВО "НОВО-
КРАМАТОРСЬКИЙ МАШИНОБУДІВНИЙ ЗАВОД"
(UA)

(72) Суков Максим Геннадійович (UA), Носков Сергій
Володимирович (UA), Курноскін Костянтин Олексі-
йович (UA), Токарев Юрій Олексійович (UA)

(54) БАРАБАНИЙ ОГРУДКОВУВАЧ

Розділ F:

**Машинобудування.
Освітлювання. Опалювання.
Зброя. Підривні роботи**

F 02

(21) **а 2019 11540** (51) МПК (2021.01)
(22) 29.11.2019 **F02K 9/00**
F02K 9/97 (2006.01)

(71) **ДРОЗДОВ ПЕТРО ПОРФИРІЙОВИЧ (UA)**
(72) Дроздов Петро Порфирійович (UA)
(54) **ДВИГУН НА КОСМІЧНИХ ЧАСТИНКАХ**

(21) **а 2019 11563** (51) МПК
(22) 02.12.2019 **F02P 3/02** (2006.01)

(71) **НАЦІОНАЛЬНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ "ХАРКІВСЬКИЙ ПОЛІТЕХНІЧНИЙ ІНСТИТУТ" (UA)**
(72) Борисенко Анатолій Миколайович (UA), Кондрашов Сергій Іванович (UA), Сергієнко Микола Єгорович (UA), Мигущенко Руслан Павлович (UA), Любарський Борис Григорович (UA), Главчев Максим Ігорович (UA), Худолий Олександр Іванович (UA), Волков Володимир Петрович (UA), Павлова Наталія Миколаївна (UA), Борисенко Євген Анатолійович (UA), Пастущина Марія Ігорівна (UA)
(54) **ЕЛЕКТРОННА СИСТЕМА ЗАПАЛЮВАННЯ ДВИГУНІВ ВНУТРІШНЬОГО ЗГОРЯННЯ**

F 16

(21) **а 2019 11503** (51) МПК
(22) 28.11.2019 **F16H 1/36** (2006.01)

(71) **БИЧУК АНАТОЛІЙ ВОЛОДИМИРОВИЧ (UA)**
(72) Бичук Анатолій Володимирович (UA)
(54) **ПЛАНЕТАРНА ПЕРЕДАЧА**

F 23

(21) **а 2021 01815** (51) МПК (2021.01)
(22) 19.09.2019 **F23G 7/12** (2006.01)
F23G 5/027 (2006.01)

C10L 1/00

F23G 5/08 (2006.01)

F23G 7/06 (2006.01)

F23K 1/04 (2006.01)

C10G 1/10 (2006.01)

C01B 3/02 (2006.01)

C09C 1/48 (2006.01)

C10B 47/44 (2006.01)

C10B 53/07 (2006.01)

(31) 18398009.3

(32) 20.09.2018

(33) EP

(85) 20.04.2021

(86) PCT/EP2019/000274, 19.09.2019

(71) **АРАУЖО КАРРЕЙРА ЖЕРМАНУ (PT)**

(72) Араужо Каррейра Жерману (PT)

(54) **ПІРОЛІЗНА УСТАНОВКА**

F 24

(21) **а 2019 11504** (51) МПК (2021.01)
(22) 28.11.2019 **F24D 3/10** (2006.01)
F24D 3/18 (2006.01)
F24D 15/00
F24H 4/04 (2006.01)
F24S 90/00
F25B 29/00

(71) **НАЦІОНАЛЬНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ "ДНІПРОВСЬКА ПОЛІТЕХНІКА" (UA)**

(72) Олішевський Ілля Геннадійович (UA), Олішевський Геннадій Сергійович (UA), Гусев Олександр Юрійович (UA)

(54) **СИСТЕМА ОПАЛЕННЯ БУДІВЛІ**

F 42

(21) **а 2021 01088** (51) МПК (2021.01)
(22) 30.07.2019 **F42B 35/00**
F42B 5/02 (2006.01)

(31) PV2018-412

(32) 10.08.2018

(33) CZ

(85) 05.03.2021

(86) PCT/CZ2019/000036, 30.07.2019

(71) **ЗАТЛОУКАЛ ЯН (CZ), ЄЛІНЕК ВЛАДІМІР (CZ)**

(72) Затлоукал Ян (CZ), Єлінек Владімір (CZ)

(54) **ПАТРОННИК І ГІЛЬЗА**

Розділ G:

G01N 1/38 (2006.01)
G01N 21/07 (2006.01)

Фізика

G 01

(21) а 2021 01070 (51) МПК
(22) 28.07.2016 G01N 21/64 (2006.01)
G01N 33/14 (2006.01)(31) 15 57433
(32) 31.07.2015
(33) FR
(62) а 2018 02051, 27.02.2018
(71) ПЕРНО РІКАР (FR)
(72) Брюнері Паскаль (FR), Гуре Катя (FR), Філ Бенуа (FR),
Верже Стефані (FR), Брюнель Жан-Люк (FR), Гійом
Франсуа (FR), Брюнель Делей Кароліна (FR)
(54) СПОСІБ ПЕРЕВІРКИ АЛКОГОЛЬНОГО НАПОЮ
ЧЕРЕЗ КОНТЕЙНЕР(21) а 2021 01709 (51) МПК (2021.01)
(22) 13.09.2019 G01N 33/50 (2006.01)
G01N 33/569 (2006.01)
C07K 14/74 (2006.01)
A61K 39/00(31) 62/731,337
(32) 14.09.2018
(33) US
(31) 10 2018 122 546.6
(32) 14.09.2018
(33) DE
(31) 62/873,102
(32) 11.07.2019
(33) US
(85) 13.04.2021
(86) РСТ/ЕР2019/074511, 13.09.2019
(71) ІММАТІКС БІОТЕКНОЛОДЖІС ГМБХ (DE)
(72) Моріц Андреас (DE), Маурер Домінік (DE), Бунк Се-
бастіан (DE), Вагнер Клаудія (DE)
(54) СПОСІБ ВИСОКОПРОДУКТИВНОГО СКРИНІНГУ
НА ПЕПТИДИ З АФІННІСТЮ ДО МНС ЯК ЛІГАН-
ДІВ Т-КЛІТИННИХ РЕЦЕПТОРІВ(21) а 2020 07369 (51) МПК (2021.01)
(22) 07.08.2019 G01N 33/558 (2006.01)
B01L 3/00(31) РА201800619
(32) 21.09.2018
(33) DK
(85) 23.11.2020
(86) РСТ/ІВ2019/056709, 07.08.2019
(71) ФОСС АНАЛІТИКАЛ А/С (DK)
(72) Вістісен Расмус (DK), Енгелл Якоб Фредерік Шьон-
дорфф (DK)
(54) ПРИСТРІЙ ДЛЯ АНАЛІЗУ БІЧНОГО РОЗТІКАННЯ
І АНАЛІЗАТОР(21) а 2021 00737 (51) МПК (2021.01)
(22) 22.07.2019 G01N 33/574 (2006.01)
A61K 39/00
C07K 16/28 (2006.01)
A61K 38/17 (2006.01)
A61P 35/00(31) РСТ/ІВ2018/000983
(32) 20.07.2018
(33) ІВ
(85) 18.02.2021
(86) РСТ/ЕР2019/069723, 22.07.2019
(71) ПЬЕР ФАБР МЕДІКАМЕНТ (FR)
(72) Ферре Пьер (FR), Крузалегі Франціско (FR), Лукілі
Нуреддін (FR), Дельфур Олівьє (FR), ван дер Хорст
Едвард Тейн Хтун (US)
(54) РЕЦЕПТОР ДЛЯ VISTA

G 06

(21) а 2021 00394 (51) МПК (2021.01)
(22) 01.07.2019 G06Q 40/00
(31) 62/693,126
(32) 02.07.2018
(33) US
(85) 02.02.2021
(86) РСТ/US2019/040069, 01.07.2019
(71) ЗЕ КЛАЙМАТ КОРПОРЕЙШН (US)
(72) Булл Джейсон (US), Мур III Джеймс Клесі (US), Райх
Тімоті (US), Се Яо (US), Янг Ксяо (US), Ільманн То-
ня С (US)
(54) ОПТИМАЛЬНЕ РОЗМІЩЕННЯ ТА МОЖЛИВІСТЬ
ВИЗНАЧЕННЯ ОБ'ЄКТІВ ПОРТФОЛІО

Розділ Н:

Електрика

Н 01

(21) а 2021 00520 (51) МПК
(22) 09.02.2021 H01Q 21/06 (2006.01)

(71) ХАРКІВСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ
ІМЕНІ В.Н. КАРАЗІНА (UA)

(72) Нестеренко Михайло Васильович (UA), Катрич Віктор
Олександрович (UA), Бердник Сергій Леонідо-
вич (UA), Антоненко Євгеній Олександрович (UA)

(54) БАГАТОДІАПАЗОННА ВІБРАТОРНА АНТЕНА

Н 02

(21) а 2019 11539 (51) МПК
(22) 29.11.2019 H02K 19/36 (2006.01)

(71) НАЦІОНАЛЬНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ "ДНІ-
ПРОВСЬКА ПОЛІТЕХНІКА" (UA)

(72) Бородай Валерій Анатолійович (UA), Ковальов Олек-
сандр Робертович (UA)

(54) СПОСІБ КЕРУВАННЯ АСИНХРОННОЇ МАШИНИ

(21) а 2019 11568 (51) МПК (2021.01)
(22) 02.12.2019 H02K 21/00

(71) ІЗМАЛКОВ ГЕРМАН ІВАНОВИЧ (UA)

(72) Ізмалков Герман Іванович (UA)

(54) МАГНІТНИЙ ДВИГУН

Н 04

(21) а 2020 01629 (51) МПК
(22) 10.03.2020 H04B 1/06 (2006.01)
G01S 13/66 (2006.01)

(71) ЗАВ'ЯЛОВ СТАНІСЛАВ БОРИСОВИЧ (UA)

(72) Зав'ялов Станіслав Борисович (UA), Танигін Всево-
лод Юрійович (UA), Завгороднєв Павло Дмитрович
(UA), Швець Павло Сергійович (UA)

(54) ЦИФРОВИЙ ОБЧИСЛЮВАЧ РАДІОЛОКАЦІЙНОЇ
ГОЛОВКИ САМОНАВЕДЕННЯ "АРГС-5R"

ВІДОМОСТІ ПРО ДЕРЖАВНУ РЕЄСТРАЦІЮ ВИНАХОДІВ

Розділ А:

Життєві потреби людини

A 01

(11) 123800

(51) МПК (2021.01)
A01B 13/16 (2006.01)
A01B 21/08 (2006.01)
A01B 23/06 (2006.01)
A01B 25/00

(21) а 2019 04351

(22) 22.04.2019

(24) 03.06.2021

(72) Ветохін Володимир Іванович (UA), Жук Алексей Федосієвич (RU), Сохт Казбек Аюбовіч (RU), Біловод Олександра Іванівна (UA)

(73) ВЕТОХІН ВОЛОДИМИР ІВАНОВИЧ

вул. Підвисоцького, 6-а, кв. 17, м. Київ, 01103 (UA)

(54) ЗНАРЯДДЯ ДЛЯ ФОРМУВАННЯ ПЕРЕРИВЧАСТИХ БОРОЗЕН

(57) 1. Знаряддя для формування переривчастих борозен, що містить увігнуті диски з перемичкоутворюючими вирізами, встановлені з можливістю обертання на стояках, які встановлені з можливістю повертання відносно рами, на яких, за допомогою пружного ексцентрикового повідка з можливістю регулювання по висоті, закріплено ущільнюючі пристрої, виконані у вигляді котка з еластичною поверхнею, яке **відрізняється** тим, що диски з перемичкоутворюючими вирізами встановлені в секції попарно увігнутістю один до одного, ексцентрикові повідки стояків шарнірно з'єднані тягами з механізмом сумісного регулювання кута атаки дисків, виконаним у вигляді талрепа з муфтою, встановленою на поперечній балці рами пристрою.

2. Знаряддя для формування переривчастих борозен за п. 1, яке **відрізняється** тим, що диски встановлені увігнутістю сфери симетрично до поздовжньої осі секції, а механізм сумісного регулювання кута атаки дисків розміщений між дисками, зверненими увігнутістю сфери один до одного.

(11) 123819

(51) МПК
A01C 7/04 (2006.01)
A01C 7/08 (2006.01)
A01C 7/10 (2006.01)
A01C 7/20 (2006.01)

(21) а 2020 03451

(22) 09.11.2018

(24) 03.06.2021

(31) 102017000128557

(32) 10.11.2017

(33) IT

(31) 102017000128764

(32) 10.11.2017

(33) IT

(86) РСТ/ВВ2018/058840, 09.11.2018

(72) Донадон Джанфранко (IT), Бот Луїджі Джованні (IT), Мьоло Бруно (IT)

(73) МАСКІО ГАСПАРДО С.П.А.

Via Marcello, 73, 35011 Campodarsego (PD), Italy (IT)

(54) ВИСІВНИЙ ЕЛЕМЕНТ ДЛЯ СІЛЬСЬКОГОСПОДАРСЬКИХ СІВАЛОК ТОЧНОГО ВИСІВАННЯ

(57) 1. Висівний елемент (1) для сільськогосподарських сівалок (100) точного висівання, що містить пристрій (10) відбирання насіння, який включає кожух (10а) і перфорований диск (18), що приводиться у обертання в кожусі (10а), при цьому пристрій створення тиску з'єднаний з кожухом (10а) для забезпечення на протилежних сторонах (18а, 18b) диска (18) перепадку тиску, причому в кожусі виконаний отвір (16) для вентиляції однієї зі сторін диска (18), причому отвір (16) пневматично з'єднаний з фільтрувальною системою (42) або з віддаленою впускною системою, причому коробчастий кожух (10а) містить нерухомий коробчастий корпус (11) і кришку, яка знімно прикріплена до коробчастого корпусу, причому в коробчастому корпусі (11) виконаний отвір (16), і причому в ділянці отвору (16) на коробчастому корпусі (11) розташований щонайменше один патрубок (33, 40) для впускної труби або подавальної труби пристрою створення тиску, який **відрізняється** тим, що коробчастий корпус (11) включає перший патрубок (33), який з'єднаний з вентиляційною системою (103), здатною створювати на поверхні (18b) диска негативний тиск, і другий патрубок (40), який з'єднаний з фільтрувальною системою (42) або з віддаленою впускною системою.

2. Висівний елемент (1) за п. 1, який **відрізняється** тим, що фільтрувальна система включає фільтр або порошковий декантер, який встановлений на кінці труби, віддаленому від патрубка.

3. Висівний елемент (1) за п. 1 або 2, який **відрізняється** тим, що перший патрубок (33) з'єднаний або може бути з'єднаний з впускним отвором вентиляційної системи (103), а другий патрубок (40) з'єднаний або може бути з'єднаний з подавальним отвором вентиляційної системи (103).

4. Висівний елемент (1) за будь-яким із пп. 1-3, який **відрізняється** тим, що додатково містить висівну трубку (17), яка з'єднана з пристроєм (18) відбирання насіння, і датчик (43) проходження насіння, який розташований вздовж висівної трубки (17).

5. Висівний елемент (1) за п. 4, який **відрізняється** тим, що додатково містить ежектор (44) вздовж висівної трубки (17), який живиться від пристрою подачі стисненого повітря для пневматичного прискорення насіння, яке відділене пристроєм (18) відбирання насіння, вздовж висівної трубки (17).

6. Висівний елемент (1) за п. 5, який **відрізняється** тим, що датчик (43) проходження насіння розташований безпосередньо вище або нижче ежектора (44).

7. Сільськогосподарська сівалка (100) точного висівання, що містить множину висівних елементів (1) за будь-яким із пп. 1-6.

8. Сільськогосподарська сівалка (100) точного висівання за п. 7, яка **відрізняється** тим, що одна і та ж фільтрувальна система або віддалена впускна система з'єднана з множиною висівних елементів (1).

(11) 123803

(51) МПК

A01D 17/10 (2006.01)

A01D 33/08 (2006.01)

(21) а 2019 04758

(22) 13.10.2017

(24) 03.06.2021

(31) 10 2016 012 245.5

(32) 14.10.2016

(33) DE

(86) PCT/EP2017/076259, 13.10.2017

(72) Нікюс Крістоф (DE), Пьолькінг Альфонс (DE)

(73) GRIMME LANDMASCHINENFABRIK GMBH UND CO. KG
Hunteburger Straße 32, 49401 Damme, Germany (DE)

(54) КОРЕНЕПЛОДОЗБИРАЧ

(57) 1. Коренеплодозбирач у формі картоплезбиральної машини (1), яка забезпечена викопувальним пристроєм (2), від якого суміш (G), яка має як збирану культуру (E), так і груддя, бадилля і подібні домішки (B), переміщується в ділянку розташованих далі стрічкових сит (3), при цьому суміш (G), яка лежить на транспортерах (4), що подають, потрапляє в сортувальну зону, і в цій сортувальній зоні за допомогою розташованого над транспортером (4), що подає, а також роздільного агрегату (6'), який діє впоперек його напрямку подання на суміш (G), збирана культура (E) є сортованою таким чином, що два циркулюючі в напрямку (7, 7') відведення в однаковому напрямку відвідні транспортери (8, 9) за допомогою відповідних відвідних елементів (10, 10', 11, 11') захоплюють збирану культуру (E), подають її у двох розташованих поряд одна з одною площинах (12, 13) відведення на розташований далі сортувальний транспортер (14), і при цьому відповідні домішки (B), що залишаються на транспортері (4), що подає, у вигляді залишків, виводяться у зміщеному на 90° відносно напрямку (7, 7') відведення напрямку (5') ходу, який **відрізняється** тим, що обидва відвідних транспортери (8', 9') в ділянці принаймні одного несучого пристрою (17, 18), який відповідно утримує їх, виконані з можливістю позиціонування відвідних елементів відповідного відвідного транспортера окремо або попарно відносно транспортера, що подає, сортувальної зони як у варійованих вертикальних відстанях, так і в кутових положеннях.

2. Коренеплодозбирач за п. 1, який **відрізняється** тим, що відвідні елементи (10, 10', 11, 11') відповід-

ного відвідного транспортера (8, 9; 8', 9') виконані з можливістю переміщуватися на варійовані відстані (VA, VA') і/або кутові положення (WA, WA') відносно транспортера (4), що подає, сортувальної зони (Z).

3. Коренеплодозбирач за п. 1 або п. 2, який **відрізняється** тим, що відвідні транспортери (8', 9') відповідно до їх налаштування в ділянці сортувальної зони (Z) задають відповідний робочий зазор (AS) з варійованими розмірами.

4. Коренеплодозбирач за одним із пп. 1-3, який **відрізняється** тим, що відповідні розташовані поряд в одній площині горизонтальні площини (12', 13') відведення відвідних транспортерів (8', 9') виконані з можливістю налаштуватися в їх відповідному поперечному напрямку на змінюваний кут (WA, WA') нахилу.

5. Коренеплодозбирач за п. 4, який **відрізняється** тим, що відвідні транспортери (8', 9') виконані з можливістю нахилитися в однаковому напрямку або в протилежних напрямках.

6. Коренеплодозбирач за одним із пп. 1-5, який **відрізняється** тим, що площини (12', 13') відведення обох відвідних транспортерів (8', 9') виконані з можливістю відповідно окремого налаштування в їх паралельній відстані до розташованого нижче транспортера (4), що подає.

7. Коренеплодозбирач за одним із пп. 1-6, який **відрізняється** тим, що кожний з обох відвідних транспортерів (8', 9') має відповідно два ряди циркулюючих відвідних елементів (10, 10', 11, 11'), і при налаштуванні робочого зазору (AS) ці обидва ряди виконані з можливістю переміщуватися відповідно разом.

8. Коренеплодозбирач за одним із пп. 1-7, який **відрізняється** тим, що відвідні транспортери (8', 9') мають передбачене для їх одночасного налаштування опорне з'єднання (19) в ділянці несучого пристрою (17, 18).

9. Коренеплодозбирач за одним із пп. 1-8, який **відрізняється** тим, що кожний з обох відвідних транспортерів (8', 9') має несучу раму, яка відповідно утворює несучий пристрій (17, 18), причому їх сусідні бічні пластини (21, 22) утворюють принаймні одне опорне з'єднання (19), і на обидві зовнішні бічні пластини (20, 23) впливає відповідно принаймні один виконавчий орган (24, 25, 26) таким чином, що обидва відвідних транспортери (8', 9') виконані з можливістю бути направленими в ділянки центрального опорного з'єднання (19), і в такий спосіб за допомогою зовнішніх виконавчих органів (24, 25, 26) є керованим налаштування відвідних транспортерів (8', 9') окремо.

10. Коренеплодозбирач за одним із пп. 1-9, який **відрізняється** тим, що відвідні транспортери (8', 9') взаємодіють в ділянці центрального опорного з'єднання (19) через обертальний шарнір (27).

11. Коренеплодозбирач за п. 10, який **відрізняється** тим, що в ділянці обертального шарніра (27) передбачений зворотний механізм (29).

12. Коренеплодозбирач за одним із пп. 9-11, який **відрізняється** тим, що роздільний агрегат (6') задає триточкову опору для рами машини тільки трьома опорними з'єднаннями (29, 30, 31) в ділянці виконавчих органів (24, 25, 26).

- (11) **123765** (51) МПК
A01H 5/10 (2018.01)
C07K 14/415 (2006.01)
C12Q 1/68 (2018.01)
C12N 15/82 (2006.01)
- (21) а 2017 03903 (22) 21.09.2015
(24) 03.06.2021
(31) 62/056,365
(32) 26.09.2014
(33) US
(31) 62/187,591
(32) 01.07.2015
(33) US
(86) PCT/US2015/051214, 21.09.2015
- (72) Альбертсен Марк К. (US), Бауманн Уте (AU), Кіран Ендрю Марк (US), Сінгх Манджит (US), Тукер Еліс (AU), Уїтфорд Раян (AU)
- (73) ПІОНІР ХАЙ-БРЕД ІНТЕРНЕТНЛ, ІНК.
7100 N.W. 62nd Avenue, Johnston, Iowa 50131-1014, United States of America (US)
- (54) ПОЛІПЕПТИД Ms1 ПШЕНИЦІ, ЩО МОДУЛЮЄ ЧОЛОВІЧУ ФЕРТИЛЬНІСТЬ, ТА СПОСІБ ЙОГО ЗАСТОСУВАННЯ
- (57) 1. Касета експресії, що містить перший полінуклеотид, функціонально пов'язаний із гетерологічним, переважним для чоловічої тканини промотором, де вказаний полінуклеотид містить нуклеотидну послідовність, вибрану з групи, що складається з:
(a) нуклеотидної послідовності, яка включає в себе послідовність SEQ ID NO: 1, 2, 4, 7 або 9;
(b) нуклеотидної послідовності, яка кодує амінокислотну послідовність, що включає в себе послідовність SEQ ID NO: 3, 5, 39 або 40;
(c) нуклеотидної послідовності, яка щонайменше на 85 % ідентична послідовності повної довжини SEQ ID NO: 1, 2, 4, 7 або 9, де вказаний полінуклеотид кодує поліпептид, який модулює чоловічу фертильність;
(d) нуклеотидної послідовності, що містить щонайменше 500 послідовних нуклеотидів із послідовності SEQ ID NO: 1, 2, 4, 7 або 9, де вказаний полінуклеотид кодує поліпептид, який модулює чоловічу фертильність; та
(e) нуклеотидної послідовності, що кодує поліпептид, який щонайменше на 85 % ідентичний послідовності повної довжини SEQ ID NO: 3, 5, 39 або 40, де вказаний поліпептид модулює чоловічу фертильність.
2. Касета експресії за п. 1, де вказана касета експресії містить перший полінуклеотид, який містить нуклеотидну послідовність, вибрану із групи, що складається з:
(a) нуклеотидної послідовності, що включає в себе послідовність SEQ ID NO: 2 або 4;
(b) нуклеотидної послідовності, яка щонайменше на 95 % ідентична послідовності повної довжини SEQ ID NO: 2 або 4;
(c) нуклеотидної послідовності, яка кодує амінокислотну послідовність, що включає в себе послідовність SEQ ID NO: 3, 5, 39 або 40; та
(d) нуклеотидної послідовності, що кодує амінокислотну послідовність, яка щонайменше на 95 % ідентична послідовності повної довжини SEQ ID NO: 3, 5, 39 або 40.

3. Касета експресії за п. 1 або п. 2, що додатково містить другий полінуклеотид, функціонально пов'язаний із другим промотором, який запускає експресію у рослини.
4. Касета експресії за п. 3, де вказаний другий полінуклеотид кодує поліпептид або поліпептид, який перешкоджає функціонуванню, утворенню або розповсюдженню чоловічих гамет.
5. Касета експресії за п. 4, де вказаний другий полінуклеотид кодує барназу, DAM-метилазу, амілазу або ADP-рибозилазу.
6. Касета експресії за будь-яким із пп. 3-5, що додатково містить третій полінуклеотид, функціонально пов'язаний із промотором, де вказаний третій полінуклеотид кодує продукт маркерного гена.
7. Касета експресії за п. 6, де вказаний продукт маркерного гена включає в себе продукт маркерного гена, що забезпечує стійкість до антибіотика, або продукт маркерного гена, що визначається візуально.
8. Виділений поліпептид, що містить амінокислотну послідовність, яка включає в себе послідовність SEQ ID NO: 5.
9. Вектор, який містить касету експресії за будь-яким із пп. 1-7.
10. Рослинна клітина, яка містить касету експресії за будь-яким із пп. 1-7.
11. Рослинна клітина за п. 10, де вказана рослинна клітина одержана із однодольної або дводольної рослини.
12. Рослинна клітина за п. 11, де вказаною рослиною є маїс, ячмінь, просо, пшениця, рис, сорго, жито, соя, канولا, люцерна, сояшник, сафлор, цукрова тростина, тютюн, *Arabidopsis* або бавовник.
13. Рослина, яка містить рослинну клітину за будь-яким із пп. 10-12.
14. Рослина за п. 13, де чоловіча фертильність вказаної рослини зазнала модуляції, порівняно з контрольною рослиною.
15. Рослина за п. 14, де вказана рослина характеризується підвищеною чоловічою фертильністю, порівняно з контрольною рослиною.
16. Рослина за будь-яким із пп. 13-15, де експресія вказаного полінуклеотиду забезпечує чоловічу фертильність рослини з чоловічою стерильністю, в яких стерильність обумовлена мутацією в полінуклеотиді Ms1.
17. Рослина за будь-яким із пп. 13-16, де вказана рослина є рослиною з жіночою фертильністю.
18. Рослина за будь-яким із пп. 13-17, де утворення щонайменше однієї чоловічої тканини вказаної рослини зазнало модуляції, порівняно з контрольною рослиною.
19. Рослина за п. 18, де вказана чоловіча тканина включає в себе тичинку, пиляк, тичинкову нитку або пилкок.
20. Рослина за п. 18 або п. 19, де вказане утворення щонайменше однієї чоловічої тканини, що зазнало модуляції, передбачає підвищення утворення щонайменше однієї чоловічої тканини.
21. Рослина за будь-яким із пп. 13-20, де вказаний перший полінуклеотид стабільно вбудований у геном вказаної рослини.
22. Насінина рослини за будь-яким із пп. 13-21, де вказана насінина містить вказаний гетерологічний перший полінуклеотид.

23. Спосіб підвищення чоловічої фертильності в рослині, який передбачає введення у вказану рослину полінуклеотиду, функціонально пов'язаного із переважним для чоловічої тканини промотором, активним у вказаній рослині, при цьому вказаний полінуклеотид містить нуклеотидну послідовність, вибрану із групи, що складається з:

(а) нуклеотидної послідовності, що включає в себе послідовність SEQ ID NO: 1, 2, 4, 7 або 9;

(b) нуклеотидної послідовності, яка кодує амінокислотну послідовність, що включає в себе послідовність SEQ ID NO: 3, 5, 39 або 40;

(c) нуклеотидної послідовності, яка щонайменше на 85 % ідентична послідовності повної довжини SEQ ID NO: 1, 2, 4, 7 або 9, де вказаний полінуклеотид кодує поліпептид, який модулює чоловічу фертильність;

(d) нуклеотидної послідовності, що містить щонайменше 500 послідовних нуклеотидів із послідовності SEQ ID NO: 1, 2, 4, 7 або 9, де вказаний полінуклеотид кодує поліпептид, який модулює чоловічу фертильність; та

(e) нуклеотидної послідовності, що кодує поліпептид, який щонайменше на 85 % ідентичний послідовності повної довжини SEQ ID NO: 3, 5, 39 або 40, де вказаний поліпептид модулює чоловічу фертильність.

24. Спосіб за п. 23, де вказаний полінуклеотид містить нуклеотидну послідовність, наведену SEQ ID NO: 1, 2, 4, 7 або 9.

25. Спосіб за п. 23 або п. 24, де експресія вказаного полінуклеотиду модулює чоловічу фертильність у вказаній рослині, порівняно з контрольною рослиною.

26. Спосіб за п. 25, де експресія вказаного полінуклеотиду підвищує чоловічу фертильність у вказаній рослині, порівняно з контрольною рослиною.

27. Спосіб за будь-яким із пп. 23-26, де експресія вказаного полінуклеотиду забезпечує чоловічу фертильність рослини з чоловічою стерильністю.

28. Спосіб за будь-яким із пп. 23-27, де вказана рослина є рослиною з жіночою фертильністю.

29. Спосіб за будь-яким із пп. 23-28, де експресія вказаного полінуклеотиду модулює утворення щонайменше однієї чоловічої тканини, порівняно з контрольною рослиною.

30. Спосіб за п. 29, де вказана чоловіча тканина включає в себе тичинку, пиляк, тичинкову нитку або пилек.

31. Спосіб за п. 29 або п. 30, де вказане утворення щонайменше однієї чоловічої тканини, що зазнало модуляції, передбачає підвищення утворення щонайменше однієї чоловічої тканини.

32. Спосіб ідентифікації й/або відбору рослин пшениці, які є гомозиготними або гетерозиготними за мутацією в гені *Ms1*, де вказана мутація індукуює ядерну рецесивну чоловічу стерильність, при цьому вказаний спосіб передбачає:

(а) виявлення щонайменше одного маркерного алеля, який зчеплений і асоційований з мутацією в *Ms1*; та

(b) здійснення відбору рослин щонайменше з одним маркерним алелем.

33. Спосіб за п. 32, де вказаний маркерний алель зчеплений і асоційований з мутацією в гені *Ms1* на відстані 5 cM.

34. Спосіб за п. 32, де вказаний маркерний алель зчеплений і асоційований з мутацією в гені *Ms1* на відстані 1 cM.

35. Спосіб за п. 32, де вказаною мутацією є *ms1d*, *ms1e* або *ms1f*.

36. Спосіб за п. 32, де вказаний маркерний алель, зчеплений і асоційований з мутацією в *Ms1*, є алелем у маркері ET0487 (SEQ ID NO: 24), ET0488 (SEQ ID NO: 25), ET0489 (SEQ ID NO: 26), ET0490 (SEQ ID NO: 27), ET0491 (SEQ ID NO: 28), ET0495 (SEQ ID NO: 29), 007-0033.1 (SEQ ID NO: 32) або 007-0046.1 (SEQ ID NO: 33).

(11) 123758

(51) МПК (2021.01)

A01N 25/00

A01P 13/02 (2006.01)

(21) а 2016 04453

(22) 13.10.2011

(24) 03.06.2021

(31) 10187759.5

(32) 15.10.2010

(33) EP

(31) 61/394,469

(32) 19.10.2010

(33) US

(62) а 2013 06007, 13.10.2011

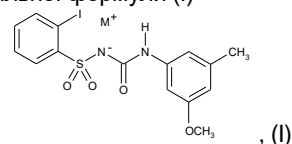
(72) Хаін Рюдігер (DE), Йоханн Герхард (DE), Донн Гюнтер (DE)

(73) БАЕР ИНТЕЛЛЕКТУЕЛ ПРОПЕРТИ ГМБХ

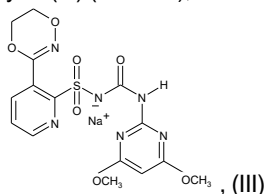
Alfred-Nobel-Str. 10, 40789 Monheim am Rhein, Germany (DE)

(54) ЗАСТОСУВАННЯ ІНГІБУЮЧИХ ALS ГЕРБІЦИДІВ ДЛЯ БОРОТЬБИ З НЕБАЖАНОЮ РОСЛИНІСТЮ НА ПЛОЩАХ ВИРОЩУВАННЯ ТОЛЕРАНТНОГО ДО ІНГІБУЮЧИХ ALS ГЕРБІЦИДІВ БУРЯКУ ЗВИЧАЙНОГО

(57) 1. Застосування одного або кількох інгібуючих ALS гербіцидів, які вибирають з групи, що складається з: хлорсульфурон [CAS RN 64902-72-3] (= A1-5); флазасульфурон [CAS RN 104040-78-0] (= A1-10); флупірсульфурон-метил-натрій [CAS RN 144740-54-5] (= A1-12); форамсульфурон [CAS RN 173159-57-4] (= A1-13); йодосульфурон-метил-натрій [CAS RN 144550-36-7] (= A1-16); мезосульфурон-метил [CAS RN 208465-21-8] (= A1-17); метсульфурон-метил [CAS RN 74223-64-6] (= A1-18); нікосульфурон [CAS RN 111991-09-4] (= A1-20); просульфурон [CAS RN 94125-34-5] (= A1-24); римсульфурон [CAS RN 122931-48-0] (= A1-26); сульфометурон-метил [CAS RN 74222-97-2] (= A1-27); сульфосульфурон [CAS RN 141776-32-1] (= A1-28); тифенсульфурон-метил [CAS RN 79277-27-3] (= A1-29); триасульфурон [CAS RN 82097-50-5] (= A1-30); трибенурон-метил [CAS RN 101200-48-0] (= A1-31); трифлорсульфурон [CAS RN 145099-21-4] (натрій) (= A1-32); тритосульфурон [CAS RN 142469-14-5] (= A1-34); сполука загальної формули (I)



де M^+ означає натрій (= A1-41);
сполука формули (III) (= A1-87),



флукарбазон-натрій [CAS RN 181274-17-9] (= A2-1);
пропоксикарбазон-натрій [CAS RN 181274-15-7] (= A2-2);
тієнкарбазон-метил [CAS RN 317815-83-1] (= A2-3);
флорасулам [CAS RN 145701-23-1] (= A3-3);
флуметсулам [CAS RN 98967-40-9] (= A3-4);
метосулам [CAS RN 139528-85-1] (= A3-5);
пенокксулам [CAS RN 219714-96-2] (= A3-6);
пірокксулам [CAS RN 422556-08-9] (= A3-7);
імазамокс [CAS RN 114311-32-9] (= B1-2);
імазапек [CAS RN 104098-48-8] (= B1-3);
імазапек [CAS RN 81334-34-1] (= B1-4);
імазахін [CAS RN 81335-37-7] (= B1-5);
імазетапек [CAS RN 81335-77-5] (= B1-6) і
біспірибак-натрій [CAS RN 125401-92-5] (= C1-1)
для боротьби з небажаною рослинністю на площах
вироснування бур'яку звичайного, причому рослини
бур'яку звичайного включають мутацію в кодоні 1705-
1707 ендogenousного гена ALS, який кодує білок ALS,
який містить амінокислоту, відмінну від триптофану,
у позиції 569, причому відповідна мутація є го-
мозиготно присутньою.

2. Застосування одного або кількох інгібуючих ALS
гербіцидів за п. 1, яке **відрізняється** тим, що інгібую-
чий(і) ALS гербіцид(и) є комбінацією форамсульфу-
рон [CAS RN 173159-57-4] (= A1-13) і тієнкарбазон-
метил [CAS RN 317815-83-1] (= A2-3).

3. Застосування одного або кількох інгібуючих ALS
гербіцидів за п. 1 або 2, яке **відрізняється** тим, що
амінокислота білка ALS у позиції 569 є лейцином.

4. Застосування одного або кількох інгібуючих ALS
гербіцидів за будь-яким з пп. 1-3 у комбінації з не ін-
гібуючими ALS гербіцидами (тобто, гербіцидами, які
демонструють механізм дії, відмінний від інгібу-
вання ферменту ALS [синтаза ацетогідроксикисло-
ти; EC 2.2.1.6] гербіциди групи D), і не інгібуючий(і)
ALS гербіцид(и) є вибраним(и) з групи, до якої нале-
жать:

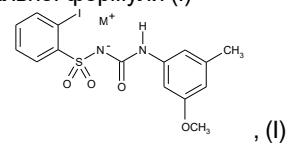
хлоридазон, клетодим, клодинафоп, клодинафоп-про-
паргіл, клопіралід, циклоксимид, десмедіфам, диме-
тенамід, диметенамід-Р, етофумезат, феноксапроп,
феноксапроп-Р, феноксапроп-етил, феноксапроп-
Р-етил, флуазифоп, флуазифоп-Р, флуазифоп-бу-
тил, флуазифоп-Р-бутил, глюфосинат, глюфосинат-
амоній, глюфосинат-Р, глюфосинат-Р-амоній, глю-
фосинат-Р-натрій, гліфосат, гліфосат-ізопропіламо-
ній, галоксифоп, галоксифоп-Р, галоксифоп-етоксі-
етил, галоксифоп-Р-етоксіетил, галоксифоп-метил,
галоксифоп-Р-метил, ленацил, метамітрон, фенме-
діфам, фенмедіфам-етил, пропаквізафоп, хінмерак,
хізалофоп, хізалофоп-етил, хізалофоп-Р, хізалофоп-
Р-етил, хізалофоп-Р-тефурил, сетоксидим.

5. Застосування одного або кількох інгібуючих ALS
гербіцидів за п. 4, яке **відрізняється** тим, що не ін-
гібуючий(і) ALS гербіцид(и) є вибраним(и) з групи,
до якої належать:

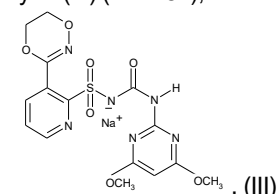
десмедіфам, етофумезат, глюфосинат, глюфоси-
нат-амоній, глюфосинат-Р, глюфосинат-Р-амоній,
глюфосинат-Р-натрій, гліфосат, гліфосат-ізопропіл-
амоній, ленацил, метамітрон, фенмедіфам, фенме-
діфам-етил.

6. Спосіб боротьби з небажаною рослинністю на
площах вирощування бур'яку звичайного, що вклю-
чає обробку небажаної вегетації одним або більш
ALS інгібіторних гербіцидів, вибраних з групи, що
складається з:

хлорсульфурон [CAS RN 64902-72-3] (= A1-5);
флазасульфурон [CAS RN 104040-78-0] (= A1-10);
флупірсульфурон-метил-натрій [CAS RN 144740-
54-5] (= A1-12);
форамсульфурон [CAS RN 173159-57-4] (= A1-13);
йодосульфурон-метил-натрій [CAS RN 144550-36-7]
(= A1-16);
мезосульфурон-метил [CAS RN 208465-21-8] (= A1-17);
метсульфурон-метил [CAS RN 74223-64-6] (= A1-18);
нікосульфурон [CAS RN 111991-09-4] (= A1-20);
просульфурон [CAS RN 94125-34-5] (= A1-24);
римсульфурон [CAS RN 122931-48-0] (= A1-26);
сульфометурон-метил [CAS RN 74222-97-2] (= A1-27);
сульфосульфурон [CAS RN 141776-32-1] (= A1-28);
тифенсульфурон-метил [CAS RN 79277-27-3] (= A1-29);
триасульфурон [CAS RN 82097-50-5] (= A1-30);
трибенурон-метил [CAS RN 101200-48-0] (= A1-31);
трифлорисульфурон [CAS RN 145099-21-4] (нат-
рій) (= A1-32);
тритосульфурон [CAS RN 142469-14-5] (= A1-34);
сполука загальної формули (I)



де M^+ означає натрій (= A1-41);
сполука формули (III) (= A1-87),



флукарбазон-натрій [CAS RN 181274-17-9] (= A2-1);
пропоксикарбазон-натрій [CAS RN 181274-15-7] (= A2-2);

тієнкарбазон-метил [CAS RN 317815-83-1] (= A2-3);
флорасулам [CAS RN 145701-23-1] (= A3-3);
флуметсулам [CAS RN 98967-40-9] (= A3-4);
метосулам [CAS RN 139528-85-1] (= A3-5);
пенокксулам [CAS RN 219714-96-2] (= A3-6);
пірокксулам [CAS RN 422556-08-9] (= A3-7);
імазамокс [CAS RN 114311-32-9] (= B1-2);
імазапек [CAS RN 104098-48-8] (= B1-3);
імазапек [CAS RN 81334-34-1] (= B1-4);
імазахін [CAS RN 81335-37-7] (= B1-5);
імазетапек [CAS RN 81335-77-5] (= B1-6) і
біспірибак-натрій [CAS RN 125401-92-5] (= C1-1),
одним або в комбінації з одним або більше гербі-
цидами, які не належать до класу ALS інгібіторних
гербіцидів (гербіциди, що не інгібують ALS), який
відрізняється тим, що обробку ведуть за наявно-
сті рослин бур'яку звичайного, які включають мута-

цію в кодоні 1705-1707 ендегенного гена ALS, який кодує білок ALS, який містить амінокислоту, відмінну від триптофану, у позиції 569, причому відповідна мутація є гомозиготно присутньою, та, де вживання вказаних гербіцидів

(i) відбувається спільно або одночасно, або

(ii) відбувається у різний час і/або багатьма порціями (послідовне внесення), у досходовому внесенні з наступними післясходовими внесеннями або ранньому післясходовому внесенні з наступним середнім або пізнім післясходовим внесенням.

7. Спосіб боротьби з небажаною рослинністю за п. 6, який **відрізняється** тим, що інгібуючий(i) ALS гербіцид(и) є комбінацією форамсульфурон [CAS RN 173159-57-4] (= A1-13) і тіенкарбазон-метил [CAS RN 317815-83-1] (= A2-3).

8. Спосіб за п. 6 або 7, який **відрізняється** тим, що не інгібуючий(i) ALS гербіцид(и) є вибраним(и) з групи, до якої належать:

хлоридазон, клетодим, клодинафоп, клодинафоп-пропаргил, клопіралід, циклоксимид, десмедіфам, диметенамід, диметенамід-Р, етофумезат, феноксапроп, феноксапроп-Р, феноксапроп-етил, феноксапроп-Р-етил, флуазифоп, флуазифоп-Р, флуазифоп-бутил, флуазифоп-Р-бутил, глюфосинат, глюфосинат-амоній, глюфосинат-Р, глюфосинат-Р-амоній, глюфосинат-Р-натрій, гліфосат, гліфосат-ізопропіл-амоній, галоксифоп, галоксифоп-Р, галоксифоп-етоксіетил, галоксифоп-Р-етоксіетил, галоксифоп-метил, галоксифоп-Р-метил, ленацил, метамітрон, фенмедіфам, фенмедіфам-етил, пропаквізафоп, хінмерак, хізалофоп, хізалофоп-етил, хізалофоп-Р, хізалофоп-Р-етил, хізалофоп-Р-тефурил, сетоксидим.

в якій стабілізуєча поверхнево-активна речовина вибрана з аніоногенної поверхнево-активної речовини або із суміші, що містить одну або декілька аніоногенних поверхнево-активних речовин та одну або декілька неіоногенних поверхнево-активних речовин,

в якій аніоногенна поверхнево-активна речовина являє собою алкансульфонат, що містить від 14 до 22 атомів вуглецю, і

в якій неіоногенна поверхнево-активна речовина вибрана з групи, яка складається з етоксилатів спиртів та тристирилфенолетоксилатів;

де композиція не містить епоксидовану жирну кислоту олії або епоксидований ефір жирної кислоти.

2. Композиція за п. 1, що додатково включає розріджувач.

3. Композиція за п. 1, що додатково включає одну або декілька допоміжних речовин.

4. Композиція за п. 2, в якій розріджувачем є неполярний розчинник.

5. Композиція за п. 4, в якій неполярним розчинником є аліфатичний вуглеводень, ароматичний вуглеводень або алкіловий складний ефір.

6. Композиція за п. 5, в якій неполярним розчинником є ароматичний вуглеводень.

7. Композиція за п. 6, в якій ароматичним вуглеводнем є бензол, толуол, ксилол, заміщений або незаміщений нафталін, моноалкілована ароматична сполука, поліалкілована ароматична сполука або їх суміші.

8. Композиція за п. 5, в якій неполярним розчинником є алкіловий складний ефір.

9. Композиція за п. 8, в якій алкіловим складним ефіром є метиловий складний ефір.

10. Композиція за п. 9, в якій алкіловим складним ефіром є метиловий складний ефір рослинної олії.

11. Композиція за п. 10, в якій рослинною олією є олія каноли, пляна, сафлорова, соєва або соняшникова олія.

12. Композиція за п. 3, в якій одна або декілька допоміжних речовин включають рослинну олію.

13. Композиція за п. 1, що містить від 0,1 до 95 мас. % оксиму циклогександіону або його сільськогосподарсько прийнятної солі або комплексу з металом.

14. Композиція за п. 1, що містить від 20 до 800 г/л оксиму циклогександіону або його сільськогосподарсько прийнятної солі або комплексу з металом.

15. Композиція за п. 1, що містить від 0,1 до 30 мас. % стабілізатора.

16. Композиція за п. 1, що містить від 0,1 до приблизно 30 мас. % поверхнево-активної речовини.

17. Композиція за п. 1, що містить від 1 до 99 мас. % розчинника.

18. Композиція за п. 1, що містить від 10 до 80 мас. % розчинника.

19. Композиція за пп. 1-18, в якій оксим циклогександіону або його сільськогосподарсько прийнятна сіль вибрана з групи, що складається з метил(Е)-(RS)-3-[1-(алоксіміно)бутил]-4-гідрокси-6,6-діметил-2-оксоциклогекс-3-енкарбоксілату), 5-(3-бутирил-2,4,6-триметилфеніл)-2-(1-етоксімінопропіл)-3-гідроксициклогекс-2-енону), (2-{1-[2-(4-хлорфенокси)пропоксиіміно]бутил}-3-гідрокси-5-тіан-3-ілциклогекс-2-енону), (±)-2-[(Е)-1-[(Е)-3-хлоралілоксиіміно]пропіл]-5-

(11) 123769

(51) МПК (2021.01)
A01N 35/10 (2006.01)
A01N 25/02 (2006.01)
A01N 25/04 (2006.01)
A01N 25/22 (2006.01)
A01N 25/30 (2006.01)
A01P 13/00

(21) а 2018 00128

(22) 25.05.2016

(24) 03.06.2021

(31) 62/171,126

(32) 04.06.2015

(33) US

(86) PCT/US2016/034137, 25.05.2016

(72) Чжан Хун (US), Мартін Крейг Арлен (US), Стріт Джон Річард (GB), Голдсміт Ендрю Евелін (GB), Грум Джон Мартін (GB), Белл Марк (GB)

(73) АРІСТА ЛАЙФСАЙЕНС НОРТ АМЕРІКА, ЕЛЕЛСІ 15401 Weston Parkway, Suite 150, Cary, NC 27513, United States of America (US)

(54) СТАБІЛІЗОВАНІ ПОВЕРХНЕВО-АКТИВНОЮ РЕЧОВИНОЮ ПРЕПАРАТИ ОКСИМУ ЦИКЛОГЕКСАНДІОКСИДУ

(57) 1. Композиція, що включає:

оксим циклогександіону або його сільськогосподарсько прийнятну сіль або комплекс з металом; і ефективну кількість однієї або більшої кількості стабілізуючих поверхнево-активних речовин для одержання стабілізованого оксиму циклогександіону;

[2-(етилтіо)пропіл]-3-гідроксициклогекс-2-енону), (±)-2-[1-(етоксііміно)бутил]-3-гідрокси-5-тіан-3-ілциклогекс-2-енону), (±)-(EZ)-2-(1-етоксіімінобутил)-5-[2-(етилтіо)пропіл]-3-гідроксициклогекс-2-енону), (EZ)-(RS)-2-[1-(2E)-3-хлоралілоксііміно]пропіл]-3-гідрокси-5-пергідропіран-4-ілциклогекс-2-ен-1-ону), 2-[1-(етоксііміно)пропіл]-3-гідрокси-5-мезитілциклогекс-2-енону) і 2-[1-[[2-(4-хлорфеноксипропокси)іміно]бутил]-3-гідрокси-5-(тетрагідро-2H-тіопіран-3-іл)-2-циклогексен-1-ону.

20. Композиція за пп. 1-19, у якій оксим циклогександіону або його сільськогосподарсько прийнятна сіль містить (±)-2-[(E)-1-[(E)-3-хлоралілоксііміно]пропіл]-5-[2-(етилтіо)пропіл]-3-гідроксициклогекс-2-енон) або його сіль.

21. Композиція за пп. 1-19, де композиція знаходиться у формі концентрату, який емульгується, що включає мікроемульсію, порошок, що змочується, гранули, пелети, дусту, олії або аерозолі, концентрату суспензії або капсули.

22. Спосіб боротьби з бур'янами, вказаний спосіб включає нанесення композиції за п. 1 на бур'ян, сільськогосподарську культуру або місце зростання.

23. Спосіб за п. 22, в якому композиція додатково включає розріджувач.

24. Спосіб за п. 22, в якому композиція додатково включає одну або декілька допоміжних речовин.

25. Спосіб за п. 22, в якому оксим циклогександіону або його сільськогосподарсько прийнятна сіль вибрана з групи, що складається з метил(E)-(RS)-3-[1-(алоксііміно)бутил]-4-гідрокси-6,6-діметил-2-оксоциклогекс-3-енкарбоксилату), 5-(3-бутирил-2,4,6-триметилфеніл)-2-(1-етоксіімінопропіл)-3-гідроксициклогекс-2-енону), (2-[1-[2-(4-хлорфеноксипропокси)іміно]бутил]-3-гідрокси-5-тіан-3-ілциклогекс-2-енону), (±)-2-[(E)-1-[(E)-3-хлоралілоксііміно]пропіл]-5-[2-(етилтіо)пропіл]-3-гідроксициклогекс-2-енону), (±)-2-[1-(етоксііміно)бутил]-3-гідрокси-5-тіан-3-ілциклогекс-2-енону), (±)-(EZ)-2-(1-етоксіімінобутил)-5-[2-(етилтіо)пропіл]-3-гідроксициклогекс-2-енону), (EZ)-(RS)-2-[1-[(2E)-3-хлоралілоксііміно]пропіл]-3-гідрокси-5-пергідропіран-4-ілциклогекс-2-ен-1-ону), 2-[1-(етоксііміно)пропіл]-3-гідрокси-5-мезитілциклогекс-2-енону) і 2-[1-[[2-(4-хлорфеноксипропокси)іміно]бутил]-3-гідрокси-5-(тетрагідро-2H-тіопіран-3-іл)-2-циклогексен-1-ону.

26. Спосіб за п. 22, в якому оксим циклогександіону або його сільськогосподарсько прийнятна сіль містить (±)-2-[(E)-1-[(E)-3-хлоралілоксііміно]пропіл]-5-[2-(етилтіо)пропіл]-3-гідроксициклогекс-2-енон) або його сіль.

27. Спосіб за п. 22, в якому бур'яном є трав'яниста рослина.

28. Спосіб за п. 27, в якому трав'яниста рослина вибрана з групи, що складається з ячменю, проса курачого, бермудської трави, параграсу широколистого, стоколосу, кукурудзи, пальчатки, дактилоктеніума єгипетського, проса роздвоєноквіткого, костриці, ячменю гривастого, щетинників, зеленого щетинника, елевсини індійської, сорго звичайного, ротбелії високої, плоскоухи селянської, пальчатки кров'яної, гусятника, вівса, грястиці збірної, багаторічних трав, пирію повзучого, пажитниці перської, проса посівного, червонозерного рису, кореневища джонсоної трави, жита, райграсу, сіянцю джонсоної трави,

сорго трав'янистого, пальчатки гладкої, шерстяку, лептохлої, проса техаського, самовисівного ячменю, самовисівного вівса, самовисівної кукурудзи, самовисівного канаркового насіння, самовисівної пшениці, пшениці, вівсюгу, дикого проса посівного, проса волосоподібного, шерстяку волохатого, вівсюнця вічнозеленого і жовтого щетинника.

29. Спосіб за п. 22, в якому композицію наносять як післясходовий засіб.

30. Спосіб за п. 22, в якому композицію наносять на сільськогосподарську культуру, що потребує боротьби з бур'янами або піддається небезпеці зараження небажаними бур'янами.

31. Спосіб за п. 30, в якому сільськогосподарською культурою є будь-яка з наступних: канола, льон, горох, сочевиця, квасоля, льон лінола, гірчиця, горіх, соняшник, картопля, сіянці люцерни, цибулі і соя.

32. Спосіб одержання стабілізованої гербіцидної композиції, що включає змішування оксиму циклогександіону з однією або більшою кількістю стабілізуючих поверхнево-активних речовин і таким чином одержання стабілізованої композиції;

в якій стабілізуюча поверхнево-активна речовина вибрана з аніоногенної поверхнево-активної речовини або із суміші, що містить одну або декілька аніоногенних поверхнево-активних речовин та одну або декілька неіоногенних поверхнево-активних речовин,

в якій аніоногенна поверхнево-активна речовина являє собою алкансульфонат, що містить від 14 до 22 атомів вуглецю, і

в якій неіоногенна поверхнево-активна речовина вибрана з групи, яка складається з етоксилатів спиртів та тристирилфенолетоксилатів;

де композиція не містить епоксидовану жирну кислоту олії або епоксидований ефір жирної кислоти.

33. Спосіб одержання стабілізованої композиції, що включає додавання до розріджувача у будь-якому порядку:

a) однієї або більшої кількості стабілізуючих поверхнево-активних речовин;

b) однієї або більшої кількості допоміжних речовин; і

c) оксиму циклогександіону;

і таким чином одержання стабілізованої композиції;

в якій стабілізуюча поверхнево-активна речовина вибрана з аніоногенної поверхнево-активної речовини або із суміші, що містить одну або декілька аніоногенних поверхнево-активних речовин та одну або декілька неіоногенних поверхнево-активних речовин, в якій аніоногенна поверхнево-активна речовина являє собою алкансульфонат, що містить від 14 до 22 атомів вуглецю, і

в якій неіоногенна поверхнево-активна речовина вибрана з групи, яка складається з етоксилатів спиртів та тристирилфенолетоксилатів;

де композиція не містить епоксидовану жирну кислоту олії або епоксидований ефір жирної кислоти.

(11) 123783

(21) а 2018 09699
(24) 03.06.2021

(51) МПК (2021.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01P 21/00

(22) 21.02.2017

(31) 1603965.3

(32) 08.03.2016

(33) GB

(86) PCT/EP2017/053882, 21.02.2017

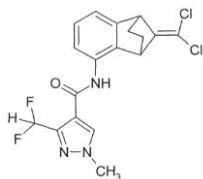
(72) Гішері Ерік (CH), Харп Тайлер Лі (US), Лайпнер Йорг (CH), Барч Міхаель (CH), Кузнецов Дмитрій (CH), Рамбах Янковскі Оділь (CH)

(73) СІНГЕНТА ПАРТІСІПЕЙШНС АГ

Schwarzwaldallee 215, 4058 Basel, Switzerland (CH)

(54) ПОЛІПШЕННЯ ХАРАКТЕРИСТИК СІЛЬСЬКОГОСПОДАРСЬКОЇ КУЛЬТУРИ

(57) 1. Спосіб поліпшення характеристик сільськогосподарських культур в підвищенні витривалості до факторів абіотичного стресу шляхом застосування щодо рослин, частин рослин, матеріалу для розмноження рослин або місця зростання рослини сполуки формули I



або композиції, що містить сполуку формули I.

2. Спосіб за п. 1, де фактор абіотичного стресу вибраний із посухи, впливу низьких температур, впливу високих температур, осмотичного стресу, затоплювання, підвищеної засоленості ґрунту, підвищеної концентрації мінеральних речовин, впливу озону, впливу сильної освітленості, обмеженої доступності азотних поживних речовин та доступності фосфорних поживних речовин.

3. Спосіб за п. 2, де фактор абіотичного стресу являє собою посуху.

4. Спосіб за будь-яким із пп. 1-3, де сільськогосподарська культура являє собою пшеницю або сою.

5. Спосіб за будь-яким із пп. 1-4, де сільськогосподарська культура являє собою сільськогосподарську культуру трансгенних рослин.

6. Спосіб за будь-яким із пп. 1-5, де сполуку формули I застосовують у комбінації з фунгіцидно активною сполукою.

7. Застосування сполуки формули I для поліпшення характеристик сільськогосподарських культур в підвищенні витривалості до факторів абіотичного стресу.

8. Застосування за п. 7, де фактор абіотичного стресу вибраний із посухи, впливу низьких температур, впливу високих температур, осмотичного стресу, затоплювання, підвищеної засоленості ґрунту, підвищеної концентрації мінеральних речовин, впливу озону, впливу сильної освітленості, обмеженої доступності азотних поживних речовин та доступності фосфорних поживних речовин.

9. Застосування за п. 8, де фактор абіотичного стресу являє собою посуху.

10. Застосування за будь-яким із пп. 7-9, де сільськогосподарська культура являє собою пшеницю або сою.

11. Застосування за будь-яким із пп. 7-10, де сільськогосподарська культура являє собою сільськогосподарську культуру трансгенних рослин.

12. Застосування за будь-яким із пп. 7-11, де сполуку формули I застосовують у комбінації з фунгіцидно активною сполукою.

A 47

(11) 123766

(51) МПК (2021.01)

A47J 43/04 (2006.01)

A47J 43/044 (2006.01)

A47J 43/046 (2006.01)

A47J 43/07 (2006.01)

A47J 44/00

B01F 7/00

B02C 23/00

(21) а 2017 08453

(22) 11.11.2016

(24) 03.06.2021

(31) 15/078,432

(32) 23.03.2016

(33) US

(86) PCT/US2016/061683, 11.11.2016

(72) Сепайр Колін (US)

(73) КАПБРАН ГОЛДІНГЗ, ЕЛЕЛСІ

Suite 2300, 11601 Wilshire Blvd., Los Angeles, California 90025, United States of America (US)

(54) ПРИСТРІЙ ДЛЯ ОБРОБКИ ХАРЧОВИХ ПРОДУКТІВ

(57) 1. Пристрій для обробки харчових продуктів, що містить основу електродвигуна, що включає в себе муфту електродвигуна;

зовнішній контейнер, що встановлюється з можливістю знімання на основі електродвигуна;

внутрішній контейнер, що встановлюється з можливістю знімання у зовнішньому контейнері, причому внутрішній контейнер має обертове з'єднання для зачеплення з муфтою електродвигуна;

внутрішню кришку, що включає в себе лопать і отвір для проходження харчових продуктів на поверхні внутрішньої кришки;

причому внутрішня кришка закріплена нагорі внутрішнього контейнера таким чином, що внутрішній контейнер має можливість переміщення разом з внутрішньою кришкою під час обертання.

2. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 1, в якому основа електродвигуна включає в себе другу муфту електродвигуна, яка має можливість обертатися зі швидкістю, відмінною від швидкості муфти електродвигуна, і друга муфта електродвигуна виконана з можливістю зачеплення з можливістю знімання з іншим вузлом для обробки харчових продуктів.

3. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 2, в якому основа електродвигуна додатково включає в себе зовнішній запобіжно-виконавчий механізм, розташований в першому радіальному місці розташування відносно центра основи електродвигуна, і внутрішній запобіжно-виконавчий механізм, розташований в другому радіальному місці розташування відносно центра основи електродвигуна;

ланцюг, який керує електродвигуном в основі електродвигуна таким чином, що електродвигун вмикається, тільки коли або зовнішній запобіжно-виконавчий механізм або внутрішній запобіжно-виконавчий механізм натиснутий.

4. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 3, в якому зовнішній контейнер включає в себе зовнішню кришку, яка встановлена з можливістю повороту, і стрижень, який розташований у безпосередній близькості від зовнішнього запобіжно-виконавчого механізму, коли зовнішній контейнер встановлений на основі електродвигуна;

при цьому стрижень встановлений з можливістю вертикального ковзання між нижнім положенням і верхнім положенням, причому, коли зовнішня кришка закрита, зовнішня кришка штовхає стрижень у нижнє положення, і, у свою чергу, стрижень натискає на зовнішній запобіжно-виконавчий механізм; і інший вузол для обробки харчових продуктів включає в себе інший стрижень, який розташований для зачеплення з внутрішнім запобіжно-виконавчим механізмом, коли інший вузол для обробки харчових продуктів встановлений на основі електродвигуна таким чином, що інший стрижень може натискати на внутрішній запобіжно-виконавчий механізм.

5. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 1, в якому внутрішня кришка є такою, що вилучається з внутрішнього контейнера, внутрішній контейнер включає в себе кільцеву стінку, причому кільцева стінка має верхню кромку, яка включає в себе виїмку, внутрішня кришка включає в себе виступ, що відповідає виїмці внутрішнього контейнера, так що внутрішня кришка закріплена на місці з внутрішнім контейнером за допомогою суміщення виїмки і виступу.

6. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 1, в якому внутрішня кришка встановлена з можливістю повороту на внутрішньому контейнері, так що внутрішня кришка закріплена на місці з внутрішнім контейнером за допомогою шарніра.

7. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 1, в якому основа електродвигуна включає в себе фланець;

зовнішній контейнер включає в себе утримувальний язичок, виконаний з можливістю ковзання відносно фланця для блокування зовнішнього контейнера на місці з основою електродвигуна.

8. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 1, в якому зовнішня кришка встановлена з можливістю повороту на зовнішньому контейнері;

основа електродвигуна включає в себе запобіжно-виконавчий механізм;

зовнішній контейнер включає в себе стрижень, встановлений з можливістю вертикального ковзання між нижнім положенням і верхнім положенням, причому, коли зовнішня кришка закрита, зовнішня кришка штовхає стрижень у нижнє положення, і, у свою чергу, стрижень натискає на запобіжно-виконавчий механізм.

9. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 1, в якому зовнішній контейнер включає в себе нижній отвір, так що обертове з'єднання внутрішнього контейнера безпосередньо приводиться у дію муфтою електродвигуна.

10. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 1, в якому зовнішній контейнер включає в себе обертове з'єднання, виконане з можливістю обертання, причому обертове з'єднання зовнішнього контейнера зачіпляється з можливістю знімання з муфтою електродвигуна, і обертове з'єднання внутрішнього контейнера зачіпляється з можливістю знімання з обертовим з'єднанням зовнішнього контейнера, так що обертове з'єднання внутрішнього контейнера непрямо приводиться у дію муфтою електродвигуна.

11. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 1, в якому лопать на внутрішній кришці є передньою лопаттю, і внутрішня кришка включає в себе задню лопать;

причому передня лопать включає в себе множину невеликих отворів для одержання локшини; причому задня лопать включає в себе пряму різальну кромку.

12. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 1, в якому внутрішня кришка включає в себе множину отворів для пальців.

13. Пристрій для обробки харчових продуктів для обробки харчових продуктів, що містить основу електродвигуна, що включає в себе муфту електродвигуна;

контейнер для вміщування харчових продуктів, встановлений з можливістю знімання на основі електродвигуна, причому контейнер для вміщування харчових продуктів приводиться у дію муфтою електродвигуна, причому контейнер для вміщування харчових продуктів має радіальну стінку і нижню частину, стінка і нижня частина утворюють порожнину для вміщування харчових продуктів;

кришку, розташовану на контейнері для вміщування харчових продуктів, причому кришка закріплена на контейнері для вміщування харчових продуктів таким чином, що кришка має можливість обертання з контейнером для вміщування харчових продуктів, причому контейнер для вміщування харчових продуктів не містить вал, причому кришка включає в себе лопать і отвір для проходження харчових продуктів;

в результаті чого харчовий продукт може бути вилучений з порожнини без необхідності розмотування харчового продукту з вала.

14. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 13, в якому нижня поверхня кришки є рівномірно плоскою.

15. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 13, в якому кришка є такою, що вилучається з контейнера для вміщування харчових продуктів, причому стінка контейнера для вміщування харчових продуктів включає в себе верхню кромку з виїмкою, кришка включає в себе виступ, що відповідає виїмці контейнера для вміщування харчових продуктів, так що кришка закріплюється на місці з контейнером для вміщування харчових продуктів за допомогою з'єднання виїмки з виступом.

16. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 13, в якому кришка встановлена з можливістю повороту на контейнері для вміщування харчових продуктів таким чином, що кришка закріплюється на місці з контейнером для вміщування харчових продуктів за допомогою шарніра.

17. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 13, в якому лопать на кришці є передньою лопаттю, і кришка включає в себе задню лопать;

причому передня лопать включає в себе множину невеликих отворів для одержання локшини; причому задня лопать включає в себе пряму різальну кромку.

18. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 13, в якому основа електродвигуна має зовнішній запобіжно-виконавчий механізм, розташований у першому радіальному місці розташування відносно центра основи електродвигуна, і внутрішній запобіжно-виконавчий механізм, розташований у другому радіальному місці розташування відносно центра основи електродвигуна;

ланцюг, який керує електродвигуном в основі електродвигуна таким чином, що електродвигун вмикається, тільки коли один з запобіжно-виконавчих механізмів натиснутий.

19. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 18, в якому основа електродвигуна з'єднана з нерухомим кожухом, який оточує контейнер для вміщування харчових продуктів, який відвертає доступ до контейнера для вміщування харчових продуктів під час обертання контейнера для вміщування харчових продуктів;

причому нерухомий кожух включає в себе зовнішню кришку, яка встановлена з можливістю повороту, і стрижень, який розташований на зовнішньому запобіжно-виконавчому механізмі; стрижень, встановлений з можливістю вертикального ковзання між нижнім положенням і верхнім положенням, причому, коли зовнішня кришка закрита, зовнішня кришка штохває стрижень у нижнє положення, і, у свою чергу, стрижень притискає зовнішній запобіжно-виконавчий механізм; і

причому основа електродвигуна виконана з можливістю зачеплення з іншим вузлом для обробки харчових продуктів; інший вузол для обробки харчових продуктів включає в себе інший стрижень, який розташований з можливістю зачеплення з внутрішнім запобіжно-виконавчим механізмом, коли інший вузол для обробки харчових продуктів встановлений на основу електродвигуна таким чином, що інший стрижень може натискати на внутрішній запобіжно-виконавчий механізм.

20. Пристрій для обробки харчових продуктів за п. 13, в якому основа електродвигуна з'єднана з нерухомим кожухом, який оточує контейнер для вміщування харчових продуктів, який відвертає доступ до контейнера для вміщування харчових продуктів під час обертання контейнера для вміщування харчових продуктів.

виконану на тильній стороні еластичної основи, із засобами регульованої подачі текучого середовища в порожнину зазначеної камери, який **відрізняється** тим, що еластична основа навколо виступів, які охоплюють виступаючі частини голок, виконана у вигляді еластичних діафрагм, товщина яких менше товщини еластичної основи.

2. Аплікатор за п. 1, який **відрізняється** тим, що еластичні діафрагми виконані з кільцевими гофрами.

3. Аплікатор за п. 1, який **відрізняється** тим, що еластична основа на робочій і тильній сторонах виконана з опірними елементами.

4. Аплікатор за п. 3, який **відрізняється** тим, що опірними елементами є виступи, що виконані на ділянках еластичної основи між еластичними діафрагмами.

5. Аплікатор за п. 3, який **відрізняється** тим, що опірними елементами є ділянки еластичної основи між еластичними діафрагмами.

6. Аплікатор за п. 1, який **відрізняється** тим, що сусідні голки виконані із металів з різними електрохімічними потенціалами.

7. Аплікатор за п. 1, який **відрізняється** тим, що голки виконані з покриттями, електрохімічний потенціал яких відрізняється від електрохімічного потенціалу матеріалу голок.

8. Аплікатор за п. 1, який **відрізняється** тим, що еластична основа має плоску конфігурацію і виконана у вигляді прямокутника або у вигляді стрічки.

9. Аплікатор за п. 1, який **відрізняється** тим, що еластична основа має об'ємну конфігурацію.

10. Аплікатор за п. 9, який **відрізняється** тим, що еластична основа виконана у вигляді циліндра, порожнина якого є замкнутою камерою.

11. Аплікатор за п. 9, який **відрізняється** тим, що еластична основа виконана у вигляді сфери або півсфери, порожнина якої є замкнутою камерою.

A 61

(11) 123812

(51) МПК (2021.01)
A61H 39/04 (2006.01)
A61H 39/08 (2006.01)
A61H 15/00
A61H 9/00
A61H 11/00

(21) а 2019 09441
(24) 03.06.2021

(22) 20.08.2019

(72) Ляпко Микола Григорович (UA)

(73) ЛЯПКО МИКОЛА ГРИГОРОВИЧ

пр. Героїв Сталінграда, 12-е, кв. 45, м. Київ, 04210 (UA)

(54) АПЛІКАТОР ДЛЯ РЕФЛЕКСОТЕРАПІЇ

(57) 1. Аплікатор для рефлексотерапії, що містить еластичну основу, голки, що закріплені в Б-еластичній основі, вістря яких виступають за межі еластичної основи з утворенням робочої сторони аплікатора, виступи, що виконані на робочій стороні еластичної основи, які охоплюють виступаючі частини голок, а також, щонайменше одну замкнуту еластичну камеру,

(11) 123811

(51) МПК (2021.01)
A61H 39/08 (2006.01)
A61H 9/00
A61H 11/00
A61H 15/00

(21) а 2019 09439
(24) 03.06.2021

(22) 20.08.2019

(72) Ляпко Микола Григорович (UA)

(73) ЛЯПКО МИКОЛА ГРИГОРОВИЧ

пр. Героїв Сталінграда, 12-е, кв. 45, м. Київ, 04210 (UA)

(54) ГОЛЧАСТИЙ АПЛІКАТОР ДЛЯ РЕФЛЕКСОТЕРАПІЇ

(57) 1. Голчастий аплікатор для рефлексотерапії, що включає еластичну основу, виконану з виступами, симетрично розташованими на протилежних сторонах еластичної основи, голки, що виконані у вигляді загостреного стрижня з потовщеннями, вістря яких виступають за межі еластичної основи з утворенням робочої сторони аплікатора, а також посадочні гнізда, що виконані в еластичній основі уздовж загальних осей протилежних виступів, в яких встановлені зазначені голки, який **відрізняється** тим, що посадочні гнізда мають радіальні розширення, що вико-

нані уздовж осей посадочних гнізд, потовщення стрижнів, що виконані в середній частині голок, розташовані в зазначених розширеннях, потовщення, що виконані на хвостовиках голок, розташовані на тильній стороні еластичної основи голки, встановлені в посадочних гніздах рухомо з можливістю переміщення потовщень середньої частини голок уздовж зазначених розширень посадочних гнізд, а на тильній стороні еластичної основи виконана щонайменше одна замкнута еластична камера, яка контактує з хвостовиками голок і виконана із засобами регульованої подачі текучого середовища в порожнину зазначеної камери.

2. Голчастий аплікатор за п. 1, який **відрізняється** тим, що сусідні голки виконані із металів з різними електрохімічними потенціалами.

3. Голчастий аплікатор за п. 1, який **відрізняється** тим, що голки виконані з покриттям, електрохімічний потенціал якого відрізняється від електрохімічного потенціалу матеріалу голки.

4. Голчастий аплікатор за п. 1, який **відрізняється** тим, що еластична основа має плоску конфігурацію і виконана у вигляді прямокутника або у вигляді стрічки.

5. Голчастий аплікатор за п. 1, який **відрізняється** тим, що еластична основа має об'ємну конфігурацію.

6. Голчастий аплікатор за п. 5, який **відрізняється** тим, що еластична основа виконана у вигляді циліндра, при цьому замкнута еластична камера розміщена в порожнині циліндра.

7. Голчастий аплікатор за п. 5, який **відрізняється** тим, що еластична основа виконана у вигляді сфери або півсфери, при цьому замкнута еластична камера розміщена в порожнині сфери або півсфери.

8. Голчастий аплікатор за п. 5, який **відрізняється** тим, що еластична основа виконана у вигляді муфти, при цьому замкнута еластична камера розміщена на зовнішній стороні муфти.

(1-МЕТИЛ-1Н-ПІРАЗОЛ-4-ІЛ)ХІНОКСАЛІН-6-ІЛ]ЕТАН-1,2-ДІАМІНУ

(57) 1. Застосування меглуміну в фармацевтичній композиції для підвищення хімічної стійкості N-(3,5-диметоксифеніл)-N'-(1-метилетил)-N-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]етан-1,2-діаміну, його фармацевтично прийнятної солі або його сольвату, що міститься у зазначеній композиції.

2. Застосування за п. 1, де фармацевтична композиція являє собою таблетку або капсулу.

3. Застосування за п. 1 або 2, де фармацевтична композиція включає N-(3,5-диметоксифеніл)-N'-(1-метилетил)-N-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]етан-1,2-діамінову основу.

4. Застосування меглуміну в фармацевтичній композиції для попередження, відстрочення, сповільнення або зменшення перетворення N-(3,5-диметоксифеніл)-N'-(1-метилетил)-N-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]етан-1,2-діаміну, його фармацевтично прийнятної солі або його сольвату, що міститься у композиції, на 6,8-диметокси-4-(1-метилетил)-1-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]-2,3,4,5-тетрагідро-1Н-1,4-бензодіазепін, його фармацевтично прийнятну сіль або його сольват.

5. Застосування за п. 4, де фармацевтична композиція являє собою таблетку або капсулу.

6. Застосування за п. 4 або 5, де фармацевтична композиція містить N-(3,5-диметоксифеніл)-N'-(1-метилетил)-N-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]етан-1,2-діамінову основу.

7. Спосіб попередження, відстрочення, сповільнення або зменшення перетворення N-(3,5-диметоксифеніл)-N'-(1-метилетил)-N-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]етан-1,2-діаміну, його фармацевтично прийнятної солі або його сольвату, що міститься у фармацевтичній композиції, на 6,8-диметокси-4-(1-метилетил)-1-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]-2,3,4,5-тетрагідро-1Н-1,4-бензодіазепін, його фармацевтично прийнятну сіль або його сольват, що включає в себе додавання меглуміну до зазначеної композиції.

8. Спосіб за п. 7, де фармацевтична композиція являє собою таблетку або капсулу.

9. Спосіб за п. 7 або 8, де композиція містить N-(3,5-диметоксифеніл)-N'-(1-метилетил)-N-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]етан-1,2-діамінову основу.

10. Фармацевтична композиція, яка містить N-(3,5-диметоксифеніл)-N'-(1-метилетил)-N-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]етан-1,2-діамін, його фармацевтично прийнятну сіль або його сольват; меглумін; та фармацевтично прийнятний носій.

11. Фармацевтична композиція за п. 10, яка містить від приблизно 0,1 до приблизно 3 % мас./мас. меглуміну.

12. Фармацевтична композиція за п. 11, яка містить від приблизно 0,1 до приблизно 2 % мас./мас. меглуміну.

13. Фармацевтична композиція за п. 12, яка містить від приблизно 0,1 до приблизно 1,5 % мас./мас. меглуміну.

14. Фармацевтична композиція за п. 13, яка містить від приблизно 0,1 до приблизно 1 % мас./мас. меглуміну.

15. Фармацевтична композиція за п. 11, яка містить від приблизно 0,5 до приблизно 3 % мас./мас. меглуміну.

(11) 123767

(51) МПК (2021.01)

A61K 9/20 (2006.01)

A61K 9/48 (2006.01)

A61K 47/18 (2017.01)

C07D 403/04 (2006.01)

A61K 31/498 (2006.01)

A61P 35/00

(21) а 2017 08900

(22) 09.02.2016

(24) 03.06.2021

(31) 15154554.8

(32) 10.02.2015

(33) EP

(31) 15188982.1

(32) 08.10.2015

(33) EP

(86) PCT/EP2016/052743, 09.02.2016

(72) Брөггіні Дієго Фернандо Доменіко (CH)

(73) АСТЕКС ТЕРАП'ЮТИКС ЛІМІТЕД

436 Cambridge Science Park, Milton Road, Cambridge Cambridgeshire CB4 0QA, United Kingdom (GB)

(54) ФАРМАЦЕВТИЧНІ КОМПОЗИЦІЇ З ВМІСТОМ N-(3,5-ДИМЕТОКСИФЕНІЛ)-N'-(1-МЕТИЛЕТІЛ)-N-[3-

16. Фармацевтична композиція за п. 15, яка містить від приблизно 0,5 до приблизно 2 % мас./мас. меглуміну.

17. Фармацевтична композиція за п. 16, яка містить від приблизно 0,5 до приблизно 1,5 % мас./мас. меглуміну.

18. Фармацевтична композиція за п. 17, яка містить від приблизно 0,5 до приблизно 1 % мас./мас. меглуміну.

19. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 10-18, де композиція являє собою таблетку або капсулу.

20. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 10-19, де композиція містить від 0-2 % мас./мас. 6,8-диметокси-4-(1-метилетил)-1-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]-2,3,4,5-тетрагідро-1Н-1,4-бензодіазепіну, його фармацевтично прийнятної солі або його сольову.

21. Фармацевтична композиція за п. 20, де композиція містить від 0-0,05 % мас./мас. 6,8-диметокси-4-(1-метилетил)-1-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]-2,3,4,5-тетрагідро-1Н-1,4-бензодіазепіну, його фармацевтично прийнятної солі або його сольову.

22. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 10-21, яка містить від 2 до 6 мг еквівалента основи N-(3,5-диметоксифеніл)-N'-(1-метилетил)-N-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]етан-1,2-діаміну, його фармацевтично прийнятної солі або його сольову.

23. Фармацевтична композиція за п. 22, яка містить 3 мг еквівалента основи N-(3,5-диметоксифеніл)-N'-(1-метилетил)-N-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]етан-1,2-діаміну, його фармацевтично прийнятної солі або його сольову.

24. Фармацевтична композиція за п. 22, яка містить 4 мг еквівалента основи N-(3,5-диметоксифеніл)-N'-(1-метилетил)-N-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]етан-1,2-діаміну, його фармацевтично прийнятної солі або його сольову.

25. Фармацевтична композиція за п. 22, яка містить 5 мг еквівалента основи N-(3,5-диметоксифеніл)-N'-(1-метилетил)-N-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]етан-1,2-діаміну, його фармацевтично прийнятної солі або його сольову.

26. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 10-25, де композиція містить N-(3,5-диметоксифеніл)-N'-(1-метилетил)-N-[3-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)хіноксалін-6-іл]етан-1,2-діамінову основу.

27. Фармацевтична композиція за п. 19, яка містить плівкове покриття, яке являє собою плівкове покриття на водній основі.

28. Фармацевтична композиція за п. 27, де плівкове покриття на водній основі являє собою систему негайного вивільнення на основі ПВА, без поліетиленгліколю.

29. Спосіб лікування раку у пацієнта, який включає в себе введення пацієнту фармацевтичної композиції за будь-яким з пп. 10-28 щоденно протягом 3 тижнів (3 тижні введення), після чого 1 тиждень композиція не вводиться (1 тиждень без введення), та повторення циклу - 3 тижні введення, 1 тиждень без введення.

30. Спосіб лікування раку у пацієнта, який включає в себе введення пацієнту фармацевтичної композиції за будь-яким з пп. 10-28 щоденно протягом 1 тиж-

ня (1 тиждень введення), після чого 1 тиждень композиція не вводиться (1 тиждень без введення), та повторення циклу - 1 тиждень введення, 1 тиждень без введення.

31. Застосування фармацевтичної композиції за будь-яким із пп. 10-28 для отримання лікарського засобу для лікування раку, де лікарський засіб слід вводити щоденно.

32. Застосування фармацевтичної композиції за п. 31 для отримання лікарського засобу для лікування раку, де лікарський засіб слід вводити щоденно протягом 3 тижнів (3 тижні введення), після чого 1 тиждень композиція не вводиться (1 тиждень без введення), та повторення циклу - 3 тижні введення, 1 тиждень без введення.

33. Застосування фармацевтичної композиції за п. 31 для отримання лікарського засобу для лікування раку, де лікарський засіб слід вводити щоденно протягом 1 тижня (1 тиждень введення), після чого 1 тиждень композиція не вводиться (1 тиждень без введення), та повторення циклу - 1 тиждень введення, 1 тиждень без введення.

34. Застосування фармацевтичної композиції за п. 31 для отримання лікарського засобу для лікування раку, де лікарський засіб слід вводити щоденно.

35. Застосування фармацевтичної композиції за будь-яким з пп. 10-28 для отримання лікарського засобу для лікування раку, де лікарський засіб слід вводити щоденно.

36. Застосування фармацевтичної композиції за будь-яким з пп. 10-28 для отримання лікарського засобу для лікування раку, де лікарський засіб слід вводити один раз на день.

37. Застосування фармацевтичної композиції за будь-яким з пп. 10-28 для отримання лікарського засобу для лікування раку.

38. Застосування фармацевтичної композиції за будь-яким із пп. 31-37

(i) для отримання лікарського засобу для лікування раку, де добова доза становить 6 мг еквівалента основи;

(ii) для отримання лікарського засобу для лікування раку, де добова доза становить 7 мг еквівалента основи;

(iii) для отримання лікарського засобу для лікування раку, де добова доза становить 8 мг еквівалента основи; або

(iv) для отримання лікарського засобу для лікування раку, де добова доза становить 9 мг еквівалента основи.

39. Застосування фармацевтичної композиції за будь-яким із пп. 31-38

(i) для отримання лікарського засобу для лікування раку, де рак являє собою рак сечового міхура;

(ii) для отримання лікарського засобу для лікування раку, де рак являє собою рак уротелію;

(iii) для отримання лікарського засобу для лікування раку, де рак являє собою метастатичний рак уротелію;

(iv) для отримання лікарського засобу для лікування раку, де рак являє собою неоперабельний рак уротелію;

(v) для отримання лікарського засобу для лікування раку, де рак являє собою холангіокарциному;

(vi) для отримання лікарського засобу для лікування раку, де рак являє собою неінвазивний рак сечового міхура.

40. Застосування фармацевтичної композиції за п. 39, де рак являє собою рак з FGFR-геномними змінами.

41. Застосування фармацевтичної композиції за п. 40, де FGFR-геномні зміни являють собою транслокації, злиття і/або мутації.

42. Застосування фармацевтичної композиції за п. 41, де зміна являє собою FGFR3-TACC3-транслокацію.

43. Застосування фармацевтичної композиції за п. 41, де зміна являє собою мутацію.

44. Застосування фармацевтичної композиції за п. 43, де мутація являє собою R248C.

45. Застосування фармацевтичної композиції за п. 43, де мутація являє собою S249C.

46. Застосування фармацевтичної композиції за будь-яким із пп. 31-38

(i) для отримання лікарського засобу для лікування раку, де рак являє собою прогресуючий або стійкий недрібноклітинний рак легень (NSCLC), рак молочної залози, мультиформну гліобластому, рак яєчника, рак голови і шиї, рак стравоходу, рак шлунка і холангіокарциному;

(ii) для отримання лікарського засобу для лікування раку, де рак являє собою множинну мієлому, мієлопроліферативний розлад, рак ендометрія, рак передміхурової залози, рак сечового міхура, рак легень, рак яєчників, рак молочної залози, рак шлунка, колоректальний рак і плоскоклітинну карциному порожнини рота;

(iii) для отримання лікарського засобу для лікування раку, де рак являє собою рак ендометрія, рак яєчників, рак шлунка, печінковоклітинний рак, рак матки, рак шийки матки і колоректальний рак.

47. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 10-28, де її використовують для лікування хворобливого стану або стану, опосередкованого кіназою FGFR.

48. Спосіб профілактики або лікування хворобливого стану або стану, опосередкованого кіназою FGFR, який включає введення суб'єкту, який потребує цього, фармацевтичної композиції за будь-яким з пп. 10-28.

49. Спосіб лікування раку у пацієнта, який включає введення пацієнту фармацевтичної композиції за будь-яким з пп. 10-28.

50. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 10-28 для застосування при лікуванні раку.

(33) IT

(86) PCT/EP2017/055964, 14.03.2017

(72) Газзаніга Андреа (IT), Сера Маттео (IT), Мароні Алессандра (IT), Барчіеллі Марко (IT)

(73) РЕКОРДАТИ ІНДУСТРІА ХІМІКА І ФАРМАСЬЮТИКА С.П.А.

via M. Civitali 1, 20148 Milano, Italy (IT)

(54) ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ ПРОЛОНГОВАНОГО ВИВІЛЬНЕННЯ, ЩО МІСТИТЬ ЦИСТЕАМІН АБО ЙОГО СОЛІ

(57) 1. Багатодозова дозована лікарська форма пролонгованого вивільнення бітартрату цистеаміну, що містить негастрорезистентне покриття.

2. Дозована лікарська форма за п. 1, яка **відрізняється** тим, що одиниці дози являють собою гранули.

3. Дозована лікарська форма за будь-яким з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що покриття складається з матеріалу, який не є розчинним у воді або має незалежну від pH розчинність у воді, необов'язково в суміші з одним або більше компонентів, вибраних з пластифікаторів, неприлипаючих агентів і каналотворюючих агентів.

4. Дозована лікарська форма за будь-яким з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що полімер вибраний з полівінілацетату; етилцелюлози; ацетату целюлози; нерозчинних акрилових похідних, таких як полі(етилакрилат-ко-метилметакрилат-ко-триметиламонійметилметакрилат хлорид) 1:2:0,1, полі(етилакрилат-ко-метилметакрилат-ко-триметиламонійетилметакрилат хлорид) 1:2:0,2 і полі(етилакрилат-ко-метилметакрилат) 2:1; гідроксипропілметилцелюлози; гідроксипропілцелюлози; гідроксіетилцелюлози; полівінілового спирту; поліетиленоксиду, переважно полівінілацетату або етилцелюлози.

5. Дозована лікарська форма за будь-яким з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що пластифікатор вибраний з пропіленгліколю, триетилцитрату, ацетилтрибутил цитрату, ацетилтриетил цитрату, бензилбензоату, рицинової олії, хлорбутанолу, діацетилмоногліцеридів, дибутилсебацінату, діетилфталату, гліцерину, маніту, поліетиленгліколю, нометилового етеру поліетиленгліколю, пулулану, сорбіту, розчину сорбіту сорбітану, триацетину, трибутилцитрату, вітаміну Е, переважно пропіленгліколю.

6. Дозована лікарська форма за будь-яким з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що каналотворюючий агент вибраний з кополімеру полівінілового спирту-поліетиленгліколю і гідроксипропілметилцелюлози.

7. Дозована лікарська форма за будь-яким з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що покриття складається з полівінілацетату, пропіленгліколю і кополімеру полівінілового спирту-поліетиленгліколю.

8. Дозована лікарська форма за будь-яким з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що нанесення покриття відповідає збільшенню маси одиниць дози без покриття на від 10 до 60 % мас., переважно від 15 до 30 % мас.

9. Застосування багатодозової дозованої лікарської форми пролонгованого вивільнення цистеаміну, цистаміну або їх фармацевтичних прийнятих солей, що містить нестійке до дії шлункового соку покриття, для введення активного інгредієнта один або два рази на добу.

(11) 123782

(51) МПК (2021.01)

A61K 9/50 (2006.01)

A61K 31/145 (2006.01)

A61P 1/16 (2006.01)

A61P 3/00

A61P 25/00

A61P 25/28 (2006.01)

A61P 39/06 (2006.01)

A61P 43/00

(21) а 2018 09212

(22) 14.03.2017

(24) 03.06.2021

(31) UA2016A001799

(32) 18.03.2016

(11) 123760

(51) МПК

A61K 31/519 (2006.01)

A61K 31/38 (2006.01)

C07D 495/04 (2006.01)

C07D 497/04 (2006.01)

(21) а 2017 03473

(22) 09.11.2012

(24) 03.06.2021

(31) 61/651,878

(32) 25.05.2012

(33) US

(31) 61/615,092

(32) 23.03.2012

(33) US

(31) 61/559,023

(32) 11.11.2011

(33) US

(31) 61/675,513

(32) 25.07.2012

(33) US

(62) а 2014 06462, 09.11.2012

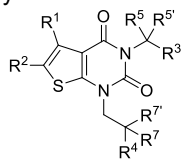
(72) Харріман Джеральдін С. (US), Массе Крейг Е. (US), Харвуд Джеймс (US), Бхат Сатеш (US), Грінвуд Джереми Роберт (US)

(73) ГІЛІАД АПОЛЛО, ЛЛС

333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA (US)

(54) СПОЛУКА (ВАРІАНТИ) ТА КОМПОЗИЦІЯ, ЩО МІСТИТЬ СПОЛУКУ

(57) 1. Сполука формули II



II

або її фармацевтично прийнятна сіль, у якій:

R¹ являє собою водень або C₁₋₄аліфатичну групу, необов'язково заміщену одним або більше галогеном, -OR, -SR, -N(R)₂, -N(R)C(O)R, -C(O)N(R)₂, -N(R)C(O)N(R)₂, -N(R)C(O)OR, -OC(O)N(R)₂, -N(R)SO₂R, -SO₂N(R)₂, -C(O)R, -C(O)OR, -OC(O)R, -S(O)R або -SO₂R;

R² являє собою Ну, де Ну вибраний з 4-8-членного насиченого або частково ненасиченого моноциклічного гетероциклічного кільця, що містить 1-2 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки, 5-6-членного моноциклічного гетероароматичного кільця, що містить 1-4 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки, та 8-10-членного біциклічного гетероароматичного кільця, що містить 1-5 гетероатомів, незалежно вибраних з азоту, кисню або сірки;

R³ являє собою водень, галоген, -CN, -OR, -SR, -N(R)₂, -N(R)C(O)R, -C(O)N(R)₂, -N(R)C(O)N(R)₂, -N(R)C(O)OR, -OC(O)N(R)₂, -N(R)SO₂R, -SO₂N(R)₂, -C(O)R, -C(O)OR, -OC(O)R, -S(O)R, -SO₂R, -B(OH)₂ або необов'язково заміщене кільце, вибране з фенілу та 5-6-членного гетероарила, що містить 1-4 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки;

R⁴ являє собою необов'язково заміщене фенільне або нафтильне кільце;

кожен з R⁵ і R^{5'} незалежно являє собою -R, -OR, -SR, -N(R)₂, -N(R)C(O)R, -C(O)N(R)₂, -N(R)C(O)N(R)₂,

-N(R)C(O)OR, -OC(O)N(R)₂, -N(R)SO₂R, -SO₂N(R)₂, -C(O)R, -C(O)OR, -OC(O)R, -S(O)R або -SO₂R; або R⁵ і R^{5'} взяті разом з утворенням циклопропіленильної, циклобутиленільної або оксетанільної групи; кожен з R⁷ і R^{7'} незалежно являє собою водень, -R, -OR, -SR, -N(R)₂, -N(R)C(O)R, -C(O)N(R)₂, -N(R)C(O)N(R)₂, -N(R)C(O)OR, -OC(O)N(R)₂, -N(R)SO₂R, -SO₂N(R)₂, -C(O)R, -C(O)OR, -OC(O)R, -S(O)R або -SO₂R; або R⁷ і R^{7'} взяті разом з утворенням 3-8-членного насиченого або частково ненасиченого моноциклічного карбоциклічного кільця або 4-8-членного насиченого або частково ненасиченого моноциклічного гетероциклічного кільця, що містить 1-2 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки; та кожен R незалежно являє собою водень або необов'язково заміщену групу, вибрану з C₁₋₆аліфатичної групи, 3-8-членного насиченого або частково ненасиченого моноциклічного карбоциклічного кільця, фенілу, 8-10-членного біциклічного ароматичного карбоциклічного кільця, 4-8-членного насиченого або частково ненасиченого моноциклічного гетероциклічного кільця, що містить 1-2 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки, 5-6-членного моноциклічного гетероароматичного кільця, що містить 1-4 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки, та 8-10-членного біциклічного гетероароматичного кільця, що містить 1-5 гетероатомів, незалежно вибраних з азоту, кисню або сірки; за умови, що сполука не являє собою сполуку, вибрану з:

2-[1-[(2R)-2-[(4-гідроксициклогексил)окси]-2-(2-метоксифеніл)етил]-5-метил-6-(1,3-оксазол-2-іл)-2,4-діоксо-1H,2H,3H,4H-тієно[2,3-d]піримідин-3-іл]-2-метилпропанову кислоту,

2-[1-[2-(2-метоксифеніл)-2-(оксан-4-ілокс)етил]-5-метил-6-(1,3-оксазол-2-іл)-2,4-діоксо-1H,2H,3H,4H-тієно[2,3-d]піримідин-3-іл]-2-метилпропанову кислоту і 2-[1-[(2R)-2-(2-етоксифеніл)-2-(оксан-4-ілокс)етил]-5-метил-6-(1,3-оксазол-2-іл)-2,4-діоксо-1H,2H,3H,4H-тієно[2,3-d]піримідин-3-іл]-2-метилпропанову кислоту.

2. Сполука за п. 1, у якій R¹ являє собою метил або трифторметил, або її фармацевтично прийнятна сіль.

3. Сполука за п. 2, у якій R² являє собою оксазоліл, або її фармацевтично прийнятна сіль.

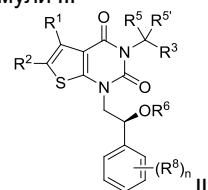
4. Сполука за п. 2, у якій R³ являє собою тетразоліл, -C(O)OR, -C(O)N(R)₂ або -OR, або її фармацевтично прийнятна сіль.

5. Сполука за п. 1, у якій кожен з R⁵ і R^{5'} являє собою метил, або її фармацевтично прийнятна сіль.

6. Сполука за п. 1, у якій R³ являє собою -C(O)OR або -C(O)N(R)₂, або її фармацевтично прийнятна сіль.

7. Сполука за п. 6, у якій R³ являє собою -C(O)OH, або її фармацевтично прийнятна сіль.

8. Сполука формули III



III

або її фармацевтично прийнятна сіль, у якій:

R¹ являє собою водень або C₁₋₄аліфатичну групу, необов'язково заміщену одним або більше галогеном, -OR, -SR, -N(R)₂, -N(R)C(O)R, -C(O)N(R)₂,

$-N(R)C(O)N(R)_2$, $-N(R)C(O)OR$, $-OC(O)N(R)_2$, $-N(R)SO_2R$, $-SO_2N(R)_2$, $-C(O)R$, $-C(O)OR$, $-OC(O)R$, $-S(O)R$ або $-SO_2R$;

R^2 являє собою H_u , де H_u вибраний з 4-8-членного насиченого або частково ненасиченого моноциклічного гетероциклічного кільця, що містить 1-2 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки, 5-6-членного моноциклічного гетероароматичного кільця, що містить 1-4 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки, та 8-10-членного біциклічного гетероароматичного кільця, що містить 1-5 гетероатомів, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки;

R^3 являє собою водень, галоген, $-CN$, $-OR$, $-SR$, $-N(R)_2$, $-N(R)C(O)R$, $-C(O)N(R)_2$, $-N(R)C(O)N(R)_2$, $-N(R)C(O)OR$, $-OC(O)N(R)_2$, $-N(R)SO_2R$, $-SO_2N(R)_2$, $-C(O)R$, $-C(O)OR$, $-OC(O)R$, $-S(O)R$, $-SO_2R$, $-B(OH)_2$ або необов'язково заміщене кільце, вибране з фенілу та 5-6-членного гетероарила, що містить 1-4 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки;

кожен з R^5 і R^5 незалежно являє собою $-R$, $-OR$, $-SR$, $-N(R)_2$, $-N(R)C(O)R$, $-C(O)N(R)_2$, $-N(R)C(O)N(R)_2$, $-N(R)C(O)OR$, $-OC(O)N(R)_2$, $-N(R)SO_2R$, $-SO_2N(R)_2$, $-C(O)R$, $-C(O)OR$, $-OC(O)R$, $-S(O)R$ або $-SO_2R$; або R^5 і R^5 взяті разом з утворенням циклопропіленільної, циклобутиленільної або оксетанільної групи;

R^6 являє собою $-R$, $-C(O)N(R)_2$ або $-C(O)R$;

кожен R^8 незалежно вибраний з галогену, $-R$, $-OR$, $-SR$, $-N(R)_2$ та дейтерію;

кожен R незалежно являє собою водень або необов'язково заміщену групу, вибрану з C_{1-6} аліфатичної групи, 3-8-членного насиченого або частково ненасиченого моноциклічного карбоциклічного кільця, фенілу, 8-10-членного біциклічного ароматичного карбоциклічного кільця; 4-8-членного насиченого або частково ненасиченого моноциклічного гетероциклічного кільця, що містить 1-2 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки, 5-6-членного моноциклічного гетероароматичного кільця, що містить 1-4 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки, та 8-10-членного біциклічного гетероароматичного кільця, що містить 1-5 гетероатомів, незалежно вибраних з азоту, кисню або сірки; і

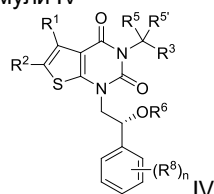
n приймає значення 0-5;

за умови, що сполука не являє собою сполуку, вибрану з:

2-[1-[(2R)-2-[(4-гідроксициклогексил)окси]-2-(2-метоксифеніл)етил]-5-метил-6-(1,3-оксазол-2-іл)-2,4-діоксо-1H,2H,3H,4H-тієно[2,3-d]піримідин-3-іл]-2-метилпропанову кислоту,

2-[1-[2-(2-метоксифеніл)-2-(оксан-4-ілоксі)етил]-5-метил-6-(1,3-оксазол-2-іл)-2,4-діоксо-1H,2H,3H,4H-тієно[2,3-d]піримідин-3-іл]-2-метилпропанову кислоту і 2-[1-[(2R)-2-(2-етоксифеніл)-2-(оксан-4-ілоксі)етил]-5-метил-6-(1,3-оксазол-2-іл)-2,4-діоксо-1H,2H,3H,4H-тієно[2,3-d]піримідин-3-іл]-2-метилпропанову кислоту.

9. Сполука формули IV



або її фармацевтично прийнятна сіль, у якій:

R^1 являє собою водень або C_{1-4} аліфатичну групу, необов'язково заміщену одним або більше галогеном, $-OR$, $-SR$, $-N(R)_2$, $-N(R)C(O)R$, $-C(O)N(R)_2$, $-N(R)C(O)N(R)_2$, $-N(R)C(O)OR$, $-OC(O)N(R)_2$, $-N(R)SO_2R$, $-SO_2N(R)_2$, $-C(O)R$, $-C(O)OR$, $-OC(O)R$, $-S(O)R$ або $-SO_2R$;

R^2 являє собою H_u , де H_u вибраний з 4-8-членного насиченого або частково ненасиченого моноциклічного гетероциклічного кільця, що містить 1-2 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки, 5-6-членного моноциклічного гетероароматичного кільця, що містить 1-4 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки, та 8-10-членного біциклічного гетероароматичного кільця, що містить 1-5 гетероатомів, незалежно вибраних з азоту, кисню або сірки;

R^3 являє собою водень, галоген, $-CN$, $-OR$, $-SR$, $-N(R)_2$, $-N(R)C(O)R$, $-C(O)N(R)_2$, $-N(R)C(O)N(R)_2$, $-N(R)C(O)OR$, $-OC(O)N(R)_2$, $-N(R)SO_2R$, $-SO_2N(R)_2$, $-C(O)R$, $-C(O)OR$, $-OC(O)R$, $-S(O)R$, $-SO_2R$, $-B(OH)_2$ або необов'язково заміщене кільце, вибране з фенілу та 5-6-членного гетероарила, що містить 1-4 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки;

кожен з R^5 і R^5 незалежно являє собою $-R$, $-OR$, $-SR$, $-N(R)_2$, $-N(R)C(O)R$, $-C(O)N(R)_2$, $-N(R)C(O)N(R)_2$, $-N(R)C(O)OR$, $-OC(O)N(R)_2$, $-N(R)SO_2R$, $-SO_2N(R)_2$, $-C(O)R$, $-C(O)OR$, $-OC(O)R$, $-S(O)R$ або $-SO_2R$; або R^5 і R^5 взяті разом з утворенням циклопропіленільної, циклобутиленільної або оксетанільної групи;

R^6 являє собою $-R$, $-C(O)N(R)_2$ або $-C(O)R$;

кожен R^8 незалежно вибраний з галогену, $-R$, $-OR$, $-SR$, $-N(R)_2$ та дейтерію;

кожен R незалежно являє собою водень або необов'язково заміщену групу, вибрану з C_{1-6} аліфатичної групи, 3-8-членного насиченого або частково ненасиченого моноциклічного карбоциклічного кільця, фенілу, 8-10-членного біциклічного ароматичного карбоциклічного кільця; 4-8-членного насиченого або частково ненасиченого моноциклічного гетероциклічного кільця, що містить 1-2 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки, 5-6-членного моноциклічного гетероароматичного кільця, що містить 1-4 гетероатоми, незалежно вибрані з азоту, кисню або сірки, та 8-10-членного біциклічного гетероароматичного кільця, що містить 1-5 гетероатомів, незалежно вибраних з азоту, кисню або сірки; і

n приймає значення 0-5;

за умови, що сполука не являє собою сполуку, вибрану з:

2-[1-[(2R)-2-[(4-гідроксициклогексил)окси]-2-(2-метоксифеніл)етил]-5-метил-6-(1,3-оксазол-2-іл)-2,4-діоксо-1H,2H,3H,4H-тієно[2,3-d]піримідин-3-іл]-2-метилпропанову кислоту,

2-[1-[2-(2-метоксифеніл)-2-(оксан-4-ілоксі)етил]-5-метил-6-(1,3-оксазол-2-іл)-2,4-діоксо-1H,2H,3H,4H-тієно[2,3-d]піримідин-3-іл]-2-метилпропанову кислоту і 2-[1-[(2R)-2-(2-етоксифеніл)-2-(оксан-4-ілоксі)етил]-5-метил-6-(1,3-оксазол-2-іл)-2,4-діоксо-1H,2H,3H,4H-тієно[2,3-d]піримідин-3-іл]-2-метилпропанову кислоту.

10. Композиція, що містить сполуку за будь-яким з пп. 1-9 або її фармацевтично прийнятну сіль і фарма-

цвітнично прийнятний носій, допоміжну речовину або наповнювач.

(11) **123780**

(51) МПК (2021.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 17/00

(21) а **2018 08829**

(22) **20.01.2017**

(24) **03.06.2021**

(31) **16152215.6**

(32) **21.01.2016**

(33) **EP**

(86) **PCT/EP2017/051133, 20.01.2017**

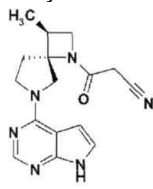
(72) Веннберг Теро (DK), Соренсен Андерс Пер (DK)

(73) **ЛЕО ФАРМА А/С**

Industriparken 55, 2750 Ballerup, Denmark (DK)

(54) **ЛІКУВАННЯ ЕКЗЕМИ КИСТЕЙ**

(57) 1. Застосування сполуки загальної формули (I)



3-[(3S,4R)-3-метил-6-(7H-піроло[2,3d]піримідин-4-іл)-1,6-діазаспіро[3,4]октан-1-іл]-3-оксопропаннітрилу, або її фармацевтично прийнятної солі в одержанні лікарського засобу для лікування хронічної екземи кистей.

2. Застосування за п. 1, де лікування є місцевим лікуванням.

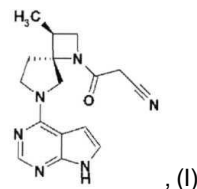
3. Застосування за п. 1 або 2, де сполуку формули (I) або її фармацевтично прийнятну сіль вводять у мазі.

4. Застосування за будь-яким з попередніх пунктів, де сполуку формули (I) або її фармацевтично прийнятну сіль вводять у концентрації 30 мг/г.

5. Застосування за будь-яким з попередніх пунктів, де сполуку формули (I) або її фармацевтично прийнятну сіль вводять у вигляді нанесення два рази на добу протягом 8 тижнів.

6. Застосування за будь-яким з попередніх пунктів, де сполуку формули (I) або її фармацевтично прийнятну сіль вводять у кількості 1,7 мг/см².

7. Застосування фармацевтичної композиції, що включає сполуку формули (I)



3-[(3S,4R)-3-метил-6-(7H-піроло[2,3d]піримідин-4-іл)-1,6-діазаспіро[3,4]октан-1-іл]-3-оксопропаннітрил, або її фармацевтично прийнятну сіль, в одержанні лікарського засобу для лікування хронічної екземи кистей.

8. Застосування за п. 7, де лікуванням є місцеве лікування.

9. Застосування за п. 7 або 8, де лікарський засіб є маззю.

10. Застосування за будь-яким з попередніх пунктів 7-9, де сполуку формули (I) або її фармацевтично прийнятну сіль вводять у концентрації 30 мг/г.

11. Застосування за будь-яким з попередніх пунктів 7-10, де сполуку формули (I) або її фармацевтично прийнятну сіль застосовують у вигляді нанесення два рази на добу протягом 8 тижнів.

12. Застосування за будь-яким з попередніх пунктів 7-11, де сполуку формули (I) або її фармацевтично прийнятну сіль вводять у кількості 1,7 мг/см².

Розділ В:**Виконання операцій.
Транспортування****В 01**

- (11) **123815** (51) МПК
B01J 8/04 (2006.01)
- (21) а 2019 11647 (22) 21.02.2018
(24) 03.06.2021
(31) 17170546.0
(32) 11.05.2017
(33) EP
(86) PCT/EP2018/054217, 21.02.2018
(72) Панца Серджіо (ІТ), Лепрі Маддалена (ІТ)
(73) КАСАЛЕ СА
Via Giulio Pocobelli 6, 6900 Lugano, Switzerland (CH)
- (54) **БАГАТОШАРОВИЙ КАТАЛІТИЧНИЙ КОНВЕРТЕР
З МІЖШАРОВИМ ОХОЛОДЖЕННЯМ**
- (57) 1. Багатошаровий циліндричний каталітичний конвертер, який містить принаймні перший каталітичний шар (4), другий каталітичний шар (5) і теплообмінник (7), розташований між першим шаром (4) і другим шаром (5) з можливістю передачі тепла від першого середовища до другого середовища, де першим середовищем є гарячий вихідний потік (ГГ) першого шару (4) перед введенням у другий шар (5), а другим середовищем є холодоагент (ХА), причому конвертер має вхід і вихід для першого середовища (ГГ) і вхід і вихід для другого середовища (ХА), який **відрізняється** тим, що теплообмінник (7) містить декілька зібраних пакетом округлих пластин (15), які являють собою суцільні круглі пластини або кільцеві пластини, а між сусідніми пластинами є проміжки (16), і забезпечено прохід вихідного потоку (ГГ) першого каталітичного шару (4) і холодоагенту (ХА), відповідно, через проміжки (16), що чергуються, між пластинами (15) теплообмінника (7), причому першим каталітичним шаром (4) є порожнистий циліндр, який містить порожнину (10а), а теплообмінник (7) розташований всередині порожнини (10а) коаксіально з першим каталітичним шаром.
2. Конвертер за п. 1, в якому пластинами (15) є штаповані пластини, які виготовлені механічно штапуванням металевго листа.
3. Конвертер за будь-яким із попередніх пунктів, в якому принаймні один із входу і виходу для принаймні одного з першого середовища і другого середовища має безліч розпилювальних отворів, розташованих на циліндричній оболонці (17) навколо складених пакетом пластин (15) теплообмінника (7).
4. Конвертер за п. 3, в якому циліндрична оболонка (17) містить першу множину впускних розпилювальних отворів для розподілу першого середовища (ГГ) і другу множину випускних розпилювальних отворів для збору першого середовища після охолодження (ОГ).
5. Конвертер за п. 4, в якому впускні розпилювальні отвори і випускні розпилювальні отвори розташовані

ні діаметрально протилежно так, що перше середовище (ГГ) проходить через проміжки (16) між пластинами (15) потоком, загалом, паралельним до напрямку наскрізного проходження від впускних розпилювальних отворів до випускних розпилювальних отворів.

6. Конвертер за будь-яким із попередніх пунктів, в якому принаймні вхід або вихід для принаймні одного з першого і другого середовищ включає прохід, виконаний у верхній кришці або нижній пластині теплообмінника (7), розташований, відповідно, вище або нижче зібраних пакетом пластин (15) теплообмінника.

7. Конвертер за п. 6, в якому прохід має форму сектора кола або сектора кільця, який, переважно, розходиться на кут від 60° до 300°, більш переважно від 90° до 240°, і ще більш переважно 180° або приблизно 180°.

8. Конвертер за п. 6 або 7, в якому одна з верхньої кришки і нижньої пластини має перший прохід для розподілу першого середовища (ГГ), а інша з верхньої кришки і нижньої пластини має другий прохід для збору першого середовища після охолодження (ОГ).

9. Конвертер за п. 8, в якому перший прохід і другий прохід розташовані діаметрально один навпроти одного так, що:

перше середовище (ГГ) протікає через проміжки потоком, загалом, паралельним до першого напрямку, який є напрямком наскрізного проходження;

перше середовище (ГГ) входить у пластинчастий теплообмінник (7) і виходить з нього потоком у другому напрямку, загалом, перпендикулярному до першого напрямку.

10. Конвертер за п. 8 або 9, в якому перший прохід включає першу групу впускних розпилювальних отворів для першого середовища (ГГ), а другий прохід включає другу групу випускних розпилювальних отворів для збору першого середовища після охолодження (ОГ).

11. Конвертер за будь-яким із попередніх пунктів, в якому пластини (15) мають вікно або декілька вікон для входу і/або виходу принаймні одного з першого і другого середовищ.

12. Конвертер за п. 11, в якому пластини мають одне вхідне вікно (22а) і одне вихідне вікно (23а) для холодоагенту (ХА), причому вказані вікна розташовані діаметрально протилежно.

13. Конвертер за п. 11, в якому пластини мають декілька вхідних вікон (22) і декілька вихідних вікон (23) для холодоагенту (ХА), причому вихідні вікна (23) розташовані ближче до краю, ніж вхідні вікна (22).

14. Конвертер за п. 13, в якому:

вхідні вікна (22) розташовані по внутрішньому ряду, а вихідні вікна (23) розташовані по зовнішньому ряду, і

вказані внутрішній і зовнішній ряди, переважно, мають форму кола, причому внутрішній ряд має перший радіус, зовнішній ряд має другий радіус, і перший радіус менший, ніж другий радіус.

15. Конвертер за будь-яким із п. 13 або 14, в якому вхідні вікна (22) суміщені по радіальному напрямку з відповідними вихідними вікнами (23).

16. Конвертер за п. 11, в якому: межі теплообмінника (7) визначаються циліндричною оболонкою (17), яка має вхідний проміжок (18)

для першого середовища, що займає сегмент циліндричної поверхні циліндричної оболонки (17), переважно в межах кута від 10° до 45° , теплообмінник (7) має вікно-колектор (19) для збору вихідного потоку після охолодження (ОГ), причому вхідний проміжок (18) і вікно-колектор (19) розташовані діаметрально протилежно один до одного так, що перше середовище проходить через проміжки (16) між пластинами (15) потоком, загалом, паралельним до заданого напрямку від вхідного проміжку (18) до вікна-колектора (19).

17. Конвертер за будь-яким із попередніх пунктів, який містить ущільнювальні планки (24), розташовані так, щоб ізолювати можливий обхідний шлях проходження першого середовища або другого середовища навколо пакета пластин (15), причому ущільнювальні планки (24), переважно, мають V-подібний поперечний переріз.

18. Конвертер за п. 1, в якому пластини (15) мають кільцеву форму, а теплообмінник (7) містить центральний колектор (21) для збору одного з першого середовища і другого середовища після теплообміну, переважно, для збору першого середовища після охолодження, причому центральний колектор (21), переважно, має кільцеву форму.

19. Конвертер за п. 1, в якому принаймні одне з першого середовища (ГГ) і другого середовища (ХА) проходить через теплообмінник (7) радіальним потоком.

20. Конвертер за будь-яким із попередніх пунктів, в якому теплообмінник (7) має зварні з'єднання між пластинами (15), розташовані з можливістю введення вихідного потоку (ГГ) першого каталітичного шару (4) і холодоагенту (ХА), відповідно, в проміжки, що чергуються.

21. Конвертер за будь-яким із попередніх пунктів, придатний для синтезу аміаку або метанолу.

22. Конвертер за будь-яким із попередніх пунктів, в якому ширина проміжків (16) складає від 1 до 10 мм, переважно від 2 до 6 мм.

23. Спосіб модернізації багат шарового каталітичного конвертера, який містить принаймні перший каталітичний шар, другий каталітичний шар і теплообмінник, розташований між першим шаром і другим шаром з можливістю передачі тепла від гарячого вихідного потоку першого шару холодоагенту перед введенням цього потоку в другий шар, причому теплообмінником є теплообмінник з трубним пучком, який відрізняється тим, що заміняють теплообмінник з трубним пучком іншим теплообмінником (7), який містить декілька складених пакетом округлих пластин (15), причому між сусідніми пластинами є проміжки (16) і вихідний потік (ГГ) першого каталітичного шару (4) і холодоагент (ХА), відповідно, подають в проміжки з чергуванням, першим каталітичним шаром (4) є порожнистий циліндр, який має порожнину (10А), а новий теплообмінник (7) зі складеними пакетом округлими пластинами розташований коаксіально з першим каталітичним шаром всередині цієї порожнини (10А).

B 23

(11) 123807

(51) МПК
B23K 26/02 (2014.01)
B23K 26/046 (2014.01)
B23K 26/064 (2014.01)

(21) а 2019 06276

(22) 05.06.2019

(24) 03.06.2021

(72) Петрів Ігор Миколайович (UA), Гричан Петро Богданович (UA), Регей Іван Іванович (UA), Кравчук Ігор Миколайович (UA), Кандяк Назар Мирославович (UA)

(73) ПЕТРІВ ІГОР МИКОЛАЙОВИЧ

вул. Галицька, 29, с. Зимна Вода, Пустомитівський р-н, Львівська обл., 81110 (UA)

ГРИЧАН ПЕТРО БОГДАНОВИЧ

вул. Величковського, 24, кв. 9, м. Львів, 79002 (UA)

(54) ПРИСТРІЙ ЛАЗЕРНОГО ВИПАЛЮВАННЯ ПАЗІВ У ПЛОСКИЙ ШТАНЦЮВАЛЬНИЙ ФОРМІ

(57) Пристрій лазерного випалювання пазів у плоскій штанцювальній формі, який містить лазерну головку з лазером, оптичну головку з фокусуючою лінзою і отвором для виходу лазерного променя та пристрій контролю, що розміщений з бокової частини оптичної головки, який відрізняється тим, що пристроєм контролю є вузол, укомплектований двома лініями, над одною з яких розміщений напівпровідниковий лазер, над другою фотоприймач, до якого послідовно підключені мікроконтролер та мікропроцесор, при цьому для можливості керування вертикального переміщення фокусуючої лінзи лазерної головки додатково встановлена зубчато-рейкова передача, зубчаста рейка якої зафіксована на оптичній головці, а її зубчасте колесо розміщене для приведення в рух від сервопривода.

(11) 123802

(51) МПК
B23K 26/352 (2014.01)
B23K 26/0622 (2014.01)
C22F 1/18 (2006.01)

(21) а 2019 04677

(22) 02.05.2019

(24) 03.06.2021

(72) Гіржон Василь Васильович (UA), Куш Ольга Василівна (UA)

(73) ЗАПОРІЗЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ

вул. Жуковського, 66, м. Запоріжжя, 69600 (UA)

(54) СПОСІБ ЗМІЦНЕННЯ ДЕТАЛЕЙ З ЛЕГОВАНОГО ТИТАНОВОГО СПЛАВУ

(57) Спосіб лазерного зміцнення поверхні деталей з легированого титанового сплаву, що включає імпульсну лазерну обробку поверхні в середовищі повітря, який відрізняється тим, що лазерну обробку здійснюють в режимі передоплавлення поверхні деталі з густиною потужності лазерного випромінювання $q=0,4-0,6$ ГВ/м², з частотою прямокутних імпульсів $\omega=8-10$ Гц та з тривалістю лазерного випромінювання $\tau=2,00-2,25$ мс.

В 44

- (11) 123788 (51) МПК
B44C 5/04 (2006.01)
- (21) а 2018 11307 (22) 04.05.2017
(24) 03.06.2021
(31) 16170640.3
(32) 20.05.2016
(33) EP
(86) PCT/EP2017/060710, 04.05.2017
(72) Кальва Норберт (DE), Ленхофф Інго (DE)
(73) ФЛУРІНГ ТЕКНОЛОДЖИС ЛТД.
SmartCity Malta SCM01, Office 406, Kalkara SCM1001,
Ricasoli, Malta (MT)
- (54) СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ЗНОСОСТІЙКОЇ ПЛИТИ НА
ОСНОВІ ДЕРЕВНИХ МАТЕРІАЛІВ І ВИРОБНИЧА
ЛІНІЯ ДЛЯ ЙОГО ЗДІЙСНЕННЯ
- (57) 1. Спосіб одержання зносостійкої плити на основі
деревних матеріалів, яка містить на верхньому боці
щонайменше один декоративний шар, зокрема у ви-
гляді надрукованого рисунка, який включає етапи:
- нанесення щонайменше одного першого шару смо-
ли на щонайменше один декоративний шар на верх-
ньому боці та на нижньому боці плити на основі де-
ревних матеріалів;
- рівномірного розподілення частинок, що забезпе-
чують зносостійкість, на першому шарі смоли на верх-
ньому боці плити на основі деревних матеріалів;
- висушування першого шару смоли, забезпеченого
частинками, що забезпечують зносостійкість на верх-
ньому боці і першого шару смоли на нижньому боці
плити на основі деревних матеріалів у щонайменше
одному сушильному пристрої;
- нанесення щонайменше одного другого шару смо-
ли на висушений перший шар смоли, забезпечений
частинками, що забезпечують зносостійкість на верх-
ньому боці та на висушений перший шар смоли на
нижньому боці плити на основі деревних матеріалів;
- висушування відповідного другого шару смоли на
верхньому боці та нижньому боці плити на основі
деревних матеріалів у щонайменше одному сушиль-
ному пристрої;
- нанесення відповідно щонайменше одного третьо-
го шару смоли на верхній бік і нижній бік плити на
основі деревних матеріалів, причому смола, нане-
сена як третій шар смоли на верхній бік плити на ос-
нові деревних матеріалів, містить скляні кульки;
- висушування третього шару смоли, нанесеного від-
повідно на верхній бік і нижній бік плити на основі
деревних матеріалів у щонайменше одному сушиль-
ному пристрої;
- нанесення відповідно щонайменше одного четве-
рого шару смоли на верхній бік і нижній бік плити
на основі деревних матеріалів, причому смола, нане-
сена як четвертий шар смоли на верхній бік пли-
ти на основі деревних матеріалів, містить скляні ку-
льки та/або волокна;
- висушування четвертого шару смоли, нанесеного
відповідно на верхній бік і нижній бік плити на основі
деревних матеріалів у щонайменше одному суши-
льному пристрої; та
- пресування багат шарової структури.

2. Спосіб за п. 1, який відрізняється тим, що кіль-
кість першого шару смоли, нанесеного на верхній
бік плити на основі деревних матеріалів, становить
50-100 г/м², переважно 60-80 г/м², особливо пере-
важно 70 г/м².
3. Спосіб за п. 1 або п. 2, який відрізняється тим,
що частинки, що забезпечують зносостійкість, явля-
ють собою частинки корунду (оксид алюмінію), кар-
биду бору, діоксиду кремнію, карбиду кремнію.
4. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який
відрізняється тим, що кількість розподілених час-
тинок, що забезпечують зносостійкість, становить 10-
50 г/м², переважно 10-30 г/м², особливо переважно
15-25 г/м².
5. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який
відрізняється тим, що кількість другого шару смо-
ли, нанесеного на верхній бік плити на основі дере-
вних матеріалів, становить 10-50 г/м², переважно 20-
30 г/м², особливо переважно 25 г/м².
6. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який
відрізняється тим, що кількість третього шару смо-
ли, нанесеного на верхній бік плити на основі дере-
вних матеріалів, становить 10-40 г/м², переважно 15-
30 г/м², особливо переважно 20 г/м², при цьому вміст
твердих частинок становить 50-80 ваг. %, переважно
60-70 ваг. %, особливо переважно 60-65 ваг. %.
7. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який
відрізняється тим, що кількість нанесених скляних
кульок, коли їх наносять разом із третім шаром смо-
ли, становить 1-5 г/м², переважно 2-4 г/м², особливо
переважно 3 г/м².
8. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який
відрізняється тим, що смола, нанесена як четве-
ртий шар смоли на верхній бік плити на основі дере-
вних матеріалів, містить деревні волокна або целюло-
зні волокна.
9. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який
відрізняється тим, що кількість четвертого шару
смоли, нанесеного на верхній бік плити на основі
деревних матеріалів, становить 10-40 г/м², переваж-
но 15-30 г/м², особливо переважно 20 г/м² за вмісту
твердих частинок, що становить 50-80 ваг. %, переваж-
но 60-70 ваг. %, особливо переважно 60-65 ваг. %.
10. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який
відрізняється тим, що кількість нанесених скляних
кульок в четвертому шарі смоли становить 1-5 г/м²,
переважно 2-4 г/м², особливо переважно 3 г/м².
11. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який
відрізняється тим, що із четвертим шаром смоли
наносять волокна у кількості 0,1-0,5 г/м², переважно
0,2-0,4 г/м², особливо переважно 0,25 г/м².
12. Плита на основі деревних матеріалів, одержува-
на, згідно зі способом, за будь-яким із пп. 1-11, яка
відрізняється тим, що містить щонайменше один
декоративний шар на верхньому боці, щонайменше
один перший шар смоли у кількості 60-100 г/м² на
верхньому боці та нижньому боці, щонайменше один
шар частинок, що забезпечують зносостійкість в пер-
шому шарі смоли на верхньому боці, щонайменше
один другий шар смоли на верхньому боці та ниж-
ньому боці, щонайменше один третій шар смоли на
верхньому боці та нижньому боці, причому третій
шар смоли на верхньому боці містить скляні кульки,
та щонайменше один четвертий шар смоли на вер-
хньому боці та нижньому боці, причому четвертий

шар смоли на верхньому боці містить скляні кульки та/або волокна.

13. Виробнича лінія для здійснення способу за будь-яким із пп. 1-11, яка містить:

- щонайменше один перший пристрій для нанесення покриття, для нанесення першого шару смоли на верхній бік та/або нижній бік опорної плити;
- щонайменше один пристрій для розподілення визначеної кількості частинок, що забезпечують зносостійкість, розташований у напрямку обробки після першого пристрою для нанесення покриття;
- щонайменше один перший сушильний пристрій для висушування першого верхнього та/або нижнього шару смоли, розташований у напрямку обробки після першого пристрою для нанесення покриття і розподільного пристрою;
- щонайменше один другий пристрій для нанесення покриття, для нанесення другого шару смоли на верхній бік та/або нижній бік опорної плити, розташований у напрямку обробки після першого сушильного пристрою;
- щонайменше один другий сушильний пристрій для висушування другого верхнього та/або нижнього шару смоли, розташований у напрямку обробки після другого пристрою для нанесення покриття;
- щонайменше один третій пристрій для нанесення покриття, для нанесення третього шару смоли на верхній бік та/або нижній бік опорної плити, розташований у напрямку обробки після другого сушильного пристрою;
- щонайменше один третій сушильний пристрій для висушування третього верхнього і нижнього шарів смоли, розташований у напрямку обробки після третього пристрою для нанесення покриття;
- щонайменше один четвертий пристрій для нанесення покриття, для нанесення четвертого шару смоли на верхній бік та/або нижній бік опорної плити, розташований у напрямку обробки після третього сушильного пристрою;
- щонайменше один четвертий сушильний пристрій для висушування четвертого верхнього і нижнього шарів смоли, розташований у напрямку обробки після четвертого пристрою для нанесення покриття; та
- щонайменше один короткотактний прохідний прес, розташований у напрямку обробки після четвертого сушильного пристрою.

14. Виробнича лінія за п. 13, яка **відрізняється** тим, що зазначений щонайменше один розподільний пристрій розташований у щонайменше одній камері, в якій передбачений щонайменше один засіб для видалення пилу, що виникає в камері.

15. Виробнича лінія за п. 13 або п. 14, яка **відрізняється** тим, що зазначений щонайменше один розподільний пристрій регулюють за допомогою світлового бар'єра.

16. Виробнича лінія за будь-яким із пп. 13-15, яка **відрізняється** тим, що зазначений щонайменше один розподільний пристрій складається із завантажувальної ємності, обертового структурованого розподільного валика і скребка.

17. Виробнича лінія за будь-яким із пп. 13-16, яка **відрізняється** тим, що зазначений щонайменше один розподільний пристрій містить систему коливних щіток.

18. Виробнича лінія за п. 16, яка **відрізняється** тим, що світловий бар'єр розташований у напрямку обробки перед розподільним валиком.

19. Виробнича лінія за будь-яким із пп. 16-18, яка **відрізняється** тим, що перед розподільним валиком передбачена щонайменше одна лійка для уловлювання зайвих частинок, що забезпечують зносостійкість.

20. Виробнича лінія за п. 19, яка **відрізняється** тим, що зазначена щонайменше одна лійка з'єднана зі щонайменше одним транспортувальним пристроєм і одним просіювальним пристроєм, при цьому зібраний у зазначений щонайменше одній лійці зайвий матеріал, що забезпечує зносостійкість, транспортується за допомогою транспортувального пристрою у просіювальний пристрій.

21. Виробнича лінія за п. 20, яка **відрізняється** тим, що комірки сита просіювального пристрою відповідають найбільшому застосовуваному розміру зерна частинок матеріалу, що забезпечує зносостійкість.

22. Виробнича лінія за будь-яким із пп. 14-21, яка **відрізняється** тим, що засіб для видалення пилу присутній у вигляді витяжного пристрою або також у вигляді пристрою для вдування повітря за допомогою сопел.

23. Виробнича лінія за будь-яким із пп. 13-22, яка **відрізняється** тим, що після третьої установки, для нанесення покриття у напрямку обробки, розташований додатковий розподільний пристрій для розподілення скляних кульок.

24. Виробнича лінія за будь-яким із пп. 13-23, яка **відрізняється** тим, що зазначений щонайменше один перший сушильний пристрій, розташований у напрямку обробки після першого пристрою для нанесення покриття і розподільного пристрою, слугує для висушування нижнього шару смоли.

B 61

(11) 123761

(51) МПК
B61G 9/04 (2006.01)

(21) а 2017 03537

(22) 12.11.2015

(24) 03.06.2021

(31) 14/540,209

(32) 13.11.2014

(33) US

(86) PCT/US2015/060456, 12.11.2015

(72) Джеймс Кеннет А. (US), Шьодль Еріх А. (US)

(73) МАЙНЕР ЕНТЕРПРАЙЗИС, ІНК.

1200 E. State Street, Geneva, IL 60134, United States of America (US)

(54) СИСТЕМА ПОГЛИНАННЯ ЕНЕРГІЇ/ЗЧЕПЛЕННЯ ЗАЛІЗНИЧНОГО ВАГОНА (ВАРІАНТИ) ТА ХОМУТ ЗАЛІЗНИЧНОГО ВАГОНА (ВАРІАНТИ)

(57) 1. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона, яка включає:

видовжену в осьовому напрямку тягову балку, яка має гніздо між передніми упорами та задніми упорами на тяговій балці;

зчеплення, яке має головну частину та хвостову частину, причому головна частина зчеплення виступає в осьовому напрямку за кінець тягової балки;

амортизуючий комплект для поглинання та повернення енергії, причому амортизуючий комплект розташований у гнізді тягової балки між передніми та задніми упорами;

хомут, який включає задню стінку, верхню стінку, яка з'єднана з задньою стінкою і виступає від неї в осьовому напрямку до переднього кінця, та нижню стінку, яка з'єднана з задньою стінкою й виступає від неї в осьовому напрямку до переднього кінця, причому задня стінка хомута розташована таким чином, щоб контактувати із заднім кінцем амортизуючого комплекту, при цьому верхня та нижня стінки хомута функціонально з'єднані з хвостовою частиною зчеплення у напрямку переднього кінця хомута;

упорну плиту зчеплення, розташовану між вільним кінцем хвостової частини зчеплення та переднім кінцем амортизуючого комплекту;

причому верхня та нижня стінки хомута, кожна має два орієнтовані вперед упорні елементи, розташовані на них, і які простягаються у протилежних бокових напрямках один від одного, при цьому два орієнтовані вперед упорні елементи на верхній стінці хомута розміщені в основному копланарно з двома орієнтованими вперед упорними елементами на нижній стінці хомута; та

при цьому система поглинання енергії/зчеплення має нейтральну позицію, повну амортизаційну позицію, розташовану на першій заданій відстані від нейтральної позиції, та повну тягову позицію, розташовану на другій заданій відстані від нейтральної позиції, причому задній кінець амортизуючого комплекту розташований навпроти задніх упорів на тяговій балці, коли система поглинання енергії/зчеплення перебуває у повній амортизаційній позиції, та упорні елементи на хомуті функціонально з'єднані з передніми упорами на балці, коли система поглинання енергії/зчеплення перебуває у повній тяговій позиції.

2. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 1, яка **відрізняється** тим, що тягове гніздо на тяговій балці має довжину приблизно 24,625 дюйма (0,625475 м) між протилежними поверхнями на передніх та задніх упорах.

3. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 1, яка **відрізняється** тим, що упорна плита зчеплення включає орієнтовану вперед поверхню, яка є зміщеною у контактну взаємодію з передніми упорами на тяговій балці амортизуючим комплектом, коли хомут перебуває у нейтральній позиції.

4. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 1, яка **відрізняється** тим, що перша задана відстань, на яку переміщується система, в цілому дорівнює або є більшою за другу задану відстань, на яку переміщується система.

5. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 4, яка **відрізняється** тим, що система має загальний комбінований хід як у амортизаційному, так і у тяговому напрямках, який становить приблизно 6,5 дюйма (0,1651 м).

6. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 1, яка **відрізняється** тим, що упорні елементи на хомуті запобігають можливому відокремленню зчеплення від тягової балки.

7. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 1, яка **відрізняється** тим, що упор-

ні елементи є сформованими суцільно з верхньою та нижньою стінками на хомуті.

8. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 1, яка **відрізняється** тим, що амортизуючий комплект включає вузол поглинального апарата залізничного вагона, який включає корпус зі стінками.

9. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 8, яка **відрізняється** тим, що корпус зі стінками вузла поглинального апарата має закритий кінець та відкритий кінець.

10. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона, яка включає:

видовжену в осьовому напрямку тягову балку, яка має тягове гніздо між передніми упорами та задніми упорами на тяговій балці;

зчеплення, яке має головну частину та хвостову частину, причому головна частина зчеплення виступає в осьовому напрямку за межі тягової балки;

перший амортизуючий комплект, розташований у тяговому гнізді тягової балки для поглинання та повернення енергії, що до нього прикладається,

другий амортизуючий комплект, розташований у тяговому гнізді тягової балки співвісно з першим амортизуючим комплектом для поглинання та повернення енергії, що до нього прикладається;

хомут, який включає задню стінку, верхню стінку, яка з'єднана з задньою стінкою й виступає від неї в осьовому напрямку до переднього кінця, та нижню стінку, яка з'єднана з задньою стінкою й виступає від неї в осьовому напрямку до переднього кінця, причому задня стінка хомута розташована таким чином, щоб контактувати із заднім кінцем другого амортизуючого комплекту, при цьому верхня та нижня стінки хомута функціонально з'єднані з хвостовою частиною зчеплення у напрямку переднього кінця хомута; передню упорну плиту зчеплення, розташовану між вільним кінцем хвостової частини зчеплення та переднім кінцем першого амортизуючого комплекту; задню упорну плиту, розташовану між заднім кінцем першого амортизуючого комплекту та переднім кінцем другого амортизуючого комплекту;

причому верхня та нижня стінки хомута, кожна мають два орієнтовані вперед упорні елементи, які простягаються у протилежних бокових напрямках один від одного, при цьому два орієнтовані вперед упорні елементи на верхній стінці хомута розміщені в основному копланарно з двома орієнтованими вперед упорними елементами на нижній стінці хомута; і при цьому система поглинання енергії/зчеплення має нейтральну позицію, повну амортизаційну позицію, розташовану на заданій відстані від нейтральної позиції, та повну тягову позицію, розташовану на заданій відстані від нейтральної позиції, причому задній кінець другого амортизуючого комплекту розташовується навпроти задніх упорів на тяговій балці, коли система поглинання енергії/зчеплення перебуває у повній амортизаційній позиції, і упорні елементи на хомуті функціонально з'єднані з передніми упорами, коли система поглинання енергії/зчеплення перебуває у повній тяговій позиції.

11. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 10, яка **відрізняється** тим, що тягове гніздо на тяговій балці має довжину приблизно 49,25 дюйма (1,25095 м) між протилежними поверхнями на передніх та задніх упорах.

12. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 10, яка **відрізняється** тим, що передня упорна плита зчеплення включає орієнтовану вперед поверхню, яка є зміщеною у контактну взаємодію з передніми упорами на тяговій балці, коли система поглинання енергії/зчеплення перебуває у нейтральній позиції.

13. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 10, яка **відрізняється** тим, що система має загальний комбінований хід як у амортизаційному, так і у тяговому напрямках, який становить приблизно 10,0 дюймів (0,254 м).

14. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 10, яка **відрізняється** тим, що упорні елементи на хомуті запобігають можливому відокремленню зчеплення від тягової балки.

15. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 10, яка **відрізняється** тим, що перший амортизуючий комплект включає вузол поглинального апарата, який включає корпус зі стінками.

16. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 15, яка **відрізняється** тим, що корпус зі стінками вузла поглинального апарата має закритий кінець та відкритий кінець.

17. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 10, яка **відрізняється** тим, що другий амортизуючий комплект включає вузол поглинального апарата, який включає корпус зі стінками.

18. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 17, яка **відрізняється** тим, що корпус зі стінками вузла поглинального апарата має закритий кінець та відкритий кінець.

19. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона, яка включає:

видовжену в осьовому напрямку тягову балку, яка має гніздо між передніми упорами та задніми упорами на тяговій балці;

зчеплення, яке має головну частину та хвостову частину, причому головна частина зчеплення виступає в осьовому напрямку за кінець тягової балки; амортизуючий комплект для поглинання та повернення енергії, причому амортизуючий комплект розташований у гнізді тягової балки між передніми та задніми упорами, при цьому амортизуючий комплект включає корпус зі стінками;

хомут, який включає задню стінку, верхню стінку, яка з'єднана з задньою стінкою й виступає від неї в осьовому напрямку до переднього кінця, та нижню стінку, яка з'єднана з задньою стінкою й виступає від задньої стінки в осьовому напрямку до переднього кінця, причому задня стінка хомута розташована таким чином, щоб контактувати із заднім кінцем корпусу амортизуючого комплексу, причому верхня та нижня стінки хомута функціонально з'єднані з хвостовою частиною зчеплення у напрямку переднього кінця хомута, причому верхня та нижня стінки хомута охоплюють корпус амортизуючого комплексу, розташований між ними;

упорну плиту зчеплення, розташовану між вільним кінцем хвостової частини зчеплення та переднім кінцем амортизуючого комплексу;

причому верхня та нижня стінки хомута, кожна має два орієнтовані вперед упорні елементи, розташовані на них, і які простягаються у протилежних боко-

вих напрямках один від одного, при цьому два орієнтовані вперед упорні елементи на верхній стінці хомута розміщені в основному копланарно з двома орієнтованими вперед упорними елементами на нижній стінці хомута; і

при цьому система поглинання енергії/зчеплення має нейтральну позицію, повну амортизаційну позицію, розташовану на першій заданій відстані від нейтральної позиції, та повну тягову позицію, розташовану на другій заданій відстані від нейтральної позиції, причому задній кінець амортизуючого комплексу розташовується навпроти задніх упорів на тяговій балці, коли система поглинання енергії/зчеплення перебуває у повній амортизаційній позиції, і при цьому упорні елементи на хомуті функціонально з'єднані з передніми упорами на балці, коли система поглинання енергії/зчеплення перебуває у повній тяговій позиції, і при цьому тяговий хід системи поглинання енергії/зчеплення незалежно контролюється відносно амортизаційного ходу системи поглинання енергії/зчеплення та регулюється як функція розміщення чотирьох упорних елементів на хомуті.

20. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 19, яка **відрізняється** тим, що тягове гніздо на тяговій балці має довжину приблизно 24,625 дюйма (0,625475 м) між протилежними поверхнями на передніх та задніх упорах.

21. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 19, яка **відрізняється** тим, що упорна плита зчеплення включає орієнтовану вперед поверхню, яка є зміщеною у контактну взаємодію з передніми упорами на тяговій балці амортизуючим комплектом, коли хомут перебуває у нейтральній позиції.

22. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 19, яка **відрізняється** тим, що перша задана відстань, на яку переміщується система, в цілому дорівнює або є більшою за другу задану відстань, на яку переміщується система.

23. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 22, яка **відрізняється** тим, що система має загальний комбінований хід як у амортизаційному, так і у тяговому напрямках, який становить приблизно 6,5 дюйма (0,1651 м).

24. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 19, яка **відрізняється** тим, що упорні елементи на хомуті запобігають можливому відокремленню зчеплення від тягової балки.

25. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 19, яка **відрізняється** тим, що упорні елементи є сформованими суцільно з верхньою та нижньою стінками на хомуті.

26. Система поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона за п. 19, яка **відрізняється** тим, що корпус зі стінками амортизуючого комплексу включає закритий кінець і відкритий кінець.

27. Хомут залізничного вагона, який включає: верхню стінку, яка з'єднана з задньою стінкою й виступає під неї в напрямку до переднього кінця хомута, нижню стінку, яка з'єднана з задньою стінкою й виступає від неї в осьовому напрямку до переднього кінця хомута, при цьому верхня та нижня стінки хомута відокремлені одна від одної на відстань, яка дозволяє розмістити між ними амортизуючий комплект; і

причому верхня та нижня стінки хомута, кожна мають два орієнтовані вперед упорні елементи, розташовані на них, для обмеження тягового ходу хомута при розташуванні у функціональній комбінації з системою поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона, де упорні елементи на верхній і нижній стінках хомута простягаються у протилежних бокових напрямках один від одного, при цьому два орієнтовані вперед упорні елементи на верхній стінці хомута розміщені в основному копланарно з двома орієнтованими вперед упорними елементами на нижній стінці хомута.

28. Хомут залізничного вагона за п. 27, який **відрізняється** тим, що упорні елементи є сформованими суцільно з верхньою та нижньою стінками на хомуті.

29. Хомут залізничного вагона за п. 27, який **відрізняється** тим, що упорні елементи є сформованими суцільно та в основному планарно відносно верхньої та нижньої стінок на хомуті.

30. Хомут залізничного вагона, який включає:

задню стінку, верхню стінку, сформовану суцільно з задньою стінкою й виступаючу від неї до переднього кінця хомута, та нижню стінку, сформовану суцільно з задньою стінкою й виступаючу від неї до переднього кінця хомута, при цьому верхня та нижня стінки хомута відокремлені одна від одної на відстань, яка дозволяє розмістити між ними амортизуючий комплект, і

при цьому верхня та нижня стінки хомута, кожна мають два орієнтовані вперед упорні елементи для обмеження тягового ходу хомута при розташуванні у функціональній комбінації з системою поглинання енергії/зчеплення залізничного вагона, де упорні елементи на верхній і нижній стінках хомута простягаються у протилежних бокових напрямках один від одного, причому два орієнтовані вперед упорні елементи на верхній стінці хомута розміщені в основному копланарно з двома орієнтованими вперед упорними елементами на нижній стінці хомута.

31. Хомут залізничного вагона за п. 30, який **відрізняється** тим, що упорні елементи є сформованими суцільно з верхньою та нижньою стінками на хомуті.

32. Хомут залізничного вагона за п. 31, який **відрізняється** тим, що упорні елементи є сформованими суцільно з та в основному планарно відносно верхньої та нижньої стінок на хомуті.

33. Хомут залізничного вагона за п. 30, який **відрізняється** тим, що упорні елементи на хомуті комбінуються для утворення чотирьох орієнтованих вперед упорних поверхонь.

34. Хомут залізничного вагона, який включає:

задню стінку, верхню стінку, яка з'єднана з задньою стінкою й аксіально виступає від неї до переднього кінця хомута, та нижню стінку, яка з'єднана з задньою стінкою й аксіально виступає від неї до переднього кінця хомута, при цьому задня стінка хомута розташована таким чином, що вона знаходиться в контакті із заднім кінцем корпусу амортизуючого комплексу, причому верхня та нижня стінки хомута відокремлені одна від одної таким чином, що верхня та нижня стінки хомута охоплюють корпус амортизуючого комплексу для ковзних переміщень між ними; і

при цьому верхня та нижня стінки хомута, кожна має два орієнтовані вперед упорні елементи, розташовані на них, де упорні елементи на верхній і нижній стінках хомута простягаються у протилежних бокових напрямках один від одного, причому два орієнтовані вперед упорні елементи на верхній стінці хомута розміщені в основному копланарно один з одним та з двома орієнтованими вперед упорними елементами на нижній стінці хомута.

35. Хомут залізничного вагона за п. 34, який **відрізняється** тим, що упорні елементи є сформованими суцільно з верхньою та нижньою стінками на хомуті.

36. Хомут залізничного вагона за п. 34, який **відрізняється** тим, що упорні елементи на хомуті розташовані в основному планарно відносно верхньої та нижньої стінок на хомуті.

37. Хомут залізничного вагона за п. 34, який **відрізняється** тим, що упорні елементи на хомуті комбінуються для утворення чотирьох орієнтованих вперед упорних поверхонь.

B 66

(11) 123777

(51) МПК

B66B 5/22 (2006.01)

B66B 5/04 (2006.01)

(21) а 2018 07424

(22) 02.07.2018

(24) 03.06.2021

(72) Шабайкович Віктор Антонович (UA), Григор'єва Наталія Сергіївна (UA), Гуменюк Лариса Олександрівна (UA), Добровольська Любов Наумівна (UA)

(73) ЛУЦЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ

вул. Львівська, 75, м. Луцьк, 43018 (UA)

(54) АВАРІЙНЕ ГАЛЬМО КАБІНИ ПАСАЖИРСЬКОГО ЛІФТА

(57) Аварійне гальмо kabіни пасажирського ліфта, що включає клиновий механізм розтиску, блок управління та датчики, яке **відрізняється** тим, що клиновий механізм розтиску розташований під дном kabіни та оснащений підпружиненими верхньою та нижньою підставками, а також парами встановлених один проти одного нерухомих і рухомих висувних клинів, причому нерухомі клини жорстко закріплені на дні kabіни ліфта, а рухомі висувні клини розміщені на верхній підпружиненій підставці та встановлені на горизонтальних напрямних нижньої підпружиненої підставки, при цьому всередині нерухомих клинів розміщені підпружинені проміжні висувні клини, з'єднані з електромагнітами, що управляються блоком управління від датчиків швидкості падіння kabіни, а нижня підпружинена підставка оснащена встановленим під нею на підпружинених штоках парусним листом та автопідгальмовувачами.

Розділ С:

Хімія. Металургія

С 04

- (11) **123768** (51) МПК
C04B 28/14 (2006.01)
C04B 38/10 (2006.01)
C04B 111/00 (2006.01)
- (21) а 2017 10750 (22) 18.05.2016
(24) 03.06.2021
(31) 15290137.7
(32) 26.05.2015
(33) EP
(31) 16156444.8
(32) 19.02.2016
(33) EP
(86) PCT/EP2016/061135, 18.05.2016
(72) Арезе Рожер (FR), Пейрон П'єр (FR)
(73) ЕТЕКС БІЛДІНГ ПЕРФОМАНС ІНТЕРНЕШНЛ САС
500, rue Marcel Demonque, Zone du Pôle Techno-
logique Agroparc, 84915 Avignon, France (FR)
(54) ГІПСОВІ ПАНЕЛІ
(57) 1. Гіпсова панель, яка містить:
- дигідрат сульфату кальцію;
- винну кислоту, в кількості, що знаходиться в діапазоні від 0,01 до 0,1 мас. %, у перерахунку на масу напівгідрату сульфату кальцію;
- розріджувач, на основі полінафталіну, в кількості від 1,0 до 10,0 кг/м³;
- крохмаль, у кількості від 3,0 до 12,0 кг/м³.
2. Гіпсова панель за п. 1, яка **відрізняється** тим, що гіпс являє собою синтетичний гіпс.
3. Гіпсова панель за будь-яким із попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що крохмаль являє собою розріджений крохмаль, окиснений крохмаль, гідролізований крохмаль, оксигідролізований крохмаль або їх комбінації.
4. Гіпсова панель за будь-яким із попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що крохмаль присутній у кількості, що знаходиться в діапазоні від 4 до 10 кг/м³.
5. Гіпсова панель за будь-яким із попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що винна кислота присутня в кількості, що знаходиться в діапазоні від 0,025 до 0,06 мас. %, у перерахунку на масу напівгідрату сульфату кальцію.
6. Гіпсова панель за будь-яким із попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що щільність гіпсу в панелі становить більше 0,45 кг/л, переважно знаходиться в діапазоні від 0,45 до 1 кг/л.
7. Гіпсова панель за будь-яким із попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що панель додатково містить піноутворювальну речовину.
8. Гіпсова панель за будь-яким із попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що панель додатково містить скловолокна.
9. Застосування гіпсової панелі за будь-яким із пп. 1-8 для монтажу стелі, при цьому вказану гіпсову панель прикріплюють до двох опорних елементів, при цьому вказані опорні елементи мають взаємну відстань від осі до осі щонайменше 700 мм.

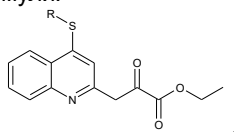
10. Застосування гіпсової панелі за п. 9, яке **відрізняється** тим, що вказані опорні елементи мають взаємну відстань від осі до осі щонайменше 750 мм.
11. Застосування гіпсової панелі за п. 9, яке **відрізняється** тим, що вказані опорні елементи мають взаємну відстань від осі до осі щонайменше 800 мм.

С 07

- (11) **123804** (51) МПК
C07C 279/02 (2006.01)
A61L 2/16 (2006.01)
- (21) а 2019 05144 (22) 15.05.2019
(24) 03.06.2021
(72) Вортман Марина Яківна (UA), Чуєнко Андрій Ігоревич (UA), Письменна Юлія Борисівна (UA), Руденко Ада Вікторівна (UA), Третяк Віра Володимирівна (UA), Коптева Жанна Прокопівна (UA), Коптева Ганна Євгенівна (UA), Лемешко Валентина Миколаївна (UA), Шевченко Валерій Васильович (UA)
(73) ІНСТИТУТ ХІМІЇ ВИСОКОМОЛЕКУЛЯРНИХ СПОЛУК НАЦІОНАЛЬНОЇ АКАДЕМІЇ НАУК УКРАЇНИ
Харківське шосе, 48, м. Київ, 02160 (UA)
ІНСТИТУТ МІКРОБІОЛОГІЇ ТА ВІРУСОЛОГІЇ ІМ. Д.К. ЗАБОЛТНОГО НАЦІОНАЛЬНОЇ АКАДЕМІЇ НАУК УКРАЇНИ
вул. Академіка Заболотного, 154, м. Київ, 03680 (UA)
ДЕРЖАВНА УСТАНОВА "ІНСТИТУТ УРОЛОГІЇ НАЦІОНАЛЬНОЇ АКАДЕМІЇ МЕДИЧНИХ НАУК УКРАЇНИ"
вул. Володимира Винниченка, 9-а, м. Київ, 04053 (UA)
(54) АЛКІЛЗАМІЩЕНИЙ ГУАНІДИНВІСНИЙ ОЛІГОМЕР З ФУНГІЦИДНОЮ ТА БАКТЕРИЦИДНОЮ АКТИВНІСТЮ
(57) Алкілзаміщений гуанідинвісний олігомер формули:
- $$\text{Alk} - \text{HN} - \text{C} - \text{NH} - \text{CH}_2\text{CH} - \text{R} - \text{CH} - \text{CH}_2\text{NH} - \text{C} - \text{NH} - \text{Alk} \cdot$$
- $$\text{Br}^- \quad \text{NH}_2^+ \quad \text{OH} \quad \text{OH} \quad \text{NH}_2^+ \quad \text{Br}^-$$
- де R = OCH₂CH₂OCH₂CH₂O, Alk = C₇H₁₅, C₁₀H₂₁,
з фунгіцидною та бактерицидною активністю для дезінфекції та стерилізації матеріалів.

- (11) **123814** (51) МПК
C07D 215/20 (2006.01)
C07D 215/22 (2006.01)
C07D 215/36 (2006.01)

- (21) а 2019 11580 (22) 02.12.2019
(24) 03.06.2021
(72) Бражко Олександр Анатолійович (UA), Головатюк Володимир Миколайович (UA), Амінова Аліна Сергіївна (UA)
(73) ЗАПОРІЗЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ
вул. Жуковського, 66, м. Запоріжжя, 69600 (UA)

(54) ЕТИЛ-3-[4-(АЛКІЛСУЛЬФАНІЛ)ХІНОЛІН-2-ІЛ]-2-ОКСОПРОПАНОАТИ ТА СПОСІБ ЇХ ОТРИМАННЯ**(57)** 1. Етил-3-[4-(алкілсульфаніл)хінолін-2-іл]-2-оксопропаноати формули:

де

R=CH₃; C₂H₅; C₃H₇; C₄H₉; C₅H₁₁; C₆H₁₃.

2. Спосіб отримання етил-3-[4-(алкілсульфаніл)хінолін-2-іл]-2-оксопропаноатів, який включає змішування похідного хіноліну з діетилоксалатом за температури навколишнього середовища, перемішування реакційної суміші, переосадження, кристалізацію та фільтрування осаду, висушування його на повітрі, який **відрізняється** тим, що попередньо готують суспензію трет-бутилату калію в абсолютному тетрагідрофурані (ТГФ), у середовищі аргону, додають до отриманої суспензії діетилоксалат, а як похідне хіноліну використовують алкілтіохінальдин, який розчиняють в абсолютному тетрагідрофурані, додають отриманий розчин алкілтіохінальдину до суспензії з діетилоксалатом; випарюють розчинник при зниженому тиску.

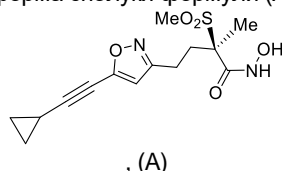
(11) 123790

(51) МПК
C07D 261/08 (2006.01)
A61K 31/42 (2006.01)
A61P 31/04 (2006.01)

(21) а 2018 11400**(22) 12.06.2017****(24) 03.06.2021****(31) РСТ/CN2016/085694****(32) 14.06.2016****(33) CN****(86) РСТ/IB2017/053468, 12.06.2017****(72)** Фу Цзіпін (US), Цзян Сіі (CN), Кордіковскі Андреас (CH), Свіні Закарі Кевін (US)**(73) НОВАРТИС АГ**

Lichtstrasse 35, 4056 Basel, Switzerland (CH)

(54) КРИСТАЛІЧНА ФОРМА (R)-4-(5-(ЦИКЛОПРОПІЛ-ТИНІЛ)ІЗОКСАЗОЛ-3-ІЛ)-N-ГІДРОКСИ-2-МЕТІЛ-2-(МЕТІЛСУЛЬФОНІЛ)БУТАНАМІДУ ЯК АНТИБАКТЕРІАЛЬНОГО АГЕНТА

(57) 1. Кристалічна форма сполуки формули (A):

яка характеризується піками XRPD при кутах дифракції (2Тета): 18,4 градуса, 14,0 градусів, 3,9 градуса, 2,5 градуса, 4,4 градуса, 18,8 градуса, 5,3 градуса, 21,8 градуса, 22,1 градуса та 18,0 градусів.

2. Кристалічна форма за п. 1, яка має низьку гігроскопічність, що демонструє збільшення ваги менше ніж на 5 %, коли сухий зразок піддається впливу відносної вологості до 80 %.

3. Кристалічна форма за п. 1, яка включає стрижнеподібні кристали.

4. Кристалічна форма за п. 1, яка демонструє ендотерму на диференційній скануючій калориметрії між 75 та 90 °C.

5. Фармацевтична композиція, яка включає: антибактеріально ефективну кількість кристалічної форми за будь-яким з пп. 1-4, та фармацевтично прийнятний носій.

6. Фармацевтична комбінація, яка включає: антибактеріально ефективну кількість кристалічної форми за будь-яким з пп. 1-4, антибактеріально ефективну кількість другого терапевтичного агента, та фармацевтично прийнятний носій.

7. Фармацевтична комбінація за п. 6, у якій другий терапевтичний агент вибирають з групи, яка складається з таких як: Ампіцилін, Піперацилін, Пеніцилін G, Тикарцилін, Іміпенем, Меропенем, Азитроміцин, Еритроміцин, Азтреонам, Цефепім, Цефотаксим, Цефтріаксон, Цефтазидим, Ципрофлоксацин, Левофлоксацин, Кліндаміцин, Доксациклін, Гентаміцин, Амікацин, Тобраміцин, Тетрациклін, Тиגעциклін, Рифампіцин, Ванкомицин та Поліміксин.

8. Спосіб одержання кристалічної сполуки (A) за п. 1 з некристалічної сполуки (A), де згаданий спосіб включає стадії:

(а) розчинення згаданої некристалічної сполуки (A) у галогенованому органічному розчиннику дихлорметані при 25 °C з утворенням розчину, та

(б) повільне додавання вуглеводневого розчиннику гептану до утвореного розчину впродовж періоду часу в 5 годин при 55 °C для спричинення осадження згаданої кристалічної сполуки (A).

9. Кристалічна форма за будь-яким з пп. 1-4 для застосування у лікуванні суб'єкта з грамнегативною бактеріальною інфекцією.

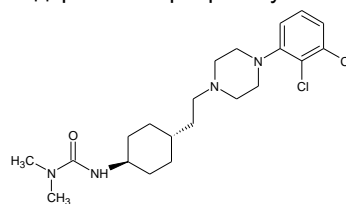
(11) 123797

(51) МПК
C07D 295/06 (2006.01)
C07C 275/26 (2006.01)

(21) а 2019 01278**(22) 07.07.2017****(24) 03.06.2021****(31) P1600420****(32) 08.07.2016****(33) HU****(31) P1700197****(32) 09.05.2017****(33) HU****(86) РСТ/IB2017/054094, 07.07.2017****(72)** Ней Йожеф (HU), Гараднаї Шандор (HU), Сабо Тамаш (HU)**(73) РІХТЕР ГЕДЕОН НІРТ.**

Gyömrői út 19-21, H-1103 Budapest, Hungary (HU)

(54) ПРОМИСЛОВИЙ СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ КАРИПАЗИНУ

(57) 1. Спосіб одержання карипразину

(1)

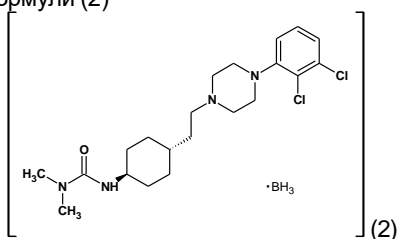
у якому

а) гідрохлорид складного етилового ефіру транс-(4-аміноциклогексил)оцтової кислоти перетворюють у транс-(4-аміноциклогексил)оцтову кислоту або її гідрохлорид за допомогою гідролізу;

б) з одержаного продукту з додаванням похідної диметилкарбамоїлу, вибраного з галіду, імідозалілу, ангідриду або активного складного ефіру, як додатного реагенту у присутності лужного реагенту одержують транс-(4-[[диметиламіно]карбоніл]аміно)циклогексил)оцтову кислоту,

с) потім одержану сполуку приєднують до 1-(2,3-дихлорфеніл)піперазину у присутності реагенту, що активує конденсацію карбонової кислоти, і таким чином одержують 1,1-диметил-3-[транс-4-(2-оксо-2-(4-(2,3-дихлорфеніл)піперазин-1-іл-етил)циклогексил)сечовину,

д) яку перетворюють у борановий аддукт карипразину формули (2)



у присутності борогідридної сполуки, борану або комплексу борану як відновника,

е) і кінцевий продукт витягують безпосередньо або одержують з його солі.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що гідроліз гідрохлориду складного етилового ефіру транс-(4-аміноциклогексил)оцтової кислоти здійснюють за допомогою лужного або кислотного гідролізу.

3. Спосіб за п. 1 або п. 2, який **відрізняється** тим, що транс-(4-[[диметиламіно]карбоніл]аміно)циклогексил)оцтову кислоту одержують з використанням диметилкарбамоїлхлориду як реагенту.

4. Спосіб за будь-яким з пп. 1-3, який **відрізняється** тим, що реагент, що активує конденсацію карбонової кислоти, для конденсації з 1-(2,3-дихлорфеніл)піперазином є дегідратуючим агентом.

5. Спосіб за будь-яким з пп. 1-3, який **відрізняється** тим, що для реакції конденсації з 1-(2,3-дихлорфеніл)піперазином використовують карбонілдіімідазол або тіонілхлорид.

6. Спосіб за будь-яким з пп. 1-5, який **відрізняється** тим, що відновник утворюють *in situ* з відповідного попередника.

7. Спосіб за будь-яким з пп. 1-6, який **відрізняється** тим, що як відновник використовують борогідриди або борани, або їх комплекси, що містять відповідний протиіон.

8. Спосіб за п. 7, який **відрізняється** тим, що боранові комплекси являють собою комплексні сполуки боранів, утворені з основами Льюїса, такі як комплексні сполуки, утворені з простими ефірами, тіоефірами, амінами, переважно - комплексна сполука, утворена з тетрагідрофураном.

9. Спосіб за п. 7, який **відрізняється** тим, що додатним протиіоном для борогідридів є позитивні іони металевих елементів, таких як лужні метали, лужноземельні метали, рідкісноземельні метали, переважно - іони алюмінію.

10. Спосіб за будь-яким з пп. 1-9, який **відрізняється** тим, що після виділення боранового аддукту карипразину одержують солі карипразину за допомогою розкладання кислотами Бренстеда в стандартних розчинниках.

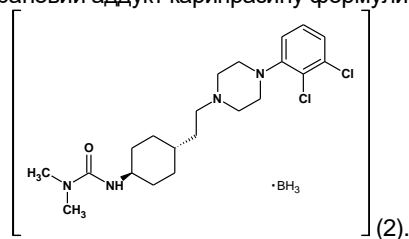
11. Спосіб за п. 10, який **відрізняється** тим, що після виділення боранового аддукту карипразину проводять розкладання кислотами Бренстеда, яка використовується для розкладання в стандартних розчинниках і є хлористим воднем.

12. Спосіб за будь-яким з пп. 1-11, який **відрізняється** тим, що одержані гідрохлоридні солі карипразину перетворюють на основний кінцевий продукт.

13. Спосіб за будь-яким з пп. 1-9, який **відрізняється** тим, що з виділеного боранового аддукту карипразину в стандартних розчинниках за допомогою термічного розкладання одержують основний кінцевий продукт карипразин.

14. 1,1-Диметил-3-[транс-4-(2-оксо-2-(4-(2,3-дихлорфеніл)піперазин-1-іл-етил)циклогексил)сечовина.

15. Борановий аддукт карипразину формули (2)



(11) 123786

(51) МПК (2021.01)

C07D 401/04 (2006.01)

C07D 487/10 (2006.01)

A61K 31/4745 (2006.01)

A61P 35/00

(21) а 2018 10884

(22) 06.04.2017

(24) 03.06.2021

(31) 62/318,974

(32) 06.04.2016

(33) US

(31) 62/393,874

(32) 13.09.2016

(33) US

(31) 62/409,571

(32) 18.10.2016

(33) US

(86) PCT/US2017/026274, 06.04.2017

(72) Ван Шаомен (US), Лі Янбін (US), Ян Цзюлін (US), Агілар Анхело (US), Чжоу Бін (CN), Ху Цзяньтао (US), Сюй Фумін (US), Редж Рохан (US), Хань Сін (US)

(73) ДЗЕ РІДЖЕНТС ОФ ДЗЕ ЮНІВЕРСІТІ ОФ МІЧІГАН Office of Technology Transfer, 1600 Huron Parkway, 2nd Floor, Ann Arbor, Michigan 48109-2590, United States of America (US)

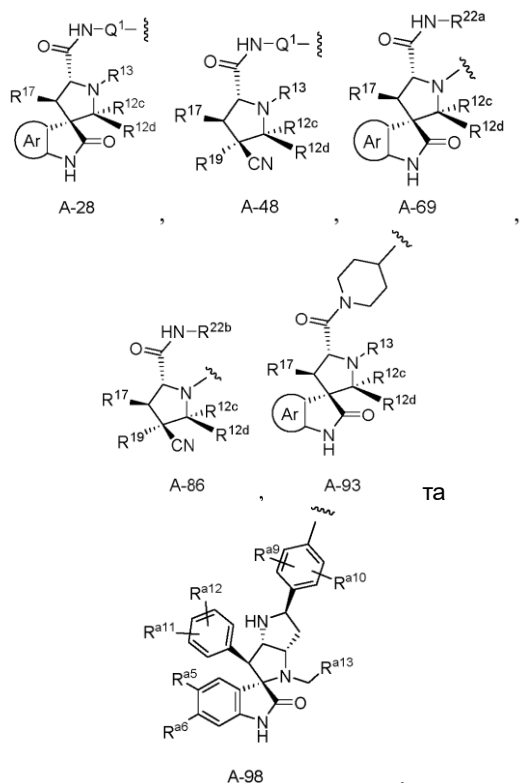
(54) ДЕСТРУКТОРИ БІЛКА MDM2

(57) 1. Сполука, що має формулу I-A:

A¹-L¹-B¹, I-A

або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват, де:

A¹ вибраний із групи, що складається з:



де:

R^{12c} і R^{12d} незалежно вибрані з групи, що складається з водню і необов'язково заміщеного C_{1-8} алкілу; або

R^{12c} і R^{12d} , взяті разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 4-8-членний необов'язково заміщений циклоалкіл або 4-8-членний необов'язково заміщений гетероцикло;

R^{13} вибраний з групи, що складається з водню, необов'язково заміщеного C_{1-6} алкілу і гетероалкілу;

R^{17} вибраний з групи, що складається з необов'язково заміщеного арилу і необов'язково заміщеного гетероарилу;

R^{19} вибраний з групи, що складається з необов'язково заміщеного арилу і необов'язково заміщеного гетероарилу;

R^{22a} вибраний з групи, що складається з необов'язково заміщеного циклоалкілу, необов'язково заміщеного гетероцикло, необов'язково заміщеного арилу і необов'язково заміщеного гетероарилу;

R^{22b} вибраний з групи, що складається з необов'язково заміщеного циклоалкілу, необов'язково заміщеного гетероцикло, необов'язково заміщеного арилу і необов'язково заміщеного гетероарилу;

Q^1 вибраний з групи, що складається з алкіленілу, феніленілу, гетероариліленілу, циклоалкіленілу і гетероцикліленілу;

Ar являє собою конденсований необов'язково заміщений феніл, конденсований необов'язково заміщений тієніл, конденсований необов'язково заміщений піридил або конденсовану необов'язково заміщену піримідильну групу;

R^{a5} , R^{a6} , R^{a11} і R^{a12} , кожний незалежно, вибрані із групи, що складається з водню і галогену;

R^{a9} і R^{a10} незалежно вибрані із групи, що складається з водню, галогену, C_{1-4} алкілу, галогеналкілу, алкокси і галогеналкокси;

R^{a13} вибраний із групи, що складається з водню, C_{1-4} алкілу і C_{3-8} циклоалкілу;

L^1 являє собою $-X^1-L^2-Y^1-$;

X^1 являє собою X^2 , або

X^1 відсутній;

X^2 вибраний із групи, що складається з $-N(H)C(=O)-$, $C(=O)N(H)-$, $-C(=O)N(H)S(O)_2-$, $-N(H)C(=O)N(H)-$, $-N(H)C(=O)O-$, $-OC(=O)N(H)-$, $-SO_2-$, $-O-$, $-N(H)-$, $-SO_2N(H)-$, $-N(H)SO_2-$, $-CH_2-$, $-CH=CH-$ і $-C\equiv C-$;

L^2 вибраний із групи, що складається з алкіленілу, гетероалкіленілу, $-A^4-(CH_2)_m-W-(CH_2)_n-$ і $-(CH_2)_m-W-(CH_2)_n-O-(CH_2)_v-$; або

L^2 відсутній;

A^4 вибраний із групи, що складається з 5-членного гетероариліленілу і 6-членного гетероариліленілу; або A^4 відсутній;

W вибраний із групи, що складається з феніленілу, 5-членного гетероариліленілу, 6-членного гетероариліленілу, гетероцикліленілу і циклоалкіленілу;

m має значення 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6 або 7;

n має значення 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 або 8;

u має значення 0, 1, 2 або 3;

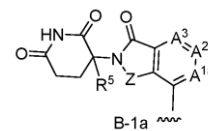
v має значення 1, 2, 3 або 4;

Y^1 вибраний із групи, що складається з $-C\equiv C-$, $-CH=CH-$, $-CH_2-$, $-O-$, $-N(R^{2b})-$, $-C(=O)N(R^{2c})-$, $-N(R^{2d})C(=O)CH_2O-$ і $N(R^{2e})C(=O)CH_2N(R^{2f})-$; або Y^1 відсутній;

де атом азоту карбоксаміду в $-N(R^{2d})C(=O)CH_2O-$ і $-N(R^{2e})C(=O)CH_2N(R^{2f})-$ і атом вуглецю в $-C(=O)N(R^{2c})-$ приєднаний до L^2 ;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} , R^{2d} , R^{2e} і R^{2f} , кожний незалежно, вибрані із групи, що складається з водню і C_{1-4} алкілу;

B^1 вибраний із групи, що складається з:



A^{1a} вибраний із групи, що складається з $-C(R^{16a})=$ і $-N=$;

A^2 вибраний із групи, що складається з $-C(R^{16b})=$ і $-N=$;

A^3 вибраний із групи, що складається з $-C(R^{16c})=$ і $-N=$;

G вибраний із групи, що складається з $-C(R^{16d})=$ і $-N=$;

Z вибраний із групи, що складається з $-CH_2-$ і $-C(=O)-$;

R^5 вибраний із групи, що складається з водню, метилу і фтору;

R^{16a} вибраний із групи, що складається з водню, галогену і C_{1-4} алкілу;

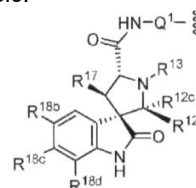
R^{16b} вибраний із групи, що складається з водню, галогену і C_{1-4} алкілу;

R^{16c} вибраний із групи, що складається з водню, галогену і C_{1-4} алкілу; і

R^{16d} вибраний із групи, що складається з водню, галогену і C_{1-4} алкілу.

2. Сполука за п. 1 або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват, де:

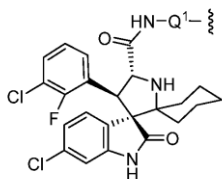
A^1 являє собою:



A-35.

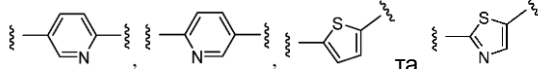
3. Сполука за п. 2 або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват, де:

A^1 являє собою:



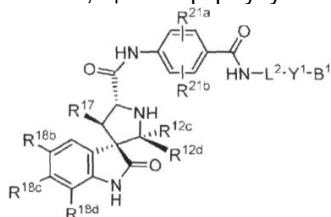
A-100.

4. Сполука за п. 3 або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват, де Q¹ являє собою циклоалкіленіл, вибраний із групи, що складається з:



та

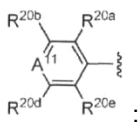
5. Сполука за п. 2 або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват, що має формулу VII:



, VII

де:

R¹²ᶜ і R¹²ᵈ, узяті разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 4-членний циклоалкіл або 6-членний неонов'язково заміщений циклоалкіл; R¹⁷ являє собою:



A¹¹ являє собою -C(R²⁰ᶜ)=; R²⁰ᵃ, R²⁰ᵇ і R²⁰ᶜ, кожний, являють собою водень; R²⁰ᵈ і R²⁰ᵉ незалежно вибрані із групи, що складається з водню і галогену; R¹⁸ᵇ, R¹⁸ᶜ і R¹⁸ᵈ, кожний незалежно, вибрані із групи, що складається з водню і галогену; і R²¹ᵃ і R²¹ᵇ, кожний незалежно, вибрані із групи, що складається з водню, галогену, C₁-алкілу, галогеналкілу, алкокси і галогеналкокси.

6. Сполука за п. 2 або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват, де L² являє собою C₁-12 алкіленіл.

7. Сполука за п. 2 або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват, де L² являє собою 3-12-членний гетероалкіленіл.

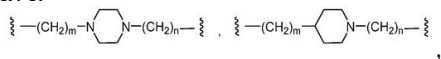
8. Сполука за п. 2 або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват, де:

L² являє собою -A⁴-(CH₂)ₘ-W-(CH₂)ₙ-; і

A⁴ відсутній.

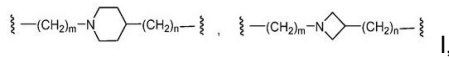
9. Сполука за п. 8 або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват, де W являє собою гетероцикленіл.

10. Сполука за п. 9 або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват, де L² вибраний з групи, що складається з:



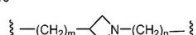
L²-14

L²-15



L²-16

L²-17

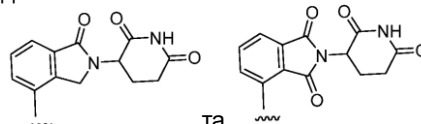


L²-18

11. Сполука за п. 10 або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват, де m має значення 0, і n має значення 0 або 1.

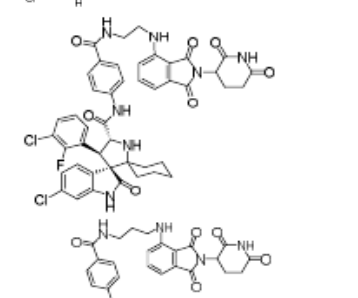
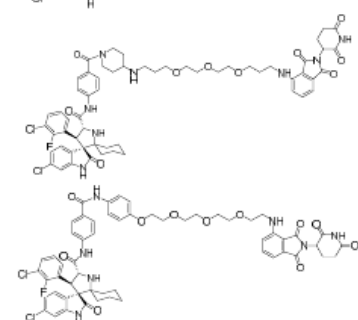
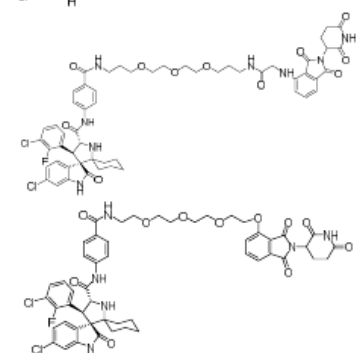
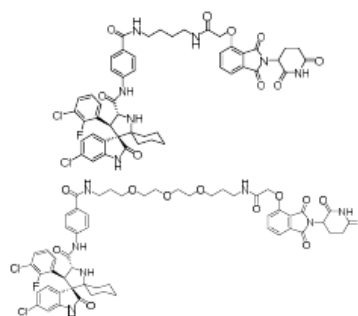
12. Сполука за п. 11 або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват, де Y¹ являє собою -C≡C-.

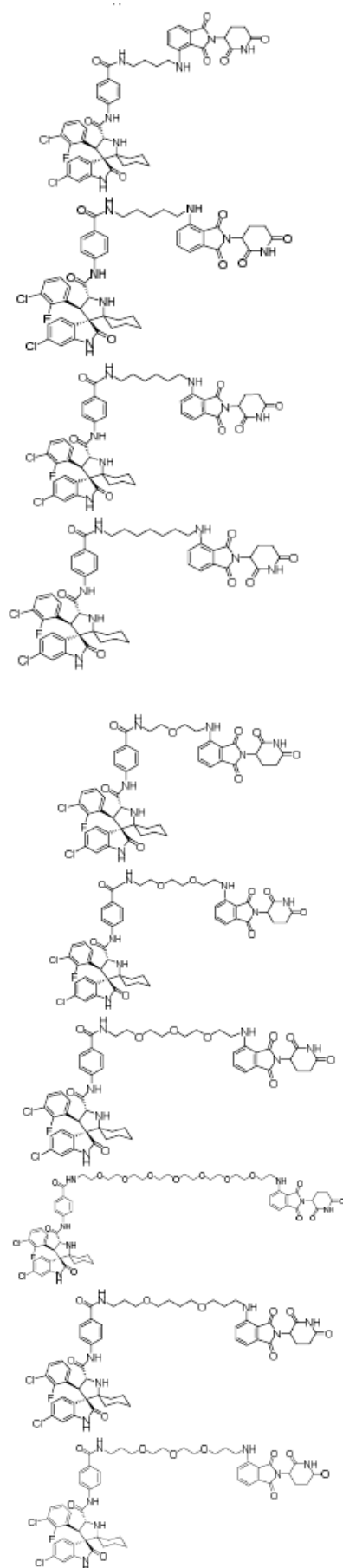
13. Сполука за п. 2 або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват, де B¹ вибраний з групи, що складається з:



та

14. Сполука за п. 1 або її фармацевтично прийнятна сіль або сольват, вибрана з групи, що складається з:





1

2

3

4

5

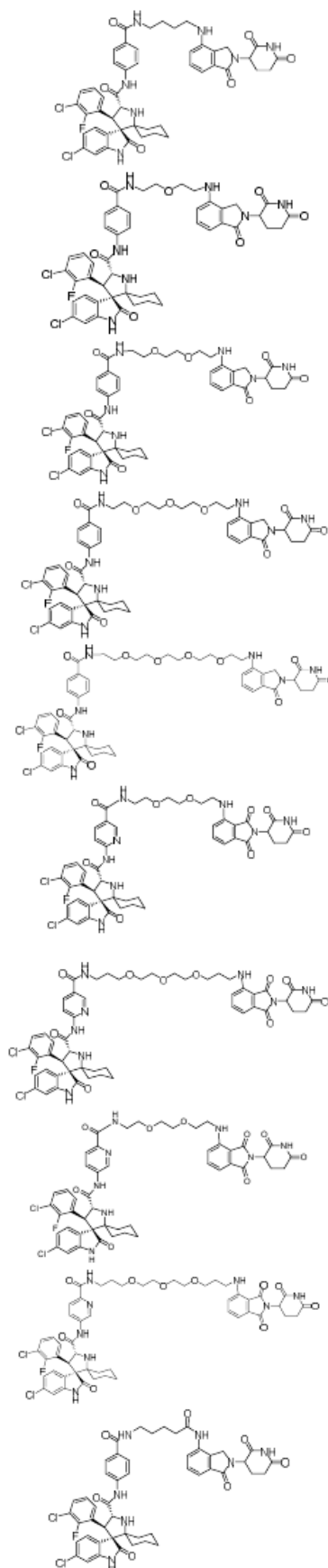
6

7

8

9

10



1

2

3

4

5

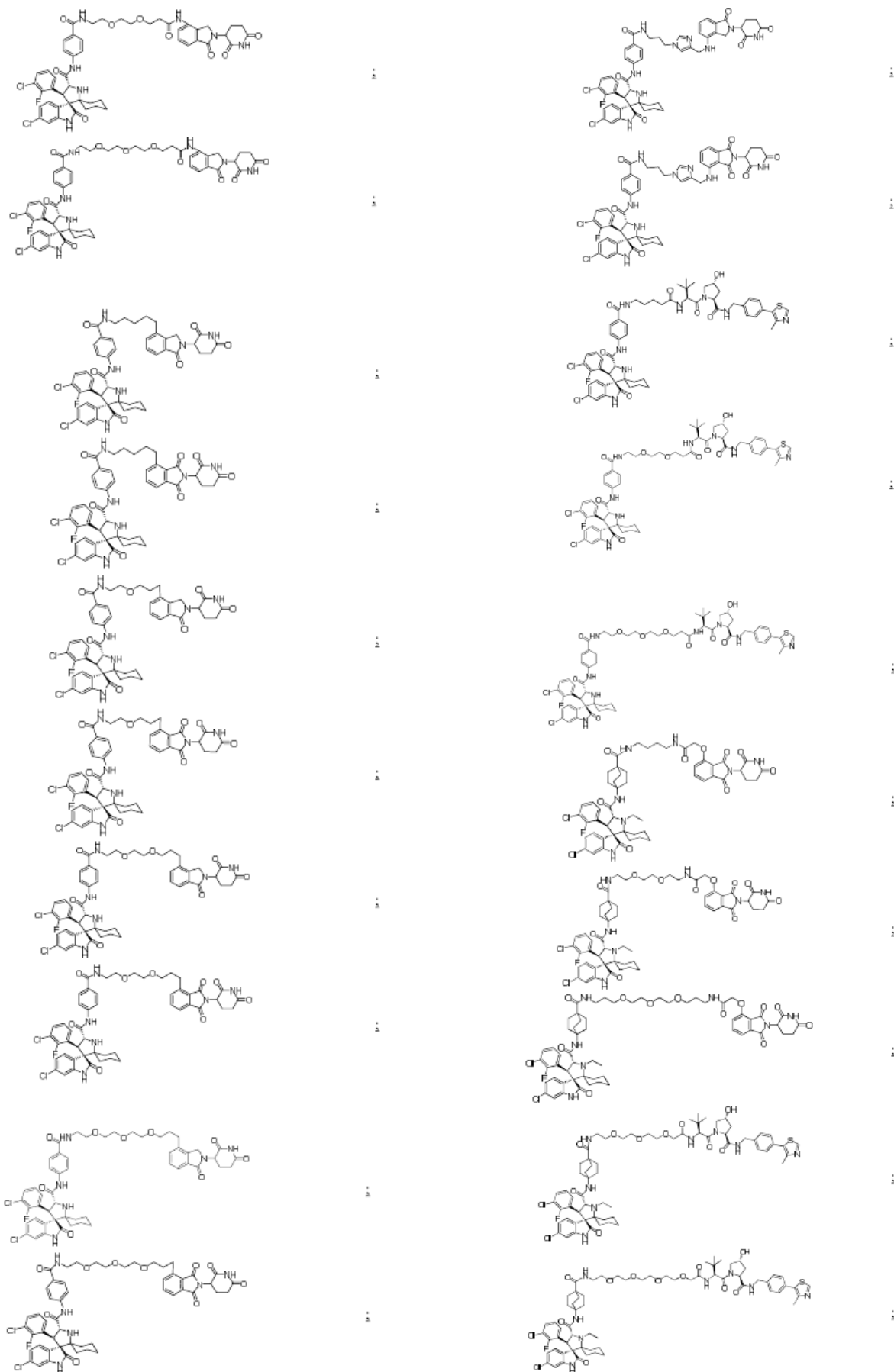
6

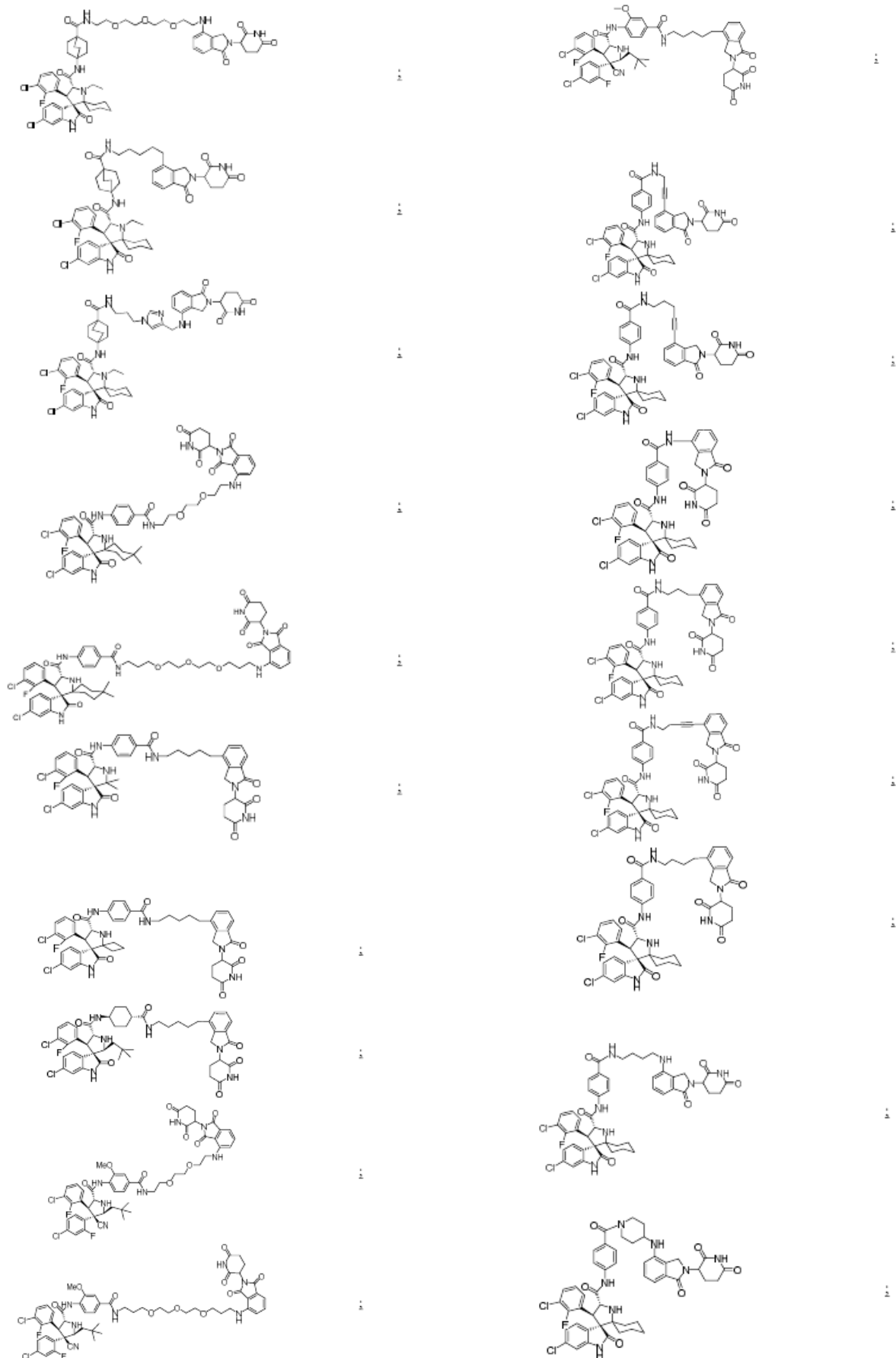
7

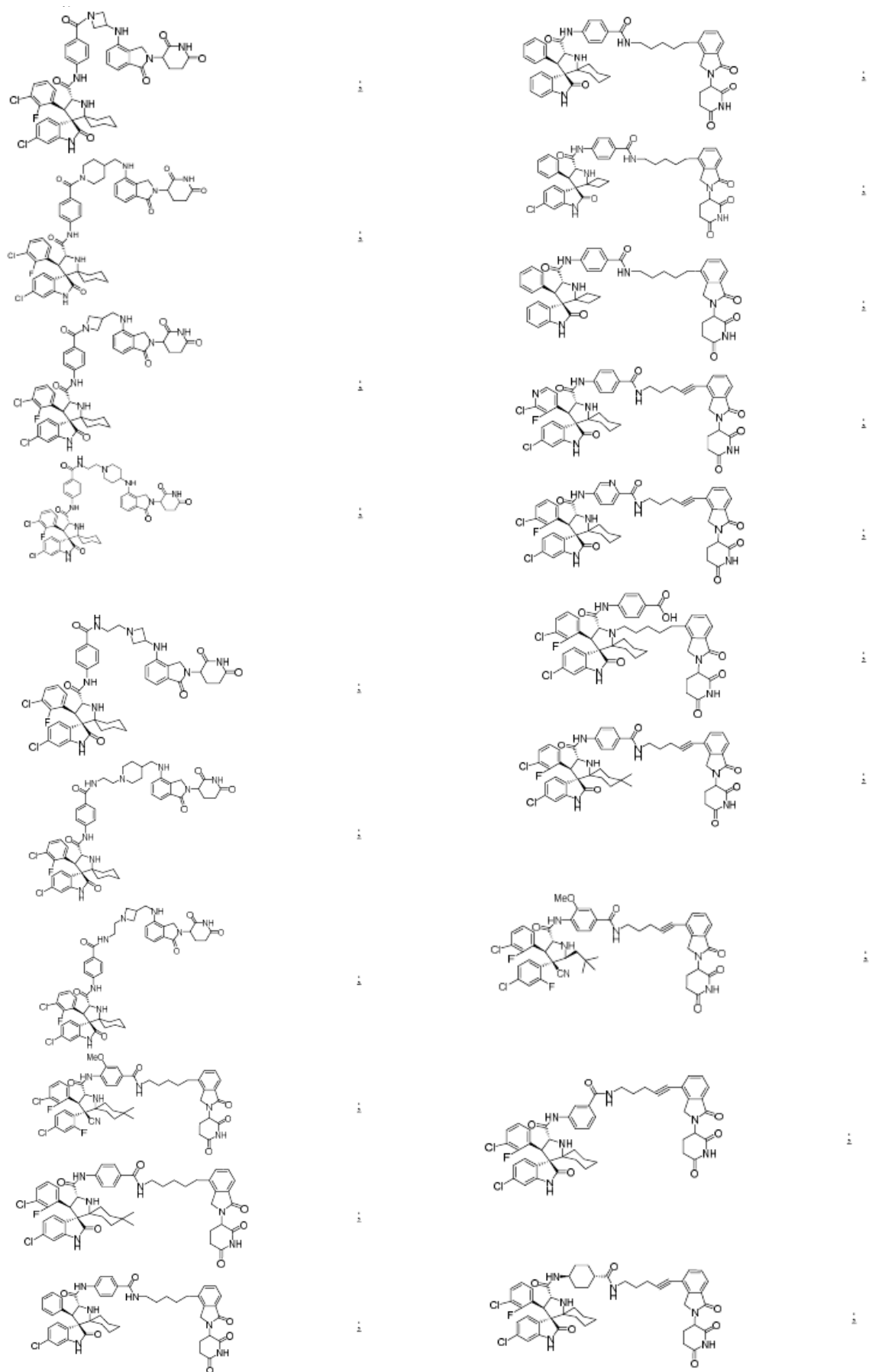
8

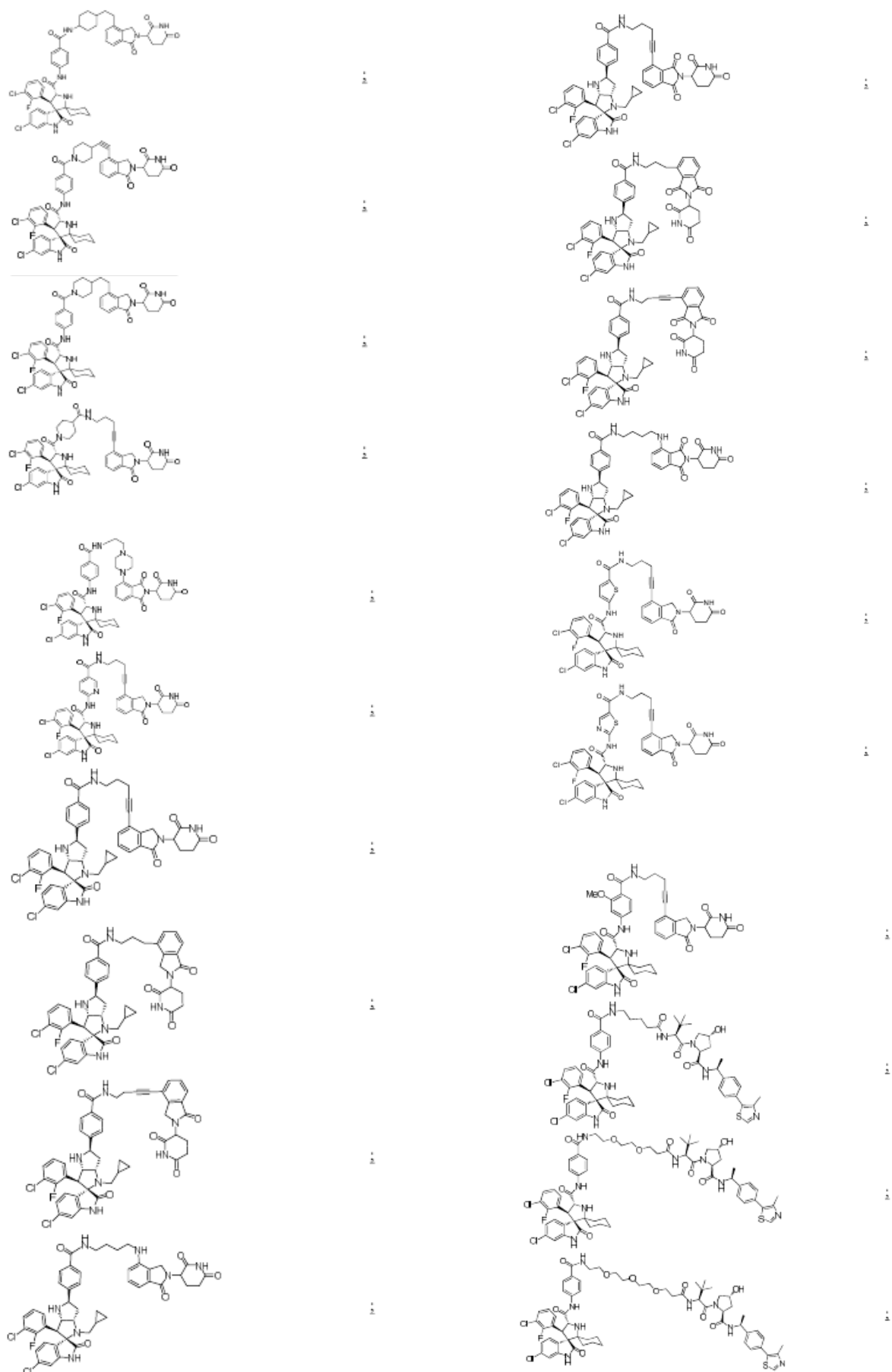
9

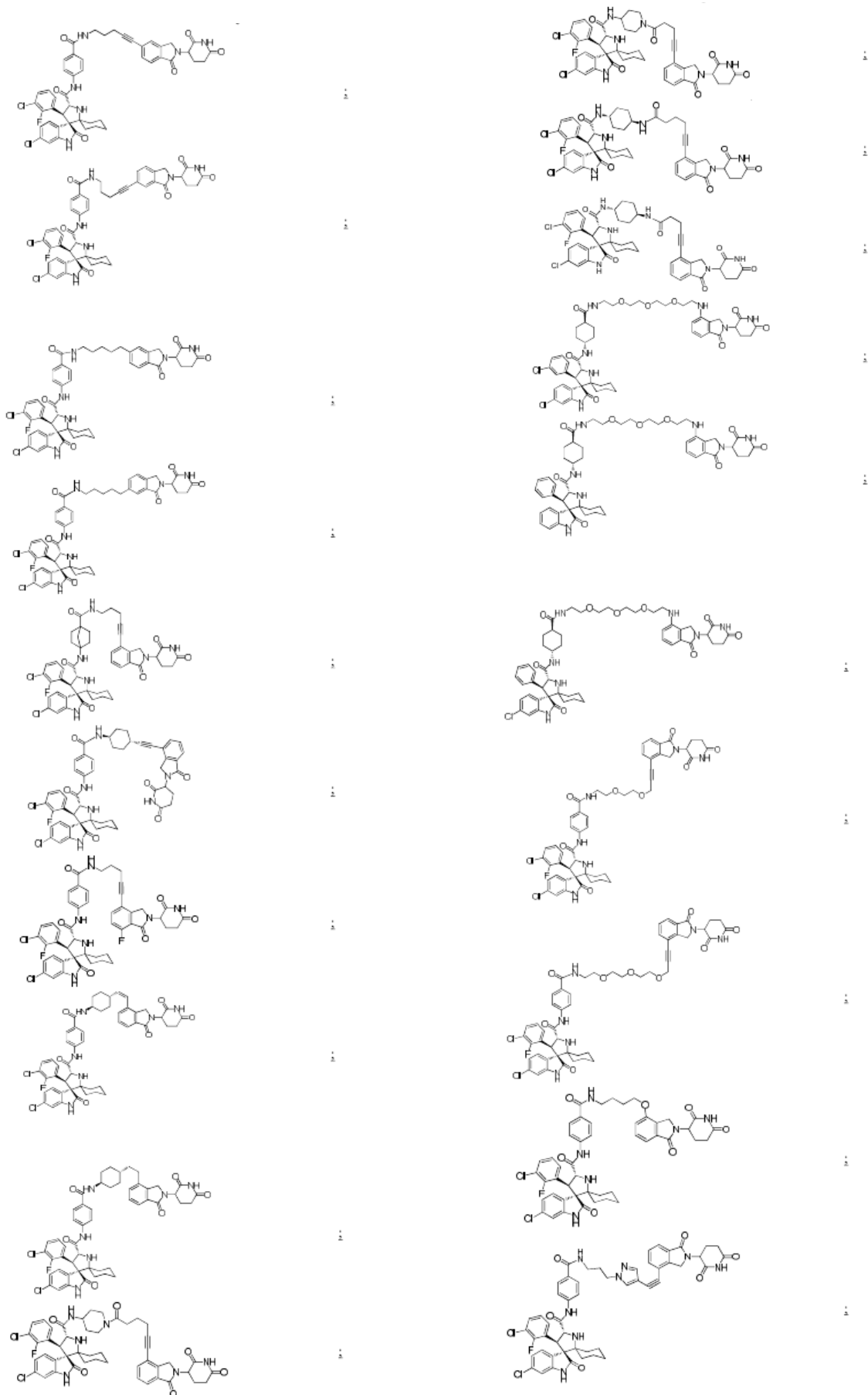
10

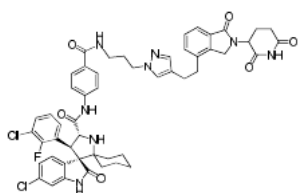




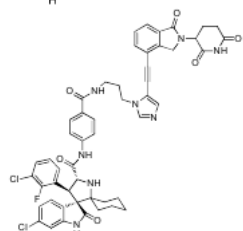




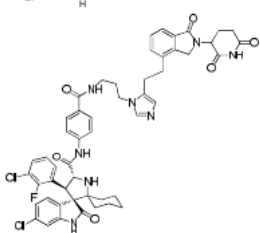




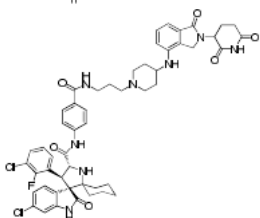
1a



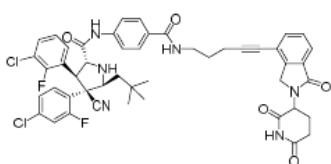
1b



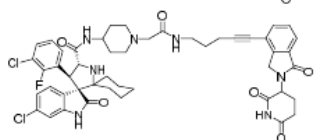
1c



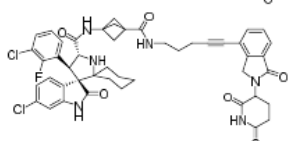
1d



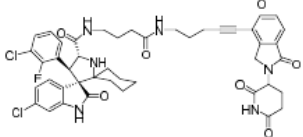
1e



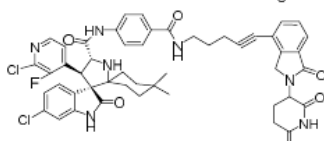
1f



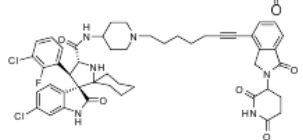
1g



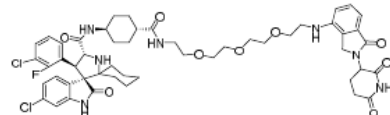
1h



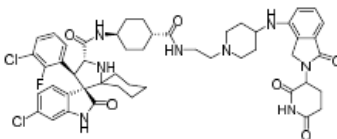
1i



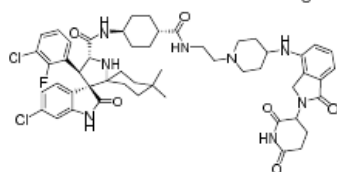
1j



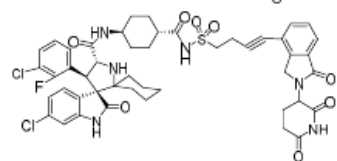
2a



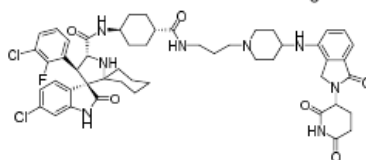
2b



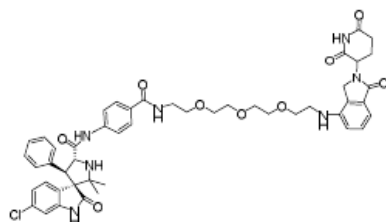
2c



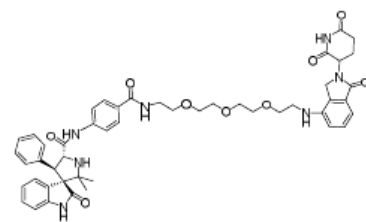
2d



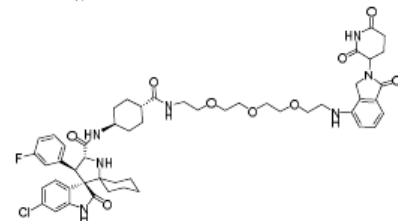
2e



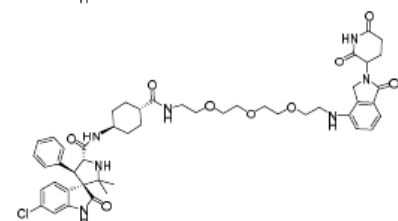
2f



2g

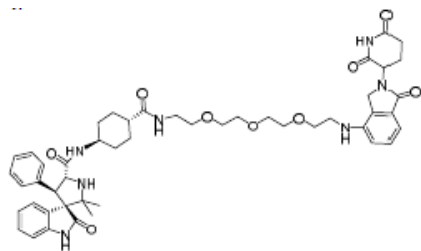


2h

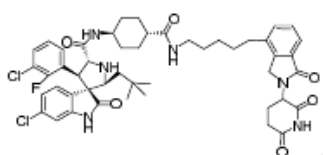
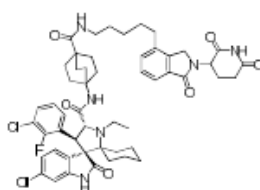
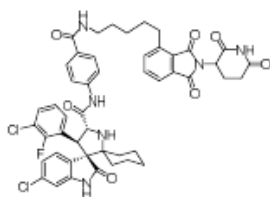
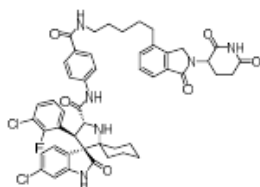
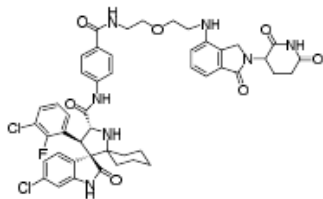


2i

та



15. Сполука за п. 1 або її фармацевтично прийнята сіль або сольват, вибрана з групи, що складається з:



(3'R,4'S,5'R)-6"-хлор-4'-(3-хлор-2-фторфеніл)-N-(4-((5-(2-(2,6-діоксопіперидин-3-іл)-1-оксоізоіндолін-4-іл)пент-4-ин-1-іл)карбамоїл)феніл)-2"-оксодиспіро[циклогексан-1,2'-піролідин-3',3"-індолін]-5'-карбоксаміду, (3'R,4'S,5'R)-6"-хлор-4'-(3-хлор-2-фторфеніл)-N-((1R,4R)-4-((5-(2-(2,6-діоксопіперидин-3-іл)-1-оксоізоіндолін-4-іл)пент-4-ин-1-іл)карбамоїл)циклогексил)-2"-оксодиспіро[циклогексан-1,2'-піролідин-3',3"-індолін]-5'-карбоксаміду, (3'R,4'S,5'R)-6"-хлор-4'-(3-хлор-2-фторфеніл)-N-(4-((2-(2,6-діоксопіперидин-3-іл)-1-оксоізоіндолін-4-іл)етипіперидин-1-карбоніл)феніл)-2"-оксодиспіро[циклогексан-1,2'-піролідин-3',3"-індолін]-5'-карбоксаміду,

(3'R,4'S,5'R)-6"-хлор-4'-(3-хлор-2-фторфеніл)-N-(4-((5-(2-(2,6-діоксопіперидин-3-іл)-1-оксоізоіндолін-5-іл)пент-4-ин-1-іл)карбамоїл)феніл)-2"-оксодиспіро[циклогексан-1,2'-піролідин-3',3"-індолін]-5'-карбоксаміду, (3'R,4'S,5'R)-6"-хлор-4'-(3-хлор-2-фторфеніл)-N-(4-((5-(2-(2,6-діоксопіперидин-3-іл)-3-оксоізоіндолін-5-іл)пент-4-ин-1-іл)карбамоїл)феніл)-2"-оксодиспіро[циклогексан-1,2'-піролідин-3',3"-індолін]-5'-карбоксаміду, (3'R,4'S,5'R)-6"-хлор-4'-(3-хлор-2-фторфеніл)-N-(3-((5-(2-(2,6-діоксопіперидин-3-іл)-1-оксоізоіндолін-4-іл)пент-4-ин-1-іл)карбамоїл)біцикло[1.1.1]пентан-1-іл)-2"-оксодиспіро[циклогексан-1,2'-піролідин-3',3"-індолін]-5'-карбоксаміду і

(3'R,4'S,5'R)-6"-хлор-4'-(2-хлор-3-фторпіридин-4-іл)-N-(4-((5-(2-(2,6-діоксопіперидин-3-іл)-1-оксоізоіндолін-4-іл)пент-4-ин-1-іл)карбамоїл)феніл)-4,4-диметил-2"-оксодиспіро[циклогексан-1,2'-піролідин-3',3"-індолін]-5'-карбоксаміду.

16. Фармацевтична композиція для лікування раку, хронічного аутоімунного захворювання, запального стану, проліферативного порушення, сепсису або вірусної інфекції, що містить ефективну кількість сполуки за будь-яким з попередніх пунктів або її фармацевтично прийнятну сіль або сольват і фармацевтично прийнятний носій.

17. Сполука за будь-яким з пп. 1-15 або її фармацевтично прийнята сіль або сольват для застосування при лікуванні раку, хронічного аутоімунного захворювання, запального стану, проліферативного порушення, сепсису або вірусної інфекції.

18. Сполука або її фармацевтично прийнята сіль або сольват для застосування за п. 17 для лікування раку.

(11) 123813

(51) МПК (2021.01)
C07D 401/12 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)
A61P 9/00
A61P 17/00
A61P 29/00
A61P 35/00

(21) а 2019 09772

(22) 25.11.2015

(24) 03.06.2021

(31) 14195032.9

(32) 26.11.2014

(33) EP

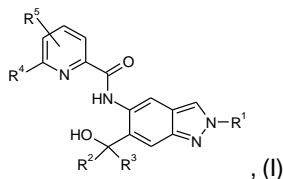
(62) а 2017 06382, 25.11.2015

(72) Боте Ульріх (DE), Зібенайхер Хольгер (DE), Шмідт Ніколе (US), Нуббемейер Райнхард (DE), Бьомер Ульф (DE), Гюнтер Юдіт (DE), Штойбер Хольгер (DE), Ланге Мартін (DE), Штегманн Крістіан (DE), Зуттер Андреас (DE), Рауш Александра (DE), Фрідріх Крістіан (DE), Гауф Петер (DE)

(73) БАЙЕР ФАРМА АКЦІЕНГЕЗЕЛЛЬШАФТ
Müllerstr. 178, 13353 Berlin, Germany (DE)

(54) ЗАМІЩЕНІ ІНДАЗОЛИ, СПОСОБИ ЇХ ОДЕРЖАННЯ, ФАРМАЦЕВТИЧНІ ПРЕПАРАТИ, ЯКІ ЇХ МІСТЯТЬ, ТА ЇХ ЗАСТОСУВАННЯ ДЛЯ ОДЕРЖАННЯ ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ

(57) 1. Сполуки загальної формули (I):



в якій:

R¹ являє собою C₁-C₆-алкіл, де C₁-C₆-алкільна група монозаміщена групою R⁷SO₂ або R⁷SO, або де C₁-C₆-алкільна група полізаміщена щонайменше однією з групи R⁷SO₂ або групи R⁷SO та одним або декількома додатковими замісниками, вибраними із групи, яка складається з галогену, гідроксилу, незаміщеного або моно- або полігалогензаміщеного C₃-C₆-циклоалкілу, групи R⁶ та групи R⁸O; R² і R³ завжди мають однакове визначення і обидва являють собою або водень, або C₁-C₆-алкіл; R⁴ являє собою галоген, ціано, незаміщений або одноразово або багаторазово, однаково або по-різному, заміщений C₁-C₆-алкіл або незаміщений або одноразово або багаторазово, однаково або по-різному, заміщений C₃-C₆-циклоалкіл, і замісники вибрані з групи, яка складається з галогену і гідроксилу; R⁵ являє собою водень, галоген або незаміщений або моно- або полігалогензаміщений C₁-C₆-алкіл; R⁶ являє собою незаміщений або моно- або диметилзаміщений моноциклічний насичений гетероцикл, що має 4-6 кільцевих атомів, який містить гетероатом або гетерогрупу із групи, яка складається з O, S, SO та SO₂; R⁷ являє собою C₁-C₆-алкіл, де C₁-C₆-алкільна група незаміщена або моно- або полізаміщена, однаково або по-різному, галогеном, гідроксильною або C₃-C₆-циклоалкілом; або R⁷ являє собою C₃-C₆-циклоалкіл; R⁸ являє собою C₁-C₆-алкіл, де C₁-C₆-алкільна група незаміщена або моно- або полізаміщена, однаково або по-різному, галогеном, або їх солі.

2. Сполуки за п. 1, де

R¹ являє собою C₁-C₆-алкіл, де C₁-C₆-алкільна група монозаміщена групою R⁷SO₂ або групою R⁷SO або

де C₁-C₆-алкільна група полізаміщена щонайменше однією з групи R⁷SO₂ або групи R⁷SO та одним або декількома додатковими замісниками, вибраними із групи, яка складається з фтору, гідроксилу, групи R⁶ та групи R⁸O;

R² та R³ завжди мають однакове визначення і обидва являють собою або водень, або C₁-C₃-алкіл; R⁴ являє собою галоген, ціано або C₁-C₃-алкіл, де C₁-C₃-алкільна група незаміщена або моно- або полізаміщена, однаково або по-різному, галогеном або гідроксильною;

R⁵ являє собою водень, фтор, хлор або C₁-C₃-алкіл; R⁶ являє собою оксетаніл або тетрагідрофураніл; R⁷ являє собою C₁-C₄-алкіл, де C₁-C₄-алкільна група незаміщена або монозаміщена гідроксильною або циклопропілом, або заміщена трьома атомами фтору, та

R⁸ являє собою незаміщену C₁-C₄-алкільну групу або трифторзаміщену C₁-C₄-алкільну групу.

3. Сполуки за п. 1 або 2, де R⁴ являє собою дифторметил, трифторметил або метил.

4. Сполуки за пп. 1, 2 або 3, де R⁵ являє собою водень або фтор.

5. Сполуки за пп. 1, 2, 3 або 4, де R² і R³ обидва являють собою або водень, або метил.

6. Сполуки за п. 2, де

R¹ являє собою C₂-C₆-алкіл, де C₂-C₆-алкільна група монозаміщена R⁷SO₂,

R² і R³ завжди мають однакове визначення і обидва являють собою або водень, або метил;

R⁴ являє собою незаміщену або моно- або полігалогензаміщену C₁-C₃-алкільну групу, заміщену однією гідроксильною групою, або C₁-C₃-алкільну групу, заміщену однією гідроксильною групою і трьома атомами фтору;

R⁵ являє собою водень, фтор або C₁-C₃-алкіл, та

R⁷ являє собою C₁-C₃-алкіл.

7. Сполуки за п. 6, де

R¹ являє собою метил-SO₂-заміщену C₂-C₄-алкільну групу;

R² і R³ завжди мають однакове визначення і являють собою або водень, або метил;

R⁴ вибраний із групи, яка складається з метилу, етилу, трифтор-C₁-C₃-алкілу, дифтор-C₁-C₃-алкілу, гідроксиметилу, 1-гідроксietилу, 2-гідроксипропан-2-ілу і 2,2,2-трифтор-1-гідроксietилу, та

R⁵ являє собою водень, фтор або метил.

8. Сполуки за п. 7, де

R¹ являє собою 2-(метилсульфоніл)етил або 3-(метилсульфоніл)пропіл;

R² і R³ обидва являють собою або метил, або водень; R⁴ являє собою дифторметил, трифторметил або метил, та

R⁵ являє собою водень або фтор.

9. Сполуки за п. 8, де

R¹ являє собою 3-(метилсульфоніл)пропіл або 2-(метилсульфоніл)етил;

R² і R³ обидва являють собою метил;

R⁴ являє собою дифторметил або трифторметил, та R⁵ являє собою водень.

10. Сполуки за п. 8, де

R¹ являє собою 3-(метилсульфоніл)пропіл або 2-(метилсульфоніл)етил;

R² і R³ обидва являють собою метил;

R⁴ являє собою метил, та

R⁵ являє собою фтор, де R⁵ знаходиться в *орто*-положенні до R⁴.

11. Сполуки за пп. 1-10, зазначені нижче:

10) N-{6-(2-гідроксипропан-2-іл)-2-[3-(метилсульфоніл)пропіл]-2H-індазол-5-іл}-6-(трифторметил)піридин-2-карбоксамід,

12) N-{6-(2-гідроксипропан-2-іл)-2-[2-(метилсульфоніл)етил]-2H-індазол-5-іл}-6-(трифторметил)піридин-2-карбоксамід, та

14) 6-(дифторметил)-N-{6-(2-гідроксипропан-2-іл)-2-[2-(метилсульфоніл)етил]-2H-індазол-5-іл}піридин-2-карбоксамід.

12. Застосування сполуки загальної формули (I) за будь-яким з пп. 1-11 для лікування і/або профілактики захворювань.

13. Застосування сполуки загальної формули (I) за п. 12 для лікування і/або профілактики неопластичних порушень, дерматологічних порушень, гінекологічних порушень, серцево-судинних порушень, легневих порушень, офтальмологічних порушень, неврологічних порушень, порушень обміну речовин, пе-

чіткових порушень, запальних порушень, аутоімунних порушень і болю.

14. Застосування сполуки загальної формули (I) за п. 12 для лікування і/або профілактики лімфоми, дегенерації жовтої плями, псоріазу, червоного вовчака, розсіяного склерозу, ХОЗЛ, подагри, НАСГ, фіброзу печінки, резистентності до інсуліну, метаболічного синдрому, спондилоартриту і ревматоїдного артриту, ендометріозу і пов'язаного з ендометріозом болю та інших ендометріозасоційованих симптомів, таких як дисменорея, диспареунія, дизурія і дисхезія.

15. Застосування сполуки загальної формули (I) за п. 12 для лікування і/або профілактики болю, включаючи гострий, хронічний, запальний і невропатичний біль, переважно при гіпералгезії, алодинії, болю при артритах (таких як остеоартрит, ревматоїдний артрит і спондилоартрит), передменструального болю, ендометріозасоційованого болю, післяопераційного болю, болю при інтерстиціальному циститі, CRPS (комплексний регіональний больовий синдром), невралгії трійчастого нерва, болю при простатиті, болю, викликаного ушкодженнями спинного мозку, болю, викликаного запаленням, болю в попереку, болю при раку, болю, пов'язаного з хіміотерапією, при невропатії, індукованої лікуванням ВІЛ, болю, викликаного опіком, і хронічного болю.

16. Застосування сполуки загальної формули (I) за будь-яким з пп. 1-11 для виготовлення лікарського засобу.

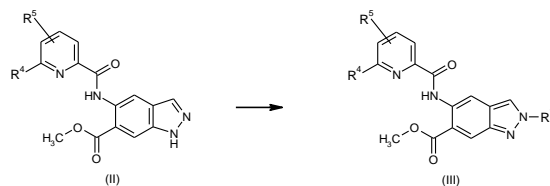
17. Застосування за п. 16, де лікарський засіб застосовують для лікування і/або профілактики неопластичних порушень, дерматологічних порушень, гінекологічних порушень, серцево-судинних порушень, легневих порушень, офтальмологічних порушень, неврологічних порушень, порушень обміну речовин, порушень печінки, запальних порушень, аутоімунних порушень і болю.

18. Застосування за пп. 16 і 17 для лікування і/або профілактики лімфоми, дегенерації жовтої плями, псоріазу, червоного вовчака, розсіяного склерозу, ХОЗЛ, подагри, НАСГ, фіброзу печінки, резистентності до інсуліну, метаболічного синдрому, спондилоартриту і ревматоїдного артриту, ендометріозу і пов'язаного з ендометріозом болю та інших ендометріозасоційованих симптомів, таких як дисменорея, диспареунія, дизурія і дисхезія.

19. Застосування за пп. 16 і 17 для лікування і/або профілактики болю, включаючи гострий, хронічний, запальний і невропатичний біль, краще при гіпералгезії, алодинії, болю при артритах (таких як остеоартрит, ревматоїдний артрит і спондилоартрит), передменструального болю, ендометріозасоційованого болю, післяопераційного болю, болю при інтерстиціальному циститі, CRPS (комплексний регіональний больовий синдром), невралгії трійчастого нерва, болю при простатиті, болю, викликаного ушкодженнями спинного мозку, болю, викликаного запаленням, болю в попереку, болю при раку, болю, пов'язаного з хіміотерапією, при невропатії, індукованої лікуванням ВІЛ, болю, викликаного опіком, і хронічного болю.

20. Лікарський засіб, який містить сполуки формули (I) за будь-яким з пп. 1-11 в комбінації з інертним, нетоксичним фармацевтично прийнятним ексципієнтом.

21. Спосіб одержання сполук загальної формули (III) зі сполук загальної формули (II):



в яких

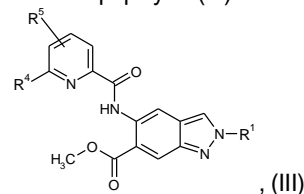
R¹ являє собою 2-(метилсульфоніл)етил або 3-(метилсульфоніл)пропіл;

R⁴ являє собою дифторметил, трифторметил або метил, та

R⁵ являє собою водень або фтор;

за реакцією (II) з відповідним чином заміщеними алкілгалогенідами або алкіл-4-метилбензолсульфонатами в присутності карбонату калію.

22. Сполуки загальної формули (III):



в яких

R¹ являє собою 2-(метилсульфоніл)етил або 3-(метилсульфоніл)пропіл;

R⁴ являє собою дифторметил, трифторметил або метил, та

R⁵ являє собою водень або фтор.

(11) 123791

(51) МПК (2021.01)

C07D 401/14 (2006.01)

A61K 31/4439 (2006.01)

A61P 9/00

(21) а 2018 11793

(22) 02.05.2017

(24) 03.06.2021

(31) 16168165.5

(32) 03.05.2016

(33) EP

(86) PCT/EP2017/060356, 02.05.2017

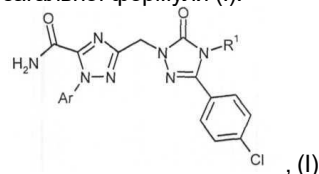
(72) Коллін-Крьопелін Марі-П'єр (DE), Колькхоф Петер (DE), Нойбауер Томас (DE), Фюрстнер Шанталь (DE), Поок Елізабет (DE), Віттвер Маттіас Біт (CH), Люстіг Клеменс (DE), Бухмюллер Аня (DE), Тінель Ханна (DE), Дрьобнер Кароліна (DE), Мондрітські Томас (DE), Ширмер Хайко (DE), Крещмер Аксель (DE), Шмекк Карстен (DE), Васнер П'єр (DE), Чернецька Хана (DE)

(73) БАЕР ФАРМА АКЦІЕНГЕЗЕЛЬШАФТ

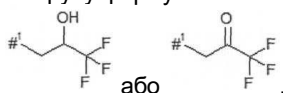
Müllerstr. 178, 13353 Berlin, Germany (DE)

(54) ЗАМІЩЕНІ АМІДОМ ПОХІДНІ ПІРИДИНІЛТРИАЗОЛУ ТА ЇХ ЗАСТОСУВАННЯ

(57) 1. Сполука загальної формули (I):



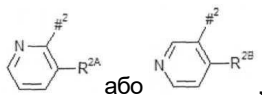
в якій

R¹ являє собою групу формули

в якій

#¹ являє собою точку приєднання до атома азоту,

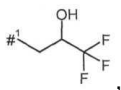
Ar являє собою групу формули



в якій

#² являє собою точку приєднання до атома азоту, R^{2A} являє собою групу, вибрану з атома хлору, атома бром, трифторметилу, трифторметокси, етоксикарбонілу та -C(=O)NH₂,R^{2B} являє собою групу, вибрану з атома хлору, трифторметилу та етоксикарбонілу, або її фармацевтично прийнятна сіль, гідрат та/або сольват.

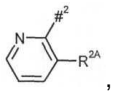
2. Сполука загальної формули (I) за пунктом 1, в якій

R¹ являє собою групу формули

в якій

#¹ являє собою точку приєднання до атома азоту,

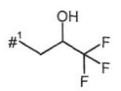
Ar являє собою групу формули



в якій

#² являє собою точку приєднання до атома азоту, R^{2A} являє собою групу, вибрану з атома хлору, атома бром, трифторметилу, трифторметокси, етоксикарбонілу та -C(=O)NH₂, або її фармацевтично прийнятна сіль, гідрат та/або сольват.

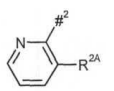
3. Сполука загальної формули (I) за пунктом 1 або 2, в якій

R¹ являє собою групу формули

в якій

#¹ являє собою точку приєднання до атома азоту,

Ar являє собою групу формули

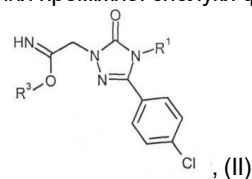


в якій

#² являє собою точку приєднання до атома азоту, R^{2A} являє собою групу, вибрану з атома хлору, трифторметилу та трифторметокси, або її фармацевтично прийнятна сіль, гідрат та/або сольват.

4. Спосіб отримання сполуки загальної формули (I) за будь-яким одним з пунктів 1-3, де зазначений спосіб включає стадію

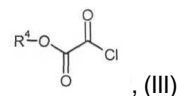
[A] забезпечення проміжної сполуки формули (II):



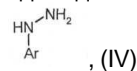
в якій

R¹ є таким, як визначено для сполуки загальної формули (I) за будь-яким одним з пунктів 1-3,R³ являє собою (C₁-C₄)-алкільну групу, зокрема метильну групу,

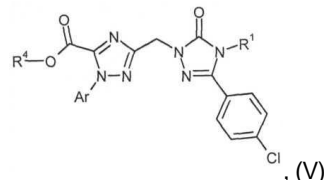
для взаємодії на першій стадії в присутності основи та, необов'язково, солі міді зі сполукою загальної формули (III):



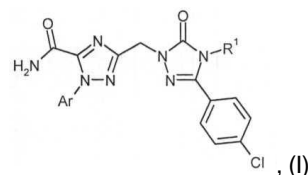
в якій

R⁴ являє собою (C₁-C₄)-алкільну групу, зокрема метильну групу, отримуючи проміжну сполуку, яка потім забезпечує взаємодію в присутності основи на другій стадії з підразиною сполукою загальної формули (IV) або її відповідною сіллю

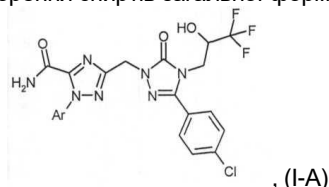
в якій Ar є таким, як визначено для сполуки загальної формули (I) за будь-яким одним з пунктів 1-3, таким чином, отримуючи сполуку загальної формули (V):

в якій R¹ та Ar є такими, як визначено для сполуки загальної формули (I) за будь-яким одним з пунктів 1-3, таR⁴ являє собою (C₁-C₄)-алкільну групу, зокрема метильну групу, з наступною подальшою стадією

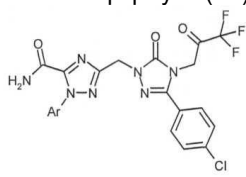
[B] забезпечення сполуки формули (V), отриманої на стадії [A] для взаємодії з аміаком, таким чином, отримуючи сполуку загальної формули (I):

в якій R¹ та Ar є такими, як визначено для сполуки загальної формули (I) за будь-яким одним з пунктів 1-3, необов'язково з наступною стадією

[C] перетворення спиртів загальної формули (I-A):



в якій Ar є таким, як визначено для сполуки загальної формули (I) за будь-яким одним з пунктів 1-3, до кетонів загальної формули (I-B):



(I-B)

в якій Ar є таким, як визначено для сполуки загальної формули (I) за будь-яким одним з пунктів 1-3, використовуючи відомі способи окиснення, причому після кожної [A], [B] та [C] необов'язково йде, де доцільно, (i) розділення сполуки формули (I), таким чином, з отриманням її відповідних енантіомерів, та/або (ii) перетворення сполуки формули (I) в її відповідні гідрати, сольвати, солі та/або гідрати або сольватів солей шляхом обробки відповідними розчинниками та/або кислотами або основами.

5. Антагоніст рецептора вазопресину V1a, що являє собою сполуку, як визначено в будь-якому з пунктів 1-3.

6. Застосування сполуки, як визначено в будь-якому з пунктів 1-3, для лікування та/або попередження гострих та хронічних захворювань нирок, включаючи діабетичну нефропатію, гострої та хронічної серцевої недостатності, прееклампсії, периферичного артеріального захворювання (PAD), коронарної мікросудинної дисфункції (CMD), синдрому Рейно та дисменореї.

7. Застосування сполуки, як визначено в будь-якому з пунктів 1-3, для виробництва фармацевтичної композиції для лікування та/або попередження гострих та хронічних захворювань нирок, включаючи діабетичну нефропатію, гострої та хронічної серцевої недостатності, прееклампсії, периферичного артеріального захворювання (PAD), коронарної мікросудинної дисфункції (CMD), синдрому Рейно та дисменореї.

8. Фармацевтична композиція, яка містить сполуку, як визначено в будь-якому з пунктів 1-3, та один або декілька фармацевтично прийнятних ексципієнтів.

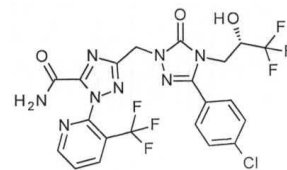
9. Фармацевтична композиція за пунктом 8, яка містить один або декілька перших активних інгредієнтів, зокрема сполуки загальної формули (I) за будь-яким одним з пунктів 1-3, та один або декілька додаткових активних інгредієнтів, зокрема один або декілька додаткових терапевтичних агентів, вибраних з групи, яка складається з діуретиків, антагоністів ангіотензину All, інгібіторів АСЕ, блокаторів бета-рецептора, антагоністів мінералокортикоїдних рецепторів, протидіабетичних агентів, органічних нітратів та донорів NO, активаторів та стимуляторів розчинної гуанілатциклази (sGC), протизапальних агентів, імуносупресивних агентів, фосфат-зв'язуючих агентів та/або сполук, які модулюють метаболізм вітаміну D.

10. Фармацевтична композиція за пунктом 8 або 9 для лікування та/або попередження гострих та хронічних захворювань нирок, включаючи діабетичну нефропатію, гострої та хронічної серцевої недостатності, прееклампсії, периферичного артеріального захворювання (PAD), коронарної мікросудинної дисфункції (CMD), синдрому Рейно та дисменореї.

11. Спосіб для лікування та/або попередження гострих та хронічних захворювань нирок, включаючи діабетичну нефропатію, гострої та хронічної серце-

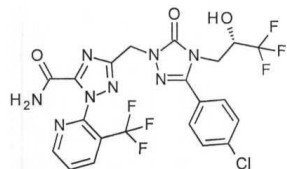
вої недостатності, прееклампсії, периферичного артеріального захворювання (PAD), коронарної мікросудинної дисфункції (CMD), синдрому Рейно та дисменореї у людини або іншого ссавця, який включає введення людині або іншому ссавцю, який цього потребує, терапевтично ефективної кількості однієї або декількох сполук, як визначено в будь-якому з пунктів 1-3, або фармацевтичної композиції, як визначено в будь-якому з пунктів 8-10.

12. 3-({3-(4-Хлорфеніл)-5-оксо-4-[(2S)-3,3,3-трифтор-2-гідроксипропіл]-4,5-дигідро-1H-1,2,4-триазол-1-іл}метил)-1-[3-(трифторметил)піридин-2-іл]-1H-1,2,4-триазол-5-карбоксамід за пунктом 1 формули



або його фармацевтично прийнятна сіль.

13. Сполука за пунктом 12, що являє собою 3-({3-(4-хлорфеніл)-5-оксо-4-[(2S)-3,3,3-трифтор-2-гідроксипропіл]-4,5-дигідро-1H-1,2,4-триазол-1-іл}метил)-1-[3-(трифторметил)піридин-2-іл]-1H-1,2,4-триазол-5-карбоксамід формули



(11) 123810

(51) МПК

C07D 403/04 (2006.01)

C07D 417/04 (2006.01)

A61P 25/30 (2006.01)

A61K 31/506 (2006.01)

(21) а 2019 08610

(22) 23.01.2018

(24) 03.06.2021

(31) 62/449,270

(32) 23.01.2017

(33) US

(86) PCT/US2018/014792, 23.01.2018

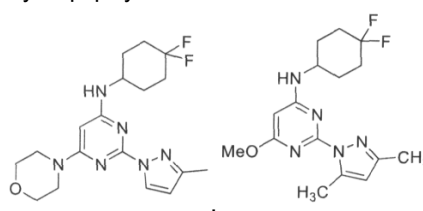
(72) Амруткар Діпак Васантрао (DK), Фостер Келлі (US), Якобсен Томас Амос (DK), Джефсон Мартін Р. (US), Кіні Грег Ф. (US), Ларсен Янус Шрайбер (DK), Нільсен Карін Сандагер (DK)

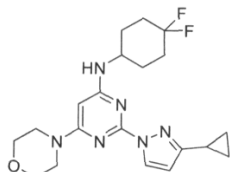
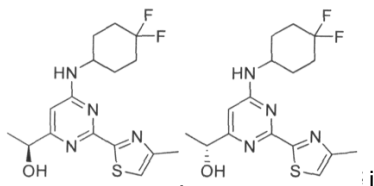
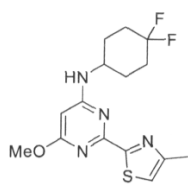
(73) ЦАДЕНТ ТЕРАПЕУТИКС, ІНК.

60 Hamilton Street, Cambridge, MA 02139, United States of America (US)

(54) МОДУЛЯТОРИ КАЛІЄВИХ КАНАЛІВ

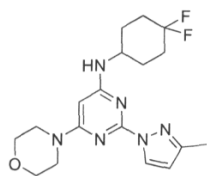
(57) 1. Сполука формули





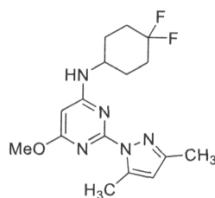
або її фармацевтично прийнятна сіль.

2. Сполука за п. 1, де сполука характеризується формулою:



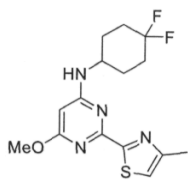
або її фармацевтично прийнятна сіль.

3. Сполука за п. 1, де сполука характеризується формулою:



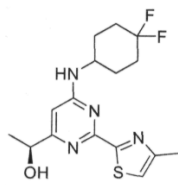
або її фармацевтично прийнятна сіль.

4. Сполука за п. 1, де сполука характеризується формулою:



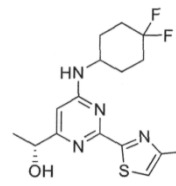
або її фармацевтично прийнятна сіль.

5. Сполука за п. 1, де сполука характеризується формулою:



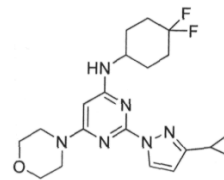
або її фармацевтично прийнятна сіль.

6. Сполука за п. 1, де сполука характеризується формулою:



або її фармацевтично прийнятна сіль.

7. Сполука за п. 1, де сполука характеризується формулою:



або її фармацевтично прийнятна сіль.

8. Фармацевтична композиція, яка містить сполуку за будь-яким із пп. 1-7 або її фармацевтично прийнятну сіль; і фармацевтично прийнятний носій.

9. Застосування сполуки за будь-яким із пп. 1-7 в лікуванні захворювання або стану, що реагує на модуляцію кальційзалежного калієвого каналу малої провідності (канал SK).

10. Застосування сполуки за п. 9, яке **відрізняється** тим, що захворювання або стан є реакцією на модуляцію каналу SK2.

11. Застосування сполуки за п. 9, яке **відрізняється** тим, що захворювання або стан вибрано з групи, що складається з нейродегенеративного захворювання, деменції, захворювання серця, абстинентних симптомів, пов'язаних із припиненням залежності, метаболічного захворювання та захворювання сечового міхура.

12. Застосування сполуки за п. 9, яке **відрізняється** тим, що захворювання або стан вибрано з групи, що складається з атаксії, дистонії, тремору, хвороби Паркінсона, ішемії, черепно-мозкової травми, бічного аміотрофічного склерозу, гіпертонії, атеросклерозу, діабету, аритмії, гіперактивності сечового міхура та симптомів абстиненції, викликаних припиненням вживання алкоголем й іншими наркотичними речовинами.

13. Застосування сполуки за п. 12, яке **відрізняється** тим, що захворювання або стан є есенціальним тремором.

14. Застосування сполуки за п. 12, яке **відрізняється** тим, що захворювання або стан є атаксією.

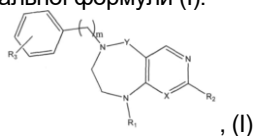
15. Застосування сполуки за п. 14, яке **відрізняється** тим, що захворювання або стан є спиноцереблярною атаксією.

16. Застосування сполуки за п. 10, яке **відрізняється** тим, що захворювання або стан є тривожністю.

(11) 123789

(51) МПК (2021.01)
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
C07D 498/10 (2006.01)
A61K 31/551 (2006.01)
A61P 29/00
A61P 25/00

- (21) а 2018 11326 (22) 05.05.2017
 (24) 03.06.2021
 (31) 16382199.4
 (32) 06.05.2016
 (33) EP
 (86) PCT/EP2017/060780, 05.05.2017
 (72) Куевас-Кордобес Фелікс (ES), Алманса-Росалес Кармен (ES)
 (73) ЕСТЕВЕ ФАРМАСЬЮТИКАЛС, С.А.
 Passeig de la Zona Franca, 109, 4^a Planta, 08038 Barcelona, Spain (ES)
 (54) ТЕТРАГІДРОПІРИДОДІАЗЕПІН І ТЕТРАГІДРОПІРИДОДІАЗЕПІН СПОЛУКИ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ БОЛЮ ТА СТАНІВ, ПОВ'ЯЗАНИХ З БОЛЕМ
 (57) 1. Сполука загальної формули (I):



в якій:

X являє собою CR_x або N;
 R_x являє собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆алкіл або атом галогену;
 Y являє собою CH₂ або C=O;
 m дорівнює 0, 1 або 2;
 R₁ являє собою атом водню або лінійний або розгалужений C₁₋₆алкіл;
 R₂ являє собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆алкіл, атом галогену, галоалкіл, -SR_{2a}, -NR_{2a}R_{2b} або -OR_{2a};
 R_{2a} і R_{2b} незалежно один від одного являють собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C₁₋₄алкіл, C₃₋₆циклоалкіл, -(CH₂)_r-арил, де арильна група являє собою 5- або 6-членне кільце та r дорівнює 0, 1 або 2, -(CH₂)_s-гетероарил, де гетероарильна група являє собою 5- або 6-членне кільце з щонайменше одним атомом азоту як гетероатома, необов'язково заміщеного щонайменше одним атомом галогену, і s дорівнює 0, 1 або 2 або -(CH₂)₂-O-CH₃;
 R₃ являє собою атом водню, -CN, -OH, галоген, розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆алкіл, -(CH₂)_p-O-R₄, якщо p дорівнює 0, 1 або 2; -(CH₂)_q-NR₅R₆, якщо q дорівнює 0, 1, 2 або 3; -C(CH₃)₂-CH₂-NR₅R₆, -C(=O)NR₅R₆, 5- або 6-членну гетероарильну групу, що має щонайменше один гетероатом, що вибраний з N, O або S, і заміщену одним або двома R₇ замісниками, і яка може бути приєднана до фенільного кільця C₁₋₃алкіленовою групою; 5- або 6-членний гетероциклоалкіл, що має один або два атоми азоту як гетероатом, і може бути незаміщений або необов'язково заміщений одним або двома R₈ замісниками, і може бути приєднаний до фенільного кільця C₁₋₃ алкіленовою групою або -C(=O)OR₉;
 R₄ являє собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆алкіл, трет-бутилдиметилсиліл, метилбензолсульфонат, -CHR_{4a}R_{4b}, -CH₂-CHR_{4a}R_{4b} або 5- або 6-членний гетероциклоалкіл, що має щонайменше один атом N, і може бути необов'язково заміщений одним або двома R_{4c};
 R_{4a} являє собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆алкіл, 5- або 6-членну арильну групу, необов'язково заміщену щонайменше одним атомом галогену, або 5- або 6-членну гетероарильну групу, що має щонайменше один гетероатом, що виб-

раний з N, O або S, і необов'язково заміщену щонайменше розгалуженим або нерозгалуженим C₁₋₆алкілом;

R_{4b} являє собою -(CH₂)_j-NR_{4b}R_{4b}, якщо j дорівнює 0, 1, 2 або 3;

R_{4b} і R_{4b} незалежно один від одного являють собою атом водню; розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆алкіл, C₁₋₆галоалкіл, бензильну групу, фенетильну групу, трет-бутилоксикарбонільну групу або (триметилсиліл)етилкарбонільну групу; або

R_{4b} і R_{4b} разом з містковим азотом утворюють 5- або 6-членний гетероциклоалкіл, який необов'язково містить додатковий гетероатом, що вибраний з N, O або S;

R_{4c} являє собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆алкіл, фенільну групу, бензильну групу або трет-бутилоксикарбонільну групу;

R₅ і R₆ незалежно один від одного являють собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆алкіл, трет-бутилоксикарбонільну групу, бензильну групу, фенетильну групу; або

R₅ і R₆ разом з містковим азотом утворюють 5- або 6-членний гетероциклоалкіл, який може бути моно- або бізаміщений фенільною групою, в свою чергу, необов'язково заміщеною розгалуженим або нерозгалуженим C₁₋₆алкілом, атомом галогену, -OH або -CN, або -NRR';

R і R' незалежно один від одного являють собою атом водню або розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆алкіл; або

R₅ і R₆ разом з містковим азотом утворюють 5- або 6-членний гетероциклоалкіл, який може бути спіроконденсований до іншого 5- або 6-членного гетероциклоалкілу, що має щонайменше один гетероатом, вибраний з N, O або S, який може, в свою чергу, бути заміщений одним або більше замісниками, вибраними з розгалуженого або нерозгалуженого C₁₋₆алкілу, атома галогену, -OH, -CN або =O;

R₇ являє собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆алкіл, -C(=O)N групу, -(CH₂)_p-NR_{7a}R_{7b}, якщо p дорівнює 0, 1, 2 або 3; або -(CH)R_{7c}R_{7d};

R_{7a} і R_{7b} незалежно один від одного являють собою атом водню розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆алкіл, трет-бутилоксикарбонільну групу, бензильну групу, необов'язково заміщену галогеном, фенетильну групу, -(CH₂)-циклопропіл, гідроксіетоксіетильну групу, -OH, -C(=O)N групу, піридинілметильну групу; або

R_{7a} і R_{7b} разом з містковим азотом утворюють 5- або 6-членний гетероциклоалкіл, що може додатково містити другий атом N, який може бути заміщений -NR_{7a}R_{7b}, якщо R_{7a} і R_{7b} являють собою атом водню або розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆алкіл; або фенільною групою, в свою чергу, необов'язково заміщеною розгалуженим або нерозгалуженим C₁₋₆алкілом, атомом галогену, -OH або -CN; або R_{7a} і R_{7b} разом з містковим азотом утворюють 5- або 6-членний гетероциклоалкіл, який може бути конденсований до 5- або 6-членного ароматичного кільця, або може бути спіроконденсований до одного 5- або 6-членного гетероциклоалкільного кільця, що має щонайменше один гетероатом, вибраний з N, O або S, який, в свою чергу, може бути заміщений одним або декількома замісниками, вибраними з розгалуженого або нерозгалуженого C₁₋₆алкілу, атома галогену, -OH, -CN або =O; або може бути спірокон-

денсований до біциклічної кільцевої системи, утвореної 5- або 6-членним гетероциклоалкільним кільцем, що має щонайменше один гетероатом, вибраний з N, O або S, конденсований до 5- або 6-членного ароматичного кільця;

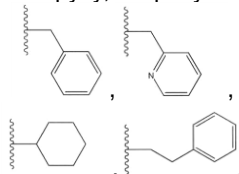
R_{7c} і R_{7d} незалежно один від одного являють собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} -алкіл або C_{1-6} -алкокси; і

R_8 являє собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} -алкіл, трет-бутилоксикарбонільну групу, фенільну групу, бензильну групу, фенетильну групу або $-NR_{8a}R_{8b}$, якщо R_{8a} і R_{8b} являють собою атом водню або розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} -алкіл;

R_9 являє собою атом водню, або лінійний або розгалужений C_{1-6} -алкіл;

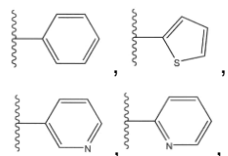
або її фармацевтично прийнятна сіль, або стереоізомер.

2. Сполука за п. 1, де R_2 являє собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} -алкіл, переважно метил; атом галогену, переважно хлор; галоалкіл, переважно трифторметил; $-SR_{2a}$, $-NR_{2a}R_{2b}$ або $-OR_{2a}$, де R_{2a} і R_{2b} незалежно вибрані з атома водню, розгалуженого або нерозгалуженого C_{1-4} -алкілу, переважно метилу, етилу, ізопропілу або ізобутилу, $-(CH_2)_2-O-CH_3$, або групу, вибрану з:

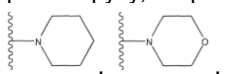


3. Сполука за п. 1, де R_3 являє собою $-(CH_2)_p-O-R_4$, в якій p дорівнює 0, 1 або 2 і в якій R_4 являє собою:

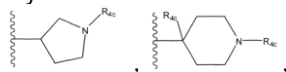
- атом водню;
- розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} -алкіл, переважно метил або етил;
- трет-бутилдиметилсиліл;
- метилбензолсульфонат;
- $-CHR_{4a}R_{4b}$ або $-CH_2-CHR_{4a}R_{4b}$, в якій R_{4a} являє собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} -алкіл, переважно метил або ізопропіл; або групу, вибрану з:



і в якій R_{4b} являє собою $-(CH_2)_j-NR_{4b'}R_{4b''}$, якщо j дорівнює 0, 1, 2 або 3, і $R_{4b'}$ і $R_{4b''}$ незалежно один від одного являють собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} -алкіл, переважно метил; C_{1-6} -галоалкіл, бензильну групу, фенетильну групу, трет-бутилоксикарбонільну групу, (триметилсиліл)етил-оксикарбонільну групу, або $R_{4b'}$ і $R_{4b''}$ разом з містковим азотом утворюють групу, вибрану з:



- групу, вибрану з:

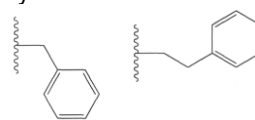


в якій R_{4c} являє собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} -алкіл, переважно метил; феніль-

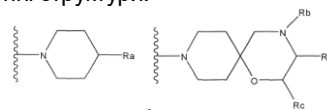
ну групу, бензильну групу або трет-бутилоксикарбонільну групу.

4. Сполука за п. 1, де R_3 являє собою $-(CH_2)_q-NR_5R_6$, $-C(CH_3)_2-CH_2-NR_5R_6$ або $-C(=O)NR_5R_6$, в якій q дорівнює 0, 1, 2 або 3, і в якій R_5 і R_6 незалежно один від одного являють собою:

- атом водню;
- розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} -алкіл, переважно метил;
- трет-бутилоксикарбонільну групу;
- групу, вибрану з:



або в якій R_5 і R_6 разом з містковим азотом утворюють наступні структури:

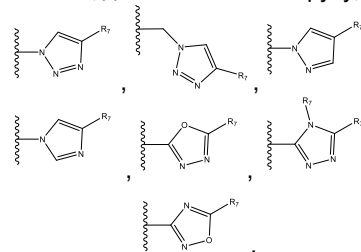


в якій R_a являє собою фенільну групу, в свою чергу, необов'язково заміщену розгалуженим або нерозгалуженим C_{1-6} -алкілом, атомом галогену, $-OH$ або $-CN$; або $-NRR'$, де R і R' незалежно один від одного являють собою атом водню або розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} -алкіл;

R_b являє собою розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} -алкіл, переважно метил або ізопропіл; атом галогену, $-OH$; або $-CN$; і

R_c являє собою розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} -алкіл, переважно метил або ізопропіл; атом галогену, $-OH$, $-CN$ або $=O$.

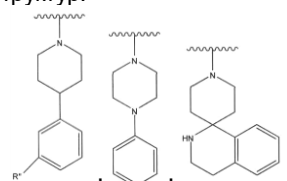
5. Сполука за п. 1, де R_3 являє собою групу, вибрану з:

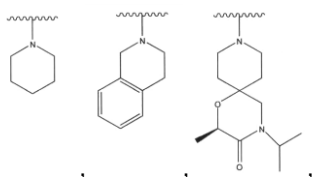


в якій R_7 являє собою:

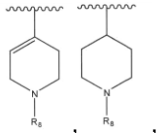
- атом водню;
- розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} -алкіл, переважно метил або етил;
- $-C(=O)H$ групу;
- $-(CH_2)_p-NR_{7a}R_{7b}$, якщо p дорівнює 0, 1, 2 або 3 або $-(CH)R_{7c}R_{7d}$;

в якій R_{7a} і R_{7b} незалежно один від одного являють собою атом водню; розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} -алкіл, переважно метил або етил; трет-бутилоксикарбонільну групу; бензильну групу, необов'язково заміщену галогеном; фенетильну групу; $-(CH_2)$ -циклопропіл; гідроксіетоксіетильну групу, $-OH$, $-C(=O)H$ -групу, піридинілметильну групу, або R_{7a} і R_{7b} разом з містковим азотом являють собою одну з наступних структур:





де R'' являє собою водень або -ОН групу;
і в якій R_{7c} і R_{7d} незалежно один від одного являють собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} алкіл, або C_{1-6} алкокси, переважно етоксиди.
6. Сполука за п. 1, де R_3 являє собою групу, вибрану з:



в якій R_8 являє собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C_{1-6} алкіл, трет-бутилоксикарбонільну групу, бензильну групу або фенетильну групу.

7. Сполука за п. 1, де R_3 являє собою -C(=O)OR₉, в якій R_9 являє собою атом водню або лінійний або розгалужений C_{1-6} алкіл, переважно метил.

8. Сполука за п. 1, яка вибрана з наступного переліку:

трет-бутилметил(3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-3-фенілпропіл)карбамат;
трет-бутил(R)-метил(3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-3-фенілпропіл)карбамат;
трет-бутил(S)-метил(3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-3-фенілпропіл)карбамат;
трет-бутилметил(2-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-2-фенілетил)карбамат;
трет-бутил(2-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-2-фенілетил)карбамат;
трет-бутилметил(2-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)пропіл)карбамат;
трет-бутилметил(3-метил-2-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензил)окси)-3-фенілпропіл)карбамат;
трет-бутил(R)-метил(3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензил)окси)-3-фенілпропіл)карбамат;
трет-бутил(S)-метил(3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензил)окси)-3-фенілпропіл)карбамат;
трет-бутилметил(3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-3-(тіофен-2-іл)пропіл)карбамат;
трет-бутил(R)-метил(3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-3-(тіофен-2-іл)пропіл)карбамат;
трет-бутил(S)-метил(3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-3-(тіофен-2-іл)пропіл)карбамат;

трет-бутилметил(3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензил)окси)-3-(тіофен-2-іл)пропіл)карбамат;
трет-бутил(R)-метил(3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензил)окси)-3-(тіофен-2-іл)пропіл)карбамат;
трет-бутил(S)-метил(3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензил)окси)-3-(тіофен-2-іл)пропіл)карбамат;
трет-бутилметил(2-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензил)окси)-1-фенілетил)карбамат;
2-(триметилсиліл)етилметил(2-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензил)окси)-2-фенілетил)карбамат;
трет-бутилметил(3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)пропіл)карбамат;
трет-бутилбензил(3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)пропіл)карбамат;
трет-бутилметил(2-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)етил)карбамат;
трет-бутилметил(3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)феніл)пропіл)карбамат;
трет-бутилметил(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенетил)карбамат;
трет-бутилметил(2-метил-2-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)феніл)пропіл)карбамат;
трет-бутилметил(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензил)карбамат;
трет-бутил-3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)піролідін-1-карбоксилат;
трет-бутил-4-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензил)окси)-4-фенілпіперидин-1-карбоксилат;
9-метил-6-(3-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)феніл)-2-(метилтіо)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
9-етил-6-(3-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)феніл)-2-(метилтіо)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
9-метил-6-(3-(5-метил-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-2-(метилтіо)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-метоксифеніл)-9-метил-2-(метилтіо)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензонітрил;
6-(3-(трет-бутилдиметилсиліл)окси)феніл)-9-метил-2-(метилтіо)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-бромфеніл)-9-метил-2-(метилтіо)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-(2-гідроксietил)феніл)-9-метил-2-(метилтіо)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(4-метоксифеніл)-9-метил-2-(метилтіо)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;

2-(триметилсиліл)етил-3-(3-(8-(диметиламіно)-1-метил-5-оксо-1,2,3,5-тетрагідро-4Н-піrido[4,3-е][1,4]діазепін-4-іл)фенокси)-3-(тіофен-2-іл)пропіл)(метил)карбамат;
2-(триметилсиліл)етил-3-((3-(8-(етиламіно)-1-метил-5-оксо-1,2,3,5-тетрагідро-4Н-піrido[4,3-е][1,4]діазепін-4-іл)бензил)окси)-3-(тіофен-2-іл)пропіл)(метил)карбамат;
трет-бутил-(2-фторетил)(3-(3-(9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-3-(тіофен-2-іл)пропіл)карбамат;
трет-бутилметил-2-(3-((9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)метил)фенокси)-2-фенілетил)карбамат;
трет-бутилметил-2-(4-((9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)метил)фенокси)-2-фенілетил)карбамат;
трет-бутилметил-4-((9-метил-2-(метилтіо)-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)метил)бензил)карбамат;
трет-бутил-(R)-3-((3-(2-(етиламіно)-9-метил-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензил)окси)-3-фенілпропіл)(метил)карбамат;
N-етил-9-метил-6-(3-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-2-амін;
N-етил-6-(3-метоксибензил)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-2-амін;
N-етил-6-(4-метоксибензил)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-2-амін;
трет-бутил-3-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-3-фенілпропіл)(метил)карбамат;
трет-бутил-(R)-3-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-3-фенілпропіл)(метил)карбамат;
трет-бутил-(S)-3-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-3-фенілпропіл)(метил)карбамат;
трет-бутил-2-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-2-фенілетил)(метил)карбамат;
трет-бутил-2-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-2-фенілетил)(метил)карбамат;
трет-бутил-2-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)пропіл)(метил)карбамат;
трет-бутил-2-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-3-метилпропіл)(метил)карбамат;
трет-бутил-2-(4-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-2-фенілетил)(метил)карбамат;
трет-бутил-3-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензил)окси)-3-фенілпропіл)(метил)карбамат;
трет-бутил-(R)-3-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензил)окси)-3-фенілпропіл)(метил)карбамат;
трет-бутил-(S)-3-((3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензил)окси)-3-фенілпропіл)(метил)карбамат;
трет-бутил-3-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-пірімідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)фенокси)-3-(тіофен-2-іл)пропіл)(метил)карбамат;

2-(бензиламіно)-9-метил-6-(3-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(циклогексиламіно)-9-метил-6-(3-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(бензил(метил)аміно)-9-метил-6-(3-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
9-метил-6-(3-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)феніл)-2-(фенетиламіно)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
9-метил-2-(метил(пиридин-2-ілметил)аміно)-6-(3-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
9-етил-2-(етиламіно)-6-(3-(5-метил-1,3,4-оксадіазол-2-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(5-метил-1,2,4-оксадіазол-3-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-6-(3-(2-метоксифеніл)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)бензонітрил;
6-(3-((трет-бутилдиметилсиліл)окси)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-6-(3-(2-гідроксіетил)феніл)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-6-(3-(2-гідроксіетил)феніл)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-6-(4-метоксифеніл)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(4-((трет-бутилдиметилсиліл)окси)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
трет-бутил-((1-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)феніл)-1Н-1,2,3-триазол-4-іл)метил)(метил)карбамат;
трет-бутил-((1-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)феніл)-1Н-1,2,3-триазол-4-іл)метил)карбамат;
трет-бутилбензил((1-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)феніл)-1Н-1,2,3-триазол-4-іл)метил)карбамат;
6-(3-(4-(діетоксиметил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
трет-бутил-2-(1-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)феніл)-1Н-1,2,3-триазол-4-іл)етил)(метил)карбамат;
трет-бутил-((1-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)феніл)-1Н-1,2,3-триазол-4-іл)метил)(метил)карбамат;
трет-бутил-((1-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)феніл)-1Н-1,2,3-триазол-4-іл)метил)(метил)карбамат;
трет-бутил-((1-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)феніл)-1Н-1,2,3-триазол-4-іл)етил)(метил)карбамат;
трет-бутил-((1-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)феніл)-1,3,4-оксадіазол-2-іл)метил)(метил)карбамат;

[illegible]

9-метил-6-(3-(((4-(метиламіно)бутан-2-іл)окси)метил)феніл)-2-(метилтіо)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(3-(метиламіно)-1-(пиридин-2-іл)пропоксифеніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-пірімідол[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(3-(метиламіно)-1-(пиридин-3-іл)пропоксифеніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-пірімідол[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
(R)-2-аміно-9-метил-6-(3-((3-(метиламіно)-1-фенілпропокси)метил)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
(R)-2-(диметиламіно)-9-метил-6-(3-((3-(метиламіно)-1-фенілпропокси)метил)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
(R)-9-метил-2-(метиаламіно)-6-(3-((3-(метиламіно)-1-фенілпропокси)метил)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
8-(етиламіно)-1-метил-4-(3-(3-(метиламіно)-1-фенілпропокси)феніл)-1,2,3,4-тетрагідро-5Н-піридо[4,3-е][1,4]діазепін-5-он;
8-(етиламіно)-1-метил-4-(3-((3-(метиламіно)-1-фенілпропокси)метил)феніл)-1,2,3,4-тетрагідро-5Н-піридо[4,3-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(2-(метиламіно)-1-фенілетоксизбензил)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(4-(2-(метиламіно)-1-фенілетоксизбензил)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(4-((метиаламіно)метил)бензил)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
(R)-N-етил-9-метил-6-(3-((3-(метиламіно)-1-фенілпропокси)метил)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-2-амін;
(R)-2-метоки-9-метил-6-(3-((3-(метиламіно)-1-фенілпропокси)метил)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
(R)-2-гідрокси-9-метил-6-(3-((3-(метиламіно)-1-фенілпропокси)метил)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
(R)-2,9-диметил-6-(3-((3-(метиламіно)-1-фенілпропокси)метил)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
(R)-9-метил-6-(3-((3-(метиламіно)-1-фенілпропокси)метил)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
9-метил-6-(3-((3-(метиламіно)-1-(тіюфен-2-іл)пропоксиметил)феніл)-2-(метилтіо)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
(R)-9-метил-6-(3-((3-(метиламіно)-1-(тіюфен-2-іл)пропоксиметил)феніл)-2-(метилтіо)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
(S)-9-метил-6-(3-((3-(метиламіно)-1-(тіюфен-2-іл)пропоксиметил)феніл)-2-(метилтіо)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-((3-(метиламіно)-1-(тіюфен-2-іл)пропоксиметил)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
(R)-2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-((3-(метиламіно)-1-(тіюфен-2-іл)пропоксиметил)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;

[illegible]

2-(етиламіно)-6-(3-(4-((4-(3-гідроксифеніл)піперидин-1-іл)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(4-((4-фенілпіперазин-1-іл)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(4-(піперидин-1-ілметил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-(4-((3,4-дигідроізохінолін-2(1Н)-іл)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-(4-((3,4-дигідро-2Н-спіро[ізохінолін-1,4'-піперидин-1'-іл)метил]-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
(R)-9-((1-(3-(2-(етиламіно)-9-метил-5-оксо-5,7,8,9-тетрагідро-6Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-6-іл)феніл)-1Н-1,2,3-триазол-4-іл)метил)-4-ізопропіл-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он;
6-(3-(4-((циклопропілметил)аміно)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-6-(3-(4-((етиламіно)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-6-(3-(4-(((4-фторбензил)(метил)аміно)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(4-((метил(піридин-2-ілметил)аміно)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(4-((метил(піридин-3-ілметил)аміно)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-6-(3-(4-(((2-(2-гідроксіетоксі)етил)аміно)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-(4-((4-(диметиламіно)-4-фенілпіперидин-1-іл)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-((4-(диметиламіно)-4-фенілпіперидин-1-іл)метил)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-(4-((4-(диметиламіно)-4-(3-гідроксифеніл)піперидин-1-іл)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-(4-((4-(диметиламіно)-4-фенілпіперидин-1-іл)метил)-1Н-піразол-1-іл)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-(4-((4-(диметиламіно)-4-(3-гідроксифеніл)піперидин-1-іл)метил)-1Н-піразол-1-іл)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-(4-((4-(диметиламіно)-4-(3-гідроксифеніл)піперидин-1-іл)метил)-1Н-імідазол-1-іл)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(триметилсиліл)етил-(3-(3-(8-хлор-1-метил-5-оксо-1,2,3,5-тетрагідро-4Н-піридо[4,3-е][1,4]діазепін-4-іл)фенокси)-3-(тіофен-2-іл)пропіл)(метил)карбамат;
2-(триметилсиліл)етил-(S)-(3-(3-(8-хлор-1-метил-5-оксо-1,2,3,5-тетрагідро-4Н-піридо[4,3-е][1,4]діазепін-4-іл)фенокси)-3-(тіофен-2-іл)пропіл)(метил)карбамат;

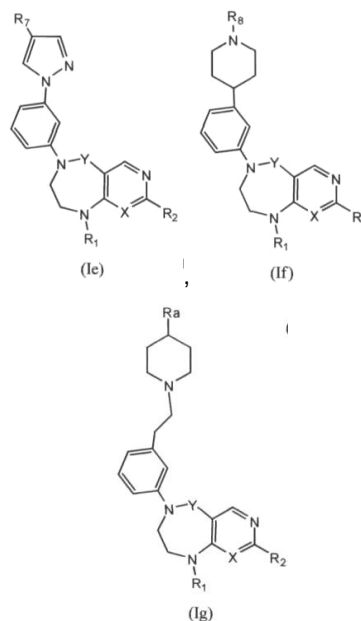
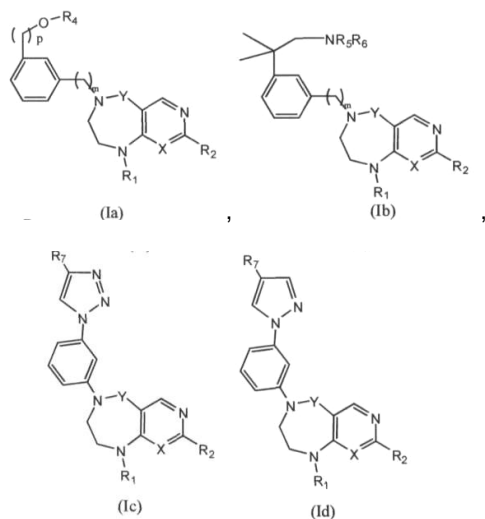
[illegible]

[illegible]

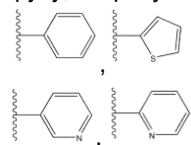
[illegible]

[illegible]

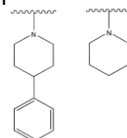
(S)-4-(2-фтор-4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)бензил)-1-метил-1,2,3,4-тетрагідро-5Н-піrido[4,3-е][1,4]діазепін-5-он;
 (S)-8-метокси-1-метил-4-(2-метил-4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)бензил)-1,2,3,4-тетрагідро-5Н-піrido[4,3-е][1,4]діазепін-5-он;
 (S)-1-метил-4-(2-метил-4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)бензил)-1,2,3,4-тетрагідро-5Н-піrido[4,3-е][1,4]діазепін-5-он;
 (S)-9-метил-6-(2-метил-4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)бензил)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
 (S)-6-(3-хлор-4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)бензил)-2-метокси-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
 (S)-6-(3-хлор-4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)бензил)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
 (S)-4-(3-хлор-4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)бензил)-1-метил-1,2,3,4-тетрагідро-5Н-піrido[4,3-е][1,4]діазепін-5-он;
 (S)-6-(2-хлор-4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)бензил)-2-метокси-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
 (S)-6-(2-хлор-4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)бензил)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
 (S)-4-(2-хлор-4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)бензил)-1-метил-1,2,3,4-тетрагідро-5Н-піrido[4,3-е][1,4]діазепін-5-он;
 (S)-2-етокси-9-метил-6-(4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)бензил)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
 (S)-8-метокси-4-(4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)бензил)-1,2,3,4-тетрагідро-5Н-піrido[4,3-е][1,4]діазепін-5-он;
 (S)-1-ізопропіл-4-(4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)бензил)-1,2,3,4-тетрагідро-5Н-піrido[4,3-е][1,4]діазепін-5-он;
 (S)-9-ізопропіл-6-(4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)бензил)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он.
 9. Сполука за п. 1, що має одну з наступних формул: (Ia), (Ib), (Ic), (Id), (Ie), (If) або (Ig):



в якій X, Y, R₁, R₂, m і p є такими, як визначено у п. 1; R₄ являє собою -CHR_{4a}R_{4b} або -CH₂-CHR_{4a}R_{4b}-фрагмент, де R_{4a} являє собою групу, вибрану з:



і R_{4b} являє собою -(CH₂)_p-NR_{7a}R_{7b}-фрагмент, якщо j дорівнює 0, 1, 2 або 3, і R_{4b'} і R_{4b''} незалежно один від одного являють собою атом водню; розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆алкіл, переважно метил; бензильну групу або фенетильну групу; R₅ і R₆ незалежно являють собою атом водню або розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆алкіл, переважно метил; R₇ являє собою -(CH₂)_p-NR_{7a}R_{7b}-фрагмент, якщо p дорівнює 0, 1, 2 або 3, і де R_{7a} і R_{7b} незалежно один від одного являють собою атом водню, розгалужений або нерозгалужений C₁₋₆алкіл, переважно метил; бензильну групу, необов'язково заміщену галогеном, фенетильну групу, -(CH₂)-циклопропіл; піридинілметильну групу; або R_{7a} і R_{7b} разом з містковим азотом утворюють одну з наступних структур:



R₈ являє собою фенетильну групу; і R_a являє собою фенільну групу, необов'язково заміщену -ОН групою.

10. Сполука за п. 8, яка вибрана з наступної групи: 2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(3-(метиламіно)-1-фенілпропокси)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он; (R)-2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(3-(метиламіно)-1-фенілпропокси)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;

[illegible]

2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(4-((метил(фенетил)аміно)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-(4-(((циклопропілметил)метил)аміно)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-(4-((бензил(метил)аміно)метил)-1Н-піразол-1-іл)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(4-((метил(фенетил)аміно)метил)-1Н-піразол-1-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-(4-((бензил(метил)аміно)метил)-1Н-імідазол-1-іл)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(4-((метил(фенетил)аміно)метил)-1Н-імідазол-1-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-(3-(бензил(метил)аміно)пропокси)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(1-фенетилпіперидин-4-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-(2-(бензил(метил)аміно)етокси)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(2-(метил(фенетил)аміно)етокси)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
9-метил-6-(3-(((1-метил-4-фенілпіперидин-4-іл)окси)метил)феніл)-2-(метилтіо)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(((1-метил-4-фенілпіперидин-4-іл)окси)метил)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-6-(3-(2-(4-(3-гідроксифеніл)піперидин-1-іл)етил)феніл)-9-метил-6-(3-(8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(4-((4-фенілпіперидин-1-іл)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-6-(3-(4-((4-(3-гідроксифеніл)піперидин-1-іл)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(4-(піперидин-1-ілметил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
6-(3-(4-(((циклопропілметил)аміно)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-2-(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-6-(3-(4-(((4-фторбензил)метил)аміно)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(4-((метил(піридин-2-ілметил)аміно)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
2-(етиламіно)-9-метил-6-(3-(4-((метил(піридин-3-ілметил)аміно)метил)-1Н-1,2,3-триазол-1-іл)феніл)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діазепін-5-он;
(S)-8-аміно-1-метил-4-(3-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)феніл)-1,2,3,4-тетрагідро-5Н-піридо[4,3-е][1,4]діазепін-5-он;
(S)-8-аміно-1-метил-4-(4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропокси)бензил)-1,2,3,4-тетрагідро-5Н-піридо[4,3-е][1,4]діазепін-5-он;

[illegible]

[illegible]

(R)-9-метил-6-(4-(3-(метиламіно)-1-фенілпропок-
си)бензил)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діа-
зепін-5-он;

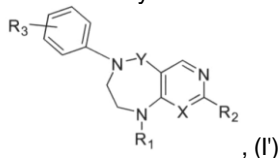
9-метил-6-(4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропок-
си)бензил)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діа-
зепін-5-он;

(S)-9-метил-6-(4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)пропок-
си)бензил)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-е][1,4]діа-
зепін-5-он;

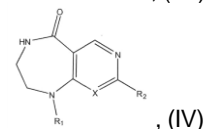
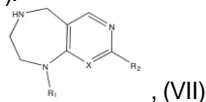
(R)-9-метил-6-(4-(3-(метиламіно)-1-(тіофен-2-іл)про-
пок-си)бензил)-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримідо[4,5-
е][1,4]діазепін-5-он; і

6-(3-(5-((4-(диметиламіно)-4-(3-гідроксифеніл)піпе-
ридин-1-іл)метил)-1,3,4-оксадіазол-2-іл)феніл)-2-
(етиламіно)-9-метил-6,7,8,9-тетрагідро-5Н-піримі-
до[4,5-е][1,4]діазепін-5-он.

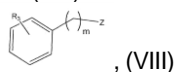
11. Спосіб отримання сполуки загальної формули (I'):



який включає реакцію між сполукою формули (VII)
або формули (IV):

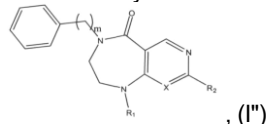


і сполукою формули (VIII):

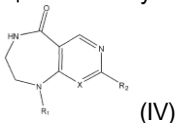


в якій R₁, R₂, R₃, X і Y є такими, як визначено у п. 1, m
дорівнює 0 і Z є придатною відхідною групою.

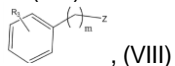
12. Спосіб отримання сполуки загальної формули (I''):



який включає реакцію між сполукою формули (IV):

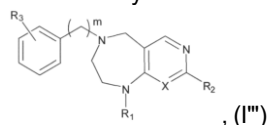


і сполукою формули (VIII):

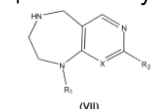


в якій R₁, R₂, R₃ і X є такими, як визначено у п. 1, m
дорівнює 1 або 2 і Z є придатною відхідною групою.

13. Спосіб отримання сполуки загальної формули (I'''):

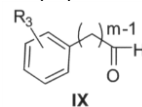


який включає реакцію між сполукою формули (VII):



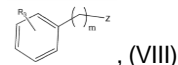
і/або:

а) сполукою формули (IX):



або

б) сполукою формули (VIII):



в якій R₁, R₂, R₃ і X є такими, як визначено у п. 1, m
дорівнює 1 або 2 і Z є придатною відхідною групою.

14. Сполука за будь-яким із пп. 1-10, призначена для
застосування як лікарського засобу.

15. Сполука за будь-яким із пп. 1-10, призначена для
застосування в лікуванні та/або профілактиці захво-
рювань та/або розладів, опосередкованих субоди-
ницею α2δ, особливо субодиницею α2δ-1 потенцій-
но залежних кальцієвих каналів і/або транспортером
норадреналіну (NET).

16. Сполука для застосування за п. 14, де захворю-
ванням або розладом є біль, особливо невропатич-
ний біль, запальний біль та хронічний біль, або стани,
пов'язані з болем, які включають алодинію та/або гі-
пералгезію, депресію, тривогу та дефіцит уваги/роз-
лад гіперактивності (ADHD).

17. Фармацевтична композиція, яка включає сполу-
ку загальної формули (I) за будь-яким із пп. 1-10 або
її фармацевтично прийнятну сіль, або стереоізомер
і щонайменше фармацевтично прийнятний носій, до-
бавку, ад'ювант або наповнювач.

(11) 123793

(51) МПК (2021.01)

C07D 471/04 (2006.01)

C07D 487/04 (2006.01)

C07D 495/04 (2006.01)

A61K 31/519 (2006.01)

A61P 35/00

(21) а 2019 00070

(22) 09.06.2017

(24) 03.06.2021

(31) 16/55387

(32) 10.06.2016

(33) FR

(31) 16/63463

(32) 28.12.2016

(33) FR

(86) PCT/EP2017/064062, 09.06.2017

(72) Котші Андраш (HU), Вебер Чаба (HU), Вашаш Ат-
тіла (HU), Мольнар Балаж (HU), Кішш Арпад (HU),
Маціаш Альба (GB), Мюррей Джеймс Брук (GB),
Левкович Елоді (FR), Генесте Олів'є (FR), Шанріон
Майя (FR), Демерль Дідьє (FR), Іваншиц Ліза (FR)

(73) ЛЕ ЛАБОРАТУАР СЕРВЬЄ

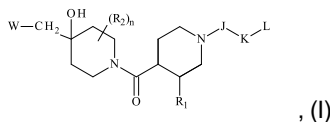
35 rue de Verdun, 92284 Suresnes, France (FR)

ВЕРНАЛІС (АР ЕНД ДІ) ЛІМІТЕД

100 Berkshire Place, Wharfedale Road, Winnersh,
Berkshire RG41 5RD, Great Britain (GB)

(54) НОВІ (ГЕТЕРО)АРИЛ-ЗАМІЩЕНІ ПОХІДНІ ПІПЕ-
РИДИНІЛУ, СПОСІБ ЇХНЬОГО ОДЕРЖАННЯ ТА
ФАРМАЦЕВТИЧНІ КОМПОЗИЦІЇ, ЩО ЇХ МІСТЯТЬ

(57) 1. Сполука формули (I):



де:

R₁ являє собою арильну групу або гетероарильну групу,

R₂ являє собою атом водню або атом галогену,

n являє собою ціле число, що дорівнює 0, 1 або 2,

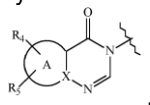
J являє собою -C(O)-групу, -CH(R₃)-групу або -SO₂-групу,

R₃ являє собою атом водню або лінійну або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу,

K являє собою зв'язок або -Су₁-групу,

L являє собою -Су₂ групу або -CH₂-Су₂-групу,

W являє собою групу:



де

A являє собою гетероарильне кільце,

X являє собою атом вуглецю або атом азоту,

R₄ являє собою атом водню, атом галогену, лінійну або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу, лінійну або розгалужену (C₂-C₆)алкенільну групу, лінійну або розгалужену (C₂-C₆)алкінільну групу, -Y₁-NR₆R₇-групу,

-Y₁-OR₆-групу, лінійну або розгалужену гало(C₁-C₆)алкільну групу, оксогрупу, -Y₁-Су₃-групу, -Су₃-R₇-групу, -Су₃-OR₇-групу або -Y₁-NR₆-C(O)-R₇-групу,

R₅ являє собою атом водню, атом галогену або лінійну або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу,

R₆ являє собою атом водню або лінійну або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу,

R₇ являє собою атом водню, лінійну або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу або -Y₂-Су₄-групу,

Y₁ і Y₂ незалежно один від одного являють собою зв'язок або лінійну або розгалужену (C₁-C₄)алкіленову групу,

Су₁ являє собою циклоалкільну групу, гетероциклоалкільну групу, арильну групу або гетероарильну групу, яка зв'язана з групою J і з групою L,

Су₂, Су₃ і Су₄ незалежно один від одного являють собою циклоалкільну групу, гетероциклоалкільну групу, арильну групу або гетероарильну групу,

слід розуміти, що:

"арил" означає фенільну, нафтильну або інданільну групу,

"гетероарил" означає будь-яку моно- або зливу біциклічну групу, що складається з від 5 до 10 членів кільця, має щонайменше один ароматичний фрагмент і містить від 1 до 3 гетероатомів, вибраних із кисню, сірки й азоту,

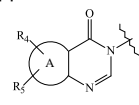
"циклоалкіл" означає будь-яку моно- або зливу біциклічну неароматичну карбоциклічну групу, що містить від 3 до 7 членів кільця,

"гетероциклоалкіл" означає будь-яку неароматичну моно- або зливу біциклічну групу, що містить від 3 до 10 членів кільця і містить від 1 до 3 гетероатомів, вибраних із кисню, сірки й азоту,

при цьому можливо, що арильні, гетероарильні, циклоалкільні та гетероциклоалкільні групи, що визначені таким чином, заміщені від 1 до 4 групами, вибраними з лінійного або розгалуженого (C₁-C₆)алкілу, лінійного або розгалуженого (C₂-C₆)алкенілу, лінійного

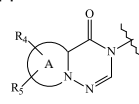
або розгалуженого (C₂-C₆)алкінілу, лінійного або розгалуженого гало(C₁-C₆)алкілу, -Y₁-OR', -Y₁-NR'R'', -Y₁-S(O)_m-R', оксо (або N-оксиду, де доцільно), нітро, ціано, -C(O)-R', -C(O)-OR', -O-C(O)-R', -C(O)-NR'R'', -Y₁-NR'-C(O)-R'', -Y₁-NR'-C(O)-OR'', галогену, циклопропілу та піридинілу, що може бути заміщений лінійною або розгалуженою (C₁-C₆)алкільною групою, слід розуміти, що R' і R'' незалежно один від одного являють собою атом водню, лінійну або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу, лінійну або розгалужену (C₂-C₆)алкенільну групу, лінійну або розгалужену (C₁-C₆)алкоксигрупу, лінійний або розгалужений гало(C₁-C₆)алкіл, лінійну або розгалужену гідроксі(C₁-C₆)алкільну групу, лінійну або розгалужену (C₁-C₆)алкоксі(C₁-C₆)алкільну групу, фенільну групу, циклопропілметильну групу, тетрагідропріранільну групу, або замісники пари (R', R'') утворюють, разом із атомом азоту, що їх несе, неароматичне кільце, що складається із від 5 до 7 членів кільця, яке може містити, на додаток до азоту, другий гетероатом, вибраний із кисню й азоту, причому слід розуміти, що другий азот, що розглядається, може бути заміщений від 1 до 2 групами, що являють собою атом водню, або лінійною або розгалуженою (C₁-C₆)алкільною групою, і слід розуміти, що m являє собою ціле число, що дорівнює 0, 1 або 2, їх енантіомерів, діастереоізомерів і солей приєднання з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

2. Сполуки за п. 1, де W являє собою групу:



де R₄, R₅ та A є такими, як визначено у п. 1.

3. Сполуки за п. 1, де W являє собою групу:



де R₄, R₅ та A є такими, як визначено у п. 1.

4. Сполуки за п. 1, де R₁ являє собою фенільну групу або тієнільну групу.

5. Сполуки за п. 1, де R₂ являє собою атом водню й атом фтору.

6. Сполуки за п. 1, де R₃ являє собою атом водню або метильну групу.

7. Сполуки за п. 1, де J являє собою -C(O)-групу або -CH₂-групу.

8. Сполуки за п. 1, де K являє собою зв'язок або -Су₁-групу, вибрану з фенільної групи, піролільної групи, тієнільної групи, тіазолільної групи, піридинільної групи, тетрагідробензотієнільної групи, дигідротієнодіоксинільної групи, циклопропільної групи, циклобутильної групи або піролідинільної групи.

9. Сполука за п. 1, де L являє собою -Су₂-групу.

10. Сполука за п. 1, де Су₂ являє собою циклоалкільну групу, гетероциклоалкільну групу, арильну групу або гетероарильну групу, які заміщені 1 або 2 групами, вибраними з лінійного або розгалуженого (C₁-C₆)алкілу, лінійного або розгалуженого гало(C₁-C₆)алкілу, -Y₁-OR', -Y₁-NR'R'', N-оксиду, ціано, -C(O)-OR', -C(O)-NR'R'', галогену, в яких R' і R'' незалежно один від одного являють собою атом водню, лінійну або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу, лінійну або розгалужену (C₁-C₆)алкоксигрупу або тетрагідропріра-

нільну групу, або замісники пари (R' , R'') утворюють, разом із атомом азоту, що їх несе, неароматичне кільце, що складається з від 5 до 7 членів кільця, яке може містити, на додаток до азоту, другий гетероатом, що вибраний з кисню й азоту, причому слід розуміти, що другий азот, що розглядається, може бути заміщений лінійною або розгалуженою (C_1 - C_6)алкільною групою.

11. Сполука за п. 1, де K являє собою тієнільну групу, тіазолільну групу або піридинільну групу, а L являє собою піролільну групу, фурильну групу, тієнільну групу, піразолільну групу, піридинільну групу, піримідинільну групу або імідазопіридинільну групу, причому кожна зазначена гетероарильна група може бути заміщена 1 або 2 групами, вибраними з лінійного або розгалуженого (C_1 - C_6)алкілу, лінійного або розгалуженого гало(C_1 - C_6)алкілу, $-Y_1-OR'$, $-Y_1-NR'R''$, N -оксиду, ціано, $-C(O)-NR'R''$, галогену, в яких R' і R'' незалежно один від одного являють собою атом водню, лінійну або розгалужену (C_1 - C_6)алкільну групу, лінійну або розгалужену (C_1 - C_6)алкоксигрупу, лінійну або розгалужену (C_1 - C_6)алкоксі(C_1 - C_6)алкільну групу або тетрагідропіранільну групу, або замісники пари (R' , R'') утворюють, разом із атомом азоту, що їх несе, неароматичне кільце, що складається з від 5 до 7 членів кільця, яке може містити, на додаток до азоту, другий гетероатом, що вибраний з кисню й азоту.

12. Сполуки за п. 1, де K являє собою зв'язок, а L являє собою фенільну групу, тіазолільну групу, оксазолільну групу, ізоксазолільну групу, піразолільну групу, піридинільну групу, піразинільну групу, піридазинільну групу або піримідинільну групу, причому кожна зазначена гетероарильна група може бути заміщена 1 або 2 групами, вибраними з лінійного або розгалуженого (C_1 - C_6)алкілу, $-Y_1-OR'$, $-Y_1-NR'R''$, ціано, $-C(O)-OR'$, галогену, причому слід розуміти, що R' і R'' незалежно один від одного являють собою атом водню, лінійну або розгалужену (C_1 - C_6)алкільну групу, або замісники пари (R' , R'') утворюють, разом із атомом азоту, що їх несе, неароматичне кільце, що складається з від 5 до 7 членів кільця, яке може містити, на додаток до азоту, другий гетероатом, що вибраний з кисню й азоту, причому слід розуміти, що другий азот, що розглядається, може бути заміщений від 1 до 2 групами, що являють собою атом водню, або лінійною або розгалуженою (C_1 - C_6)алкільною групою.

13. Сполуки за п. 1, де R_4 являє собою атом галогену, лінійну або розгалужену (C_1 - C_6)алкільну групу або $-Y_1-Su_3$ -групу.

14. Сполуки за п. 1, де Su_3 являє собою циклоалкільну групу, гетероциклоалкільну групу, арильну групу або гетероарильну групу, які заміщені від 1 до 3 групами, вибраними з лінійного або розгалуженого (C_1 - C_6)алкілу, лінійного або розгалуженого гало(C_1 - C_6)алкілу, $-Y_1-OR'$, $-Y_1-NR'R''$, ціано, галогену, в яких R' і R'' незалежно один від одного являють собою атом водню або лінійну або розгалужену (C_1 - C_6)алкільну групу, або замісники пари (R' , R'') утворюють, разом із атомом азоту, що їх несе, неароматичне кільце, що складається з від 5 до 7 членів кільця, яке може містити, на додаток до азоту, другий гетероатом, що вибраний з кисню й азоту.

15. Сполуки за п. 1, де R_5 являє собою атом водню або метильну групу.

16. Сполуки за п. 1, де R_6 являє собою атом водню або метильну групу.

17. Сполуки за п. 1, де R_7 являє собою атом водню, метильну групу або $-CH_2-Su_4$ -групу.

18. Сполуки за п. 1, які являють собою:

3-[(4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-{[3-метил-5-(піридин-4-іл)тіофен-2-іл]карбоніл}-3-фенілпіперидин-4-іл]карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-метил-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

3-[(1-{[(3R,4R)-1-{[5-(6-амінопіридин-3-іл)-3-фтортіофен-2-іл]карбоніл}-3-фенілпіперидин-4-іл]карбоніл}-4-гідроксипіперидин-4-іл]метил]-7-метил-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

7-циклопропіл-3-[(1-{[(3R,4R)-1-{[3-фтор-5-(піридин-4-іл)тіофен-2-іл]карбоніл}-3-фенілпіперидин-4-іл]карбоніл}-4-гідроксипіперидин-4-іл]метил]-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

3-[(4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-{[4-метил-2-(6-метилпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]карбоніл}-3-фенілпіперидин-4-іл]карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-феніл-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

3-[(1-{[(3R,4R)-1-{[3-фтор-5-(6-метилпіридин-3-іл)тіофен-2-іл]карбоніл}-3-фенілпіперидин-4-іл]карбоніл}-4-гідроксипіперидин-4-іл]метил]-7-феніл-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

3-[(4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-{[2-(6-метилпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]метил}-3-фенілпіперидин-4-іл]карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-феніл-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

3-[(4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-{[4-метил-2-(6-метилпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]карбоніл}-3-фенілпіперидин-4-іл]карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-(піридин-3-іл)-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

3-[(4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-{[4-метил-2-(6-метилпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]карбоніл}-3-фенілпіперидин-4-іл]карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-(тіофен-3-іл)-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

3-[(4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-{[4-метил-2-(6-метилпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]карбоніл}-3-фенілпіперидин-4-іл]карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-(нафтален-2-іл)-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

7-(4-хлорфеніл)-3-[(4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-{[4-метил-2-(6-метилпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]карбоніл}-3-фенілпіперидин-4-іл]карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

3-[(4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-{[4-метил-2-(6-метилпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]карбоніл}-3-фенілпіперидин-4-іл]карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-(4-метоксифеніл)-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

3-[(4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-{[4-метил-2-(6-метилпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]карбоніл}-3-фенілпіперидин-4-іл]карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-(3-метилфеніл)-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

3-[(4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-{[4-метил-2-(6-метилпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]карбоніл}-3-фенілпіперидин-4-іл]карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-(4-метилфеніл)-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

7-(3-хлорфеніл)-3-[(4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-{[4-метил-2-(6-метилпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]карбоніл}-3-фенілпіперидин-4-іл]карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

7-(фуран-3-іл)-3-[(4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-{[4-метил-2-(6-метилпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]карбоніл}-3-

[illegible]

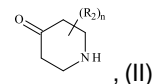
[illegible]

[illegible]

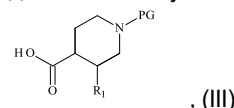
роксипіридин-1-іл)карбоніл]-3-фенілпіперидин-1-іл]метил]-1,3-тіазол-2-іл]піридин-2-карбонітрил;
5-[5-(((3R,4R)-4-[(4-гідрокси-4-[[7-(4-метоксифеніл)-4-оксо-4,7-дигідро-3H-піроло[2,3-d]піримідин-3-іл]метил]піперидин-1-іл)карбоніл]-3-фенілпіперидин-1-іл]метил)-1,3-тіазол-2-іл]піридин-2-карбонітрил;
3-[[4-гідрокси-1-(((3R,4R)-1-[[4-метил-2-(морфолін-4-іл)-1,3-тіазол-5-іл]карбоніл]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл)метил]-7-феніл-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
3-[[4-гідрокси-1-(((3R,4R)-1-{{2-[6-(2-метоксіетокси)піридин-3-іл]-1,3-тіазол-5-іл]метил}-3-фенілпіперидин-4-іл]карбоніл]піперидин-4-іл)метил]-7-феніл-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
3-[[4-гідрокси-1-(((3R,4R)-1-[[2-(4-метилпіперазин-1-іл)-1,3-тіазол-5-іл]метил]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл)метил]-7-феніл-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
3-[[4-гідрокси-1-(((3R,4R)-1-[[2-(6-гідроксипіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]метил]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл)метил]-7-(3-гідроксифеніл)-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
3-[[4-гідрокси-1-(((3R,4R)-1-[[4-метил-1,3-тіазол-5-іл)карбоніл]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-феніл-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
3-[[4-гідрокси-1-(((3R,4R)-1-[[2-(метил-1,3-тіазол-5-іл)карбоніл]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл)метил]-7-феніл-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
3-[[1-(((3R,4R)-1-[[2-хлор-1,3-тіазол-5-іл)карбоніл]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]-4-гідроксипіперидин-4-іл]метил]-7-феніл-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
3-[[4-гідрокси-1-(((3R,4R)-3-феніл-1-(піразин-2-ілметил)піперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл)метил]-7-феніл-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
3-[[4-гідрокси-1-(((3R,4R)-3-феніл-1-(1,3-тіазол-5-ілметил)піперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл)метил]-7-феніл-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
5-[5-(((3R,4R)-4-[(4-[[7-(4-фторфеніл)-4-оксо-4,7-дигідро-3H-піроло[2,3-d]піримідин-3-іл]метил]-4-гідроксипіперидин-1-іл)карбоніл]-3-фенілпіперидин-1-іл]метил)-1,3-тіазол-5-іл]піридин-2-карбонітрил;
метил 3-[[[(3R,4R)-4-{{(4-гідроксі-4-[[4-оксо-7-феніл-4,7-дигідро-3H-піроло[2,3-d]піримідин-3-іл]метил]піперидин-1-іл)карбоніл]-3-фенілпіперидин-1-іл)карбоніл]бензоат;
5-[[4-гідрокси-1-(((3R,4R)-1-[[2-(6-метилпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]метил]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл)метил]-1-(4-метоксифеніл)-1,5-дигідро-4H-піразоло[3,4-d]піримідин-4-он;
5-[[4-гідрокси-1-(((3R,4R)-1-[[2-(6-метоксипіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]метил]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл)метил]-1-(4-метоксифеніл)-1,5-дигідро-4H-піразоло[3,4-d]піримідин-4-он;
5-[[4-гідрокси-1-(((3R,4R)-1-[[4-метил-2-(6-метилпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл]карбоніл]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл)метил]-1-(4-метоксифеніл)-1,5-дигідро-4H-піразоло[3,4-d]піримідин-4-он;
3-[[4-гідрокси-1-(((3R,4R)-1-[[2-[6-((2-метоксіетил)аміно)піридин-3-іл]-1,3-тіазол-5-іл]метил]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл)метил]-7-феніл-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

3-[[4-гідрокси-1-((3R,4R)-1-[(1-метил-1H-піразол-4-іл)метил]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-(4-метоксифеніл)-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-((3R,4R)-3-феніл-1-(піразин-2-ілметил)піперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-(4-метоксифеніл)-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-((3R,4R)-1-[(5-метил-1,3-тіазол-2-іл)метил]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-(4-метоксифеніл)-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[[1-((3R,4R)-1-[(5-бромпіридин-3-іл)метил]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]-4-гідроксипіперидин-4-іл]метил]-7-(4-метоксифеніл)-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 метил 5-[[[(3R,4R)-4-[(4-гідроксі-4-[(4-оксо-7-феніл-4,7-дигідро-3H-піроло[2,3-d]піримідин-3-іл)метил]піперидин-1-іл)карбоніл]-3-фенілпіперидин-1-іл)карбоніл]піридин-3-карбоксилат;
 1-(2,3-дигідро-1,4-бензодіоксин-6-іл)-5-[(4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(4-метил-2-(6-метилпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл)карбоніл]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл)метил]-1,5-дигідро-4H-піразоло[3,4-d]піримідин-4-он;
 1-(2,3-дигідро-1,4-бензодіоксин-6-іл)-5-[(4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(2-(6-метилпіридин-3-іл)-1,3-тіазол-5-іл)метил]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл)метил]-1,5-дигідро-4H-піразоло[3,4-d]піримідин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-((3R,4R)-1-[(5-метил-1,3-тіазол-2-іл)метил]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-феніл-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-((3R,4R)-1-[(3-метил-1,2-оксазол-5-іл)метил]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-феніл-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[[1-((3R,4R)-1-[(2,4-диметил-1,3-тіазол-5-іл)метил]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]-4-гідроксипіперидин-4-іл]метил]-7-(4-метоксифеніл)-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[(4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-(1,3-оксазол-4-іл)метил]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл)метил]-7-(4-метоксифеніл)-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-((3R,4R)-1-[(5-метил-1,3-оксазол-2-іл)метил]-3-фенілпіперидин-4-іл)карбоніл]піперидин-4-іл]метил]-7-(4-метоксифеніл)-3,7-дигідро-4H-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 5-[[[(3R,4R)-4-[(4-гідроксі-4-[(4-оксо-7-феніл-4,7-дигідро-3H-піроло[2,3-d]піримідин-3-іл)метил]піперидин-1-іл)карбоніл]-3-фенілпіперидин-1-іл]метил]піридин-2-карбонітрил;
 3-[[4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(4-метил-2-(6-метил-3-піридил)тіазол-5-карбоніл]-3-феніл-піперидин-4-карбоніл]-4-піперидил]метил]-7-[4-(гідроксиметил)феніл]піроло[2,1-f][1,2,4]тріазин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(4-метил-2-(6-метил-3-піридил)тіазол-5-карбоніл]-3-феніл-піперидин-4-карбоніл]-4-піперидил]метил]-7-[4-(гідроксиметил)феніл]тієно[3,4-f]піримідин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(2-(6-метил-3-піридил)тіазол-5-карбоніл]-3-феніл-піперидин-4-карбоніл]-4-піперидил]метил]-7-(3-метоксифеніл)піроло[2,3-d]піримідин-4-он;

3-[[3,3-дифтор-4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(4-метил-2-(6-метил-3-піридил)тіазол-5-карбоніл]-3-феніл-піперидин-4-карбоніл]-4-піперидил]метил]-7-феніл-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[[3,3-дифтор-4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(4-метил-2-(6-метил-3-піридил)тіазол-5-карбоніл]-3-феніл-піперидин-4-карбоніл]-4-піперидил]метил]-7-(4-метоксифеніл)піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(2-метоксипіримідин-4-іл)метил]-3-феніл-піперидин-4-карбоніл]-4-піперидил]метил]-7-феніл-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(2-метоксипіримідин-4-іл)метил]-3-феніл-піперидин-4-карбоніл]-4-піперидил]метил]-7-(4-метоксифеніл)піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(5-метилпіразин-2-іл)метил]-3-феніл-піперидин-4-карбоніл]-4-піперидил]метил]-7-феніл-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(5-метилпіразин-2-іл)метил]-3-феніл-піперидин-4-карбоніл]-4-піперидил]метил]-7-(4-метоксифеніл)піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(2-метилпіримідин-4-іл)метил]-3-феніл-піперидин-4-карбоніл]-4-піперидил]метил]-7-феніл-піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(2-метилпіримідин-4-іл)метил]-3-феніл-піперидин-4-карбоніл]-4-піперидил]метил]-7-(4-метоксифеніл)піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(6-метоксипіридазин-3-іл)метил]-3-феніл-піперидин-4-карбоніл]-4-піперидил]метил]-7-(4-метоксифеніл)піроло[2,3-d]піримідин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(5-метилпіразин-2-іл)метил]-3-феніл-піперидин-4-карбоніл]-4-піперидил]метил]-7-феніл-тієно[3,4-d]піримідин-4-он;
 3-[[4-гідрокси-1-[(3R,4R)-1-[(2-метилпіримідин-4-іл)метил]-3-феніл-піперидин-4-карбоніл]-4-піперидил]метил]-7-феніл-тієно[3,4-d]піримідин-4-он.
 19. Спосіб одержання сполуки формули (I) за п. 1, який **відрізняється** тим, що як вихідний матеріал використовують сполуку формули (II):

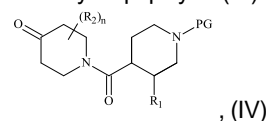


де R_2 та n є такими, як визначено для формули (I), яку піддають з'єднанню зі сполукою формули (III):



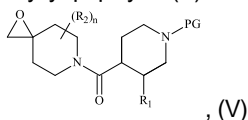
де R_1 є таким, як визначено для формули (I), а PG являє собою захисну групу функціональної аміногрупи,

для одержання сполуки формули (IV):

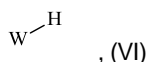


де R_1 , R_2 , n та PG є такими, як визначено у даному документі вище,

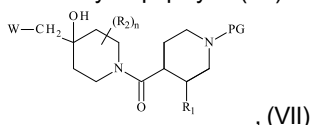
при цьому сполуку формули (IV) далі перетворюють в епоксидну сполуку формули (V):



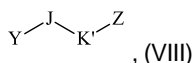
де R_1 , R_2 , n та PG є такими, як визначено у даному документі вище, при цьому сполуку формули (V) далі піддають з'єднанню зі сполукою формули (VI):



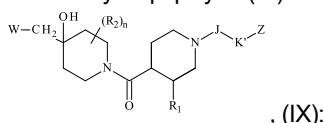
де W є таким, як визначено для формули (I), для одержання сполуку формули (VII):



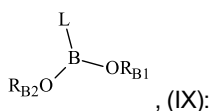
де R_1 , R_2 , n , W та PG є такими, як визначено у даному документі вище, при цьому сполуку формули (VII) після реакції для видалення захисної групи PG далі піддають: або з'єднанню зі сполукою формули (VIII):



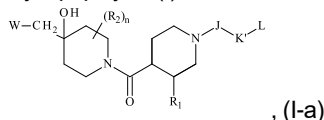
де J є таким, як визначено у формулі (I), K являє собою - CH_2 -групу, Y являє собою гідроксигрупу або атом галогену, а Z являє собою атом галогену, для одержання сполуку формули (IX):



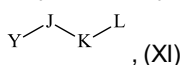
де R_1 , R_2 , J, K', n, W та Z є такими, як визначено у даному документі вище, при цьому сполуку формули (IX) далі піддають з'єднанню зі сполукою формули (X):



де L є таким, як визначено для формули (I), а R_{B1} та R_{B2} являють собою атом водню, лінійну або розгалужену (C_1 - C_6)алкілну групу, або R_{B1} та R_{B2} зв'язані разом за допомогою лінійною або розгалуженої (C_2 - C_6)алкіленової групи, для одержання сполуку формули (I-a), окремого випадку сполук формули (I):



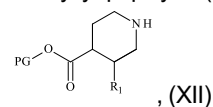
де R_1 , R_2 , J, K', L, n та W є такими, як визначено у даному документі вище, або з'єднанню зі сполукою формули (XI):



де J, K та L є такими, як визначено у формулі (I), а Y являє собою гідроксигрупу або атом галогену, для одержання сполуку формули (I), сполука формули (I) або сполука формули (I-a), яка являє собою окремий випадок сполуку формули (I),

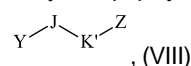
потім може бути очищена згідно із традиційною технологією відокремлення, при цьому за бажанням її перетворюють в її солі приєднання з фармацевтично прийнятною кислотою або основою, та її необхідно відокремлюють на її ізомери згідно із традиційною технологією відокремлення, при цьому слід розуміти, що у будь-який момент, що розглядається прийнятним в ході описаного вище способу, деякі групи (гідрокси, аміно...) вихідних реагентів або проміжні сполуки синтезу можуть бути захищені, з них потім можуть бути зняті захисні групи та вони можуть бути функціоналізовані, як того потребує синтез.

20. Спосіб одержання сполуку формули (I) за п. 1, який **відрізняється** тим, що як вихідний матеріал використовують сполуку формули (XII):

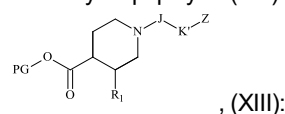


де R_1 є таким, як визначено для формули (I), а PG являє собою захисну групу функціональної групи карбонової кислоти, яку піддають:

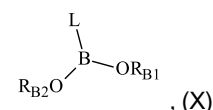
або з'єднанню зі сполукою формули (VIII):



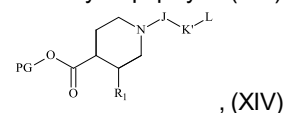
де J є таким, як визначено у формулі (I), K являє собою - CH_2 -групу, Y являє собою гідроксигрупу або атом галогену, а Z являє собою атом галогену, для одержання сполуку формули (XIII):



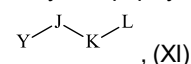
де R_1 , J, K', Z та PG є такими, як визначено у даному документі вище, при цьому сполуку формули (XIII) далі піддають з'єднанню зі сполукою формули (X):



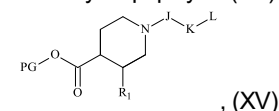
де L є таким, як визначено для формули (I), а R_{B1} та R_{B2} являють собою атом водню, лінійну або розгалужену (C_1 - C_6)алкілну групу, або R_{B1} та R_{B2} зв'язані разом за допомогою лінійною або розгалуженої (C_2 - C_6)алкіленової групи, для одержання сполуку формули (XIV):



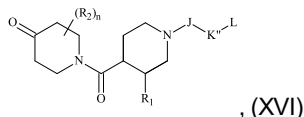
де R_1 , J, K', L та PG є такими, як визначено у даному документі вище, або з'єднанню зі сполукою формули (XI):



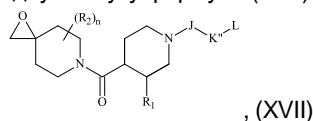
де J, K та L є такими, як визначено у формулі (I), а Y являє собою гідроксигрупу або атом галогену, для одержання сполуку формули (XV):



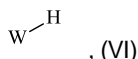
де R_1 , J , K , L та PG є такими, як визначено у даному документі вище, при цьому сполуки формули (XIV) і (XV), після реакції видалення захисної групи PG , далі піддають з'єднанню зі сполукою формули (II), для одержання сполуки формули (XVI):



де R_1 , R_2 , J , L та n є такими, як визначено у даному документі вище, а K^n являє собою K' або K , як визначено у даному документі вище, при цьому сполуку формули (XVI) далі перетворюють в епоксидну сполуку формули (XVII):



де R_1 , R_2 , J , K^n , L та n є такими, як визначено у даному документі вище, при цьому сполуку формули (XVII) далі піддають з'єднанню зі сполукою формули (VI):



де W є таким, як визначено для формули (I), для одержання сполуки формули (I), яка може бути очищена згідно із традиційною технологією відокремлення, при цьому за бажанням її перетворюють в її солі приєднання з фармацевтично прийнятною кислотою або основою, та її необов'язково відокремлюють на її ізомери згідно із традиційною технологією відокремлення, при цьому слід розуміти, що у будь-який момент, що розглядається прийнятним в ході описаного вище способу, деякі групи (гідрокси, аміно...) вихідних реагентів або проміжні сполуки синтезу можуть бути захищені, з них потім можуть бути зняті захисні групи та вони можуть бути функціоналізовані, як того потребує синтез.

21. Фармацевтична композиція, що містить сполуку формули (I) за будь-яким з пп. 1-18 або її солі приєднання з фармацевтично прийнятною кислотою або основою у комбінації з однією або більше фармацевтично прийнятними допоміжними речовинами.

22. Фармацевтична композиція за п. 21 для застосування як проапоптозних та/або антипроліферативних засобів.

23. Фармацевтична композиція за п. 22 для застосування в лікуванні раку й аутоімунних захворювань і захворювань імунної системи.

24. Фармацевтична композиція за п. 23 для застосування в лікуванні раку сечового міхура, головного мозку, молочної залози й матки, хронічної лімфоїдної лейкемії, раку товстої кишки, стравоходу та печінки, лімфобластної лейкемії, гострої мієлоїдної лейкемії, лімфом, меланом, злоякісних гемопатій, мієлом, раку яєчників, недрібноклітинного раку легенів, раку простати, раку підшлункової залози та дрібноклітинного раку легенів.

25. Застосування фармацевтичної композиції за п. 21 у виробництві лікарських засобів для застосування як проапоптозних та/або антипроліферативних засобів.

26. Застосування фармацевтичної композиції за п. 21 у виробництві лікарських засобів для застосування в лікуванні раку сечового міхура, головного мозку, молочної залози й матки, хронічної лімфоїдної лейкемії, раку товстої кишки, стравоходу та печінки, лімфобластної лейкемії, гострої мієлоїдної лейкемії, лімфом, меланом, злоякісних гемопатій, мієлом, раку яєчників, недрібноклітинного раку легенів, раку простати, раку підшлункової залози та дрібноклітинного раку легенів.

27. Застосування фармацевтичної композиції за п. 21 у виробництві лікарських засобів для застосування в лікуванні раку сечового міхура, головного мозку, молочної залози й матки, хронічної лімфоїдної лейкемії, раку товстої кишки, стравоходу та печінки, лімфобластної лейкемії, гострої мієлоїдної лейкемії, лімфом, меланом, злоякісних гемопатій, мієлом, раку яєчників, недрібноклітинного раку легенів, раку простати, раку підшлункової залози та дрібноклітинного раку легенів.

28. Сполука формули (I) за будь-яким із пп. 1-18 або її солі приєднання з фармацевтично прийнятною кислотою або основою для застосування в лікуванні раку сечового міхура, головного мозку, молочної залози й матки, хронічної лімфоїдної лейкемії, раку товстої кишки, стравоходу та печінки, лімфобластної лейкемії, гострої мієлоїдної лейкемії, лімфом, меланом, злоякісних гемопатій, мієлом, раку яєчників, недрібноклітинного раку легенів, раку простати, раку підшлункової залози та дрібноклітинного раку легенів.

29. Застосування сполуки формули (I) за будь-яким із пп. 1-18 або її солі приєднання з фармацевтично прийнятною кислотою або основою у виробництві лікарських засобів для застосування в лікуванні раку сечового міхура, головного мозку, молочної залози й матки, хронічної лімфоїдної лейкемії, раку товстої кишки, стравоходу та печінки, лімфобластної лейкемії, гострої мієлоїдної лейкемії, лімфом, меланом, злоякісних гемопатій, мієлом, раку яєчників, недрібноклітинного раку легенів, раку простати, раку підшлункової залози та дрібноклітинного раку легенів.

30. Комбінація сполуки формули (I) за будь-яким із пп. 1-18 з протираковими засобами, вибраними з генотоксичних засобів, мітотичних отрут, антиметаболітів, інгібіторів протеасом, інгібіторів кінрази, інгібіторів взаємодії білок-білок, імуномодуляторів, інгібіторів Е3-лігази, Т-клітинної терапії химерним антигеном рецептором та антитілами.

31. Фармацевтична композиція, що містить комбінацію за п. 30 у комбінації з однією або більше фармацевтично прийнятними допоміжними речовинами.

32. Комбінація за п. 30 для застосування в лікуванні раку.

33. Застосування комбінації за п. 30 у виробництві лікарських засобів для застосування в лікуванні раку.

34. Сполука формули (I) за будь-яким із пп. 1-18 для застосування в лікуванні раку, що потребує радіаційної терапії.

(11) 123781

(51) МПК
C07D 487/04 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 31/12 (2006.01)

(21) а 2018 09085
(24) 03.06.2021
(31) 201610082030.0
(32) 05.02.2016

(22) 04.02.2017

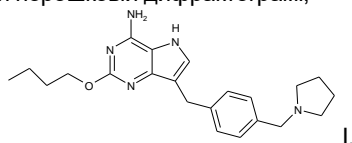
(33) CN

(86) PCT/CN2017/072890, 04.02.2017

(72) Дін Чжаочжун (CN), Сунь Фей (CN), Ху Інху (CN), Чжоу Ілун (CN), Ван Чжен (CN), Ян Лін (CN)

(73) ЧІА ТАЙ ТЯНЦІН ФАРМАСЬЮТИКАЛ ГРУП КО., ЛТД. No.369 Yuzhou South Rd., Haizhou District, Lianyungang, Jiangsu 222062, China (CN)

(54) МАЛЕАТНА СІЛЬ АГОНІСТА TLR7, ЇЇ КРИСТАЛІЧНІ ФОРМИ С, D І Е, СПОСОБИ ОДЕРЖАННЯ І ЗАС-ТОСУВАННЯ МАЛЕАТНОЇ СОЛІ І КРИСТАЛІЧНИХ ФОРМ

(57) 1. Кристалічна форма С малеату сполуки формули I, яка **відрізняється** тим, що кристалічна форма С має дифракційні піки при $2\theta=7,6^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $9,9^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $17,8^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $22,8^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $24,2^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $26,3^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$ на рентгенівській порошковій дифрактограмі,

2. Кристалічна форма С за п. 1, яка **відрізняється** тим, що кристалічна форма С має дифракційні піки при $2\theta=5,6^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $7,6^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $9,9^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $17,8^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $19,8^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $22,8^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $24,2^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $25,0^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $26,3^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$ на рентгенівській порошковій дифрактограмі,

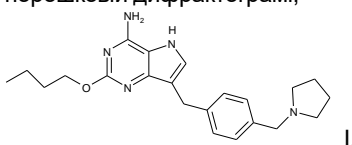
наприклад, кристалічна форма С має дифракційні піки при $2\theta=5,6^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $6,0^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $7,6^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $9,9^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $12,0^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $15,3^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $17,8^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $18,5^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $19,8^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $20,4^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $22,8^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $23,1^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $24,2^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $24,7^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $25,0^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $26,3^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$ на рентгенівській порошковій дифрактограмі, наприклад, кристалічна форма С має рентгенівську порошкову дифрактограму, по суті таку, як показано на Фіг. 1.

3. Спосіб одержання кристалічної форми С за п. 1 або 2, який включає наступні стадії:

- 1) розчинення сполуки формули I у розчиннику, який переважно нагрівають для сприяння розчиненню;
- 2) додавання малеїнової кислоти; і
- 3) охолодження для кристалізації, фільтрування, промивання та сушіння для одержання кристалічної форми С,

де розчинник вибирають із групи, що складається з метанолу, етанолу, пропанолу, ізопропанолу, н-бутанолу, ізобутанолу, третинного бутанолу, ацетону, етилацетату і їхнього змішаного розчинника, переважним є етанол.

4. Кристалічна форма D малеату сполуки формули I, яка **відрізняється** тим, що кристалічна форма D має дифракційні піки при $2\theta=5,1^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $9,5^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $11,2^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $17,6^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $20,2^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $23,0^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$ на рентгенівській порошковій дифрактограмі,



5. Кристалічна форма D за п. 4, яка **відрізняється** тим, що кристалічна форма D має дифракційні піки при $2\theta=5,1^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $9,5^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $11,2^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $17,6^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $20,2^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $20,7^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $23,0^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $23,7^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$ на рентгенівській порошковій дифрактограмі,

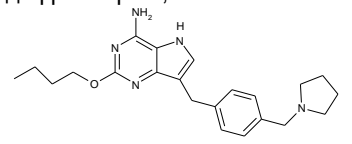
наприклад, кристалічна форма D має дифракційні піки при $2\theta=5,1^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $5,6^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $9,5^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $11,2^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $16,9^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $17,6^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $20,2^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $20,7^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $22,6^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $23,0^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $23,7^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $24,5^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$ на рентгенівській порошковій дифрактограмі,

наприклад, кристалічна форма D має рентгенівську порошкову дифрактограму, по суті таку, як показано на Фіг. 2.

6. Спосіб одержання кристалічної форми D за п. 4 або 5, який включає наступні стадії:

- 1) розміщення кристалічної форми С малеату сполуки формули I за п. 1 або 2 у розчиннику ацетоні для того, щоб формувати суспензію;
- 2) струшування при постійній температурі; і
- 3) центрифугування, промивання та сушіння для одержання кристалічної форми D.

7. Кристалічна форма E малеату сполуки формули I, яка **відрізняється** тим, що кристалічна форма E має дифракційні піки при $2\theta=4,9^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $5,3^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $9,0^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $16,5^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $19,3^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$ на рентгенівській порошковій дифрактограмі,



8. Кристалічна форма E за п. 7, яка **відрізняється** тим, що кристалічна форма E має дифракційні піки при $2\theta=4,9^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $5,3^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $6,7^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $9,0^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $10,8^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $16,5^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $19,3^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$ на рентгенівській порошковій дифрактограмі,

наприклад, кристалічна форма E має дифракційні піки при $2\theta=4,9^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $5,3^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $6,7^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $9,0^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $10,8^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $16,2^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $16,5^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $19,3^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $22,0^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $22,6^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$, $25,9^{\circ}\pm 0,2^{\circ}$ на рентгенівській порошковій дифрактограмі,

наприклад, кристалічна форма E має рентгенівську порошкову дифрактограму, по суті таку, як показано на Фіг. 3.

9. Спосіб одержання кристалічної форми E за п. 7 або 8, який включає наступні стадії:

- 1) розміщення кристалічної форми С малеату сполуки формули I за п. 1 або 2 у розчиннику ізопропанолі для того, щоб формувати суспензію;
- 2) струшування при постійній температурі; і
- 3) центрифугування, промивання та сушіння для одержання кристалічної форми E.

10. Кристалічна композиція, яка **відрізняється** тим, що, у розрахунку на масу кристалічної композиції, кристалічна форма С за п. 1 або 2 становить 50 % або більше, переважно 80 % або більше, більш переважно 90 % або більше і найбільш переважно 95 % або більше; або

у розрахунку на масу кристалічної композиції, кристалічна форма D за п. 4 або 5 становить 50 % або більше, переважно 80 % або більше, більш переважно 90 % або більше і найбільш переважно 95 % або більше; або

у розрахунку на масу кристалічної композиції, кристалічна форма E за п. 7 або 8 становить 50 % або більше, переважно 80 % або більше, більш переважно 90 % або більше і найбільш переважно 95 % або більше.

11. Фармацевтична композиція, яка **відрізняється** тим, що вона містить кристалічну форму С за п. 1 або 2, кристалічну форму D за п. 4 або 5, кристалічну форму E за п. 7 або 8 або кристалічну композицію за п. 10 або будь-яку їхню комбінацію у ефективній кількості.

12. Застосування кристалічної форми С за п. 1 або 2, кристалічної форми D за п. 4 або 5, кристалічної форми E за п. 7 або 8, кристалічної композиції за п. 10 або фармацевтичної композиції за п. 11 для виготовлення лікарського засобу для лікування асоційованого з Toll-подібним рецептором 7 захворювання.

13. Застосування за п. 12, яке **відрізняється** тим, що асоційоване з Toll-подібним рецептором 7 захворювання являє собою вірусну інфекцію, наприклад, асоційоване з Toll-подібним рецептором 7 захворювання являє собою інфекцію вірусу гепатиту В або гепатиту С.

(11) 123785

(51) МПК (2021.01)

C07D 487/04 (2006.01)

A61P 35/00

A61K 31/519 (2006.01)

(21) а 2018 10566

(22) 27.03.2017

(24) 03.06.2021

(31) 62/314,066

(32) 28.03.2016

(33) US

(31) 62/362,934

(32) 15.07.2016

(33) US

(31) 62/438,750

(32) 23.12.2016

(33) US

(86) PCT/US2017/024270, 27.03.2017

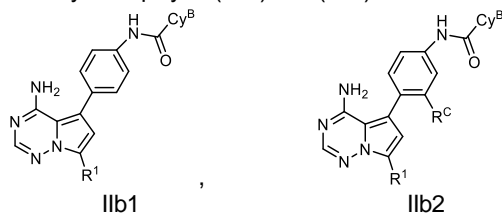
(72) Лі Юнь-Лун (US), Ван Сяочжао (US), Барбоса Джозеф (US), Бернс Девід М. (US), Фен Хао (US), Гленн Джозеф (US), Хе Чуньхун (US), Хуан Тайшен (US), Мей Сун (US), Чжо Цзиньцун (US)

(73) ІНСАЙТ КОРПОРЕЙШН

1801 Augustine Cut-Off, Wilmington, Delaware 19803, United States of America (US)

(54) СПОЛУКИ ПІРОЛОТРИАЗИНУ ЯК ІНГІБІТОРИ ТАМ

(57) 1. Сполука Формули (Iib1) або (Iib2):



або її фармацевтично прийнятна сіль, де:

R¹ являє собою A¹-A²-A³-R^A;

A¹ вибраний зі зв'язку, Су^{A1}, -Y-, -C₁-залкілен-, -C₁-залкілен-Y-, -Y-C₁-залкілен- і -C₁-залкілен-Y-C₁-залкілен-; причому вказані алкіленові групи, кожна, необов'язково заміщені 1, 2 або 3 замісниками, незалежно вибраними з галогену, CN, OH, C₁-залкілу, C₁-залкокси, C₁-галогеналкілу, C₁-галогеналкокси, аміно, C₁-залкіламіно і ді(C₁-залкіл)аміно;

A² вибраний зі зв'язку, Су^{A2}, -Y-, -C₁-залкілен-, -C₁-залкілен-Y-, -Y-C₁-залкілен- і -C₁-залкілен-Y-C₁-залкілен-; причому вказані алкіленові групи, кожна, необов'язково заміщені 1, 2 або 3 замісниками, незалежно вибраними з галогену, CN, OH, C₁-залкілу, C₁-залкокси, C₁-галогеналкілу, C₁-галогеналкокси, аміно, C₁-залкіламіно і ді(C₁-залкіл)аміно;

A³ вибраний зі зв'язку, Су^{A3}, -Y-, -C₁-залкілен-, -C₁-залкілен-Y-, -Y-C₁-залкілен- і -C₁-залкілен-Y-C₁-залкілен-; причому вказані алкіленові групи, кожна, необов'язково заміщені 1, 2 або 3 замісниками, незалежно вибраними з галогену, CN, OH, C₁-залкілу, C₁-залкокси, C₁-галогеналкілу, C₁-галогеналкокси, аміно, C₁-залкіламіно і ді(C₁-залкіл)аміно;

R^A являє собою H, C₁-галкіл, C₁-галогеналкіл, галоген, CN, NO₂, OR^{A1}, SR^{A1}, C(O)R^{b1}, C(O)NR^{c1}R^{d1}, C(O)OR^{a1}, OC(O)R^{b1}, OC(O)NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}OR^{d1}, NR^{c1}C(O)R^{b1}, NR^{c1}C(O)OR^{a1}, NR^{c1}C(O)NR^{c1}R^{d1}, C(=NR^{e1})R^{b1}, C(=NR^{e1})NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}C(=NR^{e1})NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}S(O)R^{b1}, NR^{c1}S(O)₂R^{b1}, NR^{c1}S(O)₂NR^{c1}R^{d1}, S(O)R^{b1}, S(O)NR^{c1}R^{d1}, S(O)₂R^{b1} або S(O)₂NR^{c1}R^{d1}; де вказаний C₁-галкіл або C₁-галогеналкіл необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R¹¹;

Y являє собою O, S, S(O), S(O)₂, C(O), C(O)NR^f, NR^fC(O), NR^fC(O)NR^f, NR^fS(O)₂NR^f, S(O)₂NR^f, NR^fS(O)₂ або NR^f;

кожен R^f незалежно вибраний з H і C₁-залкілу;

Су^{A1} являє собою C₃-циклоалкіл, феніл, 5-6-членний гетероарил або 4-7-членний гетероциклоалкіл; причому кожен 5-6-членний гетероарил і 4-7-членний гетероциклоалкіл має щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю і 1, 2, 3 або 4 утворюючі цикл гетероатоми, які незалежно вибрані з N, O і S; де N і S необов'язково окиснені; при тому, що утворюючий цикл атом вуглецю C₃-циклоалкілу і 4-7-членного гетероциклоалкілу необов'язково заміщений оксо з утворенням карбонільної групи; і при цьому C₃-циклоалкіл, феніл, 5-6-членний гетероарил і 4-7-членний гетероциклоалкіл, кожен, необов'язково заміщені 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^{A1};

кожен R^{A1} незалежно вибраний з OH, NO₂, CN, галогену, C₁-галкілу, C₁-галогеналкілу, C₁-галкокси, C₁-галогеналкокси, ціано-C₁-залкілу, HO-C₁-залкілу, H₂N-C₁-залкілу, аміно, C₁-галкіламіно, ді(C₁-галкіл)аміно, тіо, C₁-галкілтіо, C₁-галкілсульфінілу, C₁-галкілсульфонілу, карбамілу, C₁-галкілкарбамілу, ді(C₁-галкіл)карбамілу, карбокси, C₁-галкілкарбонілу, C₁-галкоксикарбонілу, C₁-галкілкарбоніламіно, C₁-галкілсульфоніламіно, аміносурьфонілу, C₁-галкіламіносурьфонілу, ді(C₁-галкіл)аміносурьфонілу, аміносурьфоніламіно, C₁-галкіламіносурьфоніламіно, ді(C₁-галкіл)аміносурьфоніламіно, амінокарбоніламіно, C₁-галкіламінокарбоніламіно і ді(C₁-галкіл)амінокарбоніламіно; Су^{A2} являє собою C₃-циклоалкіл, феніл, 5-6-членний гетероарил або 4-7-членний гетероциклоалкіл; причому кожен 5-6-членний гетероарил і 4-7-членний гетероциклоалкіл має щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю і 1, 2, 3 або 4 утворюючі цикл гетероатоми, які незалежно вибрані з N, O і S; де N і S необов'язково окиснені; при тому, що утворюючий цикл атом вуглецю C₃-циклоалкілу і 4-7-членного гетероциклоалкілу необов'язково заміщений оксо з утворенням карбонільної групи; і при цьому

му С₃₋₇-циклоалкіл, феніл, 5-6-членний гетероарил і 4-7-членний гетероциклоалкіл, кожен, необов'язково заміщені 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^{A2};

кожен R^{A2} незалежно вибраний з OH, NO₂, CN, галогену, С₁₋₆алкілу, С₁₋₆галогеналкілу, С₁₋₆алкокси, С₁₋₆галогеналкокси, ціано-С₁₋₃алкілу, HO-С₁₋₃алкілу, H₂N-С₁₋₃алкілу, аміно, С₁₋₆алкіламіно, ді(С₁₋₆алкіл)аміно, тіо, С₁₋₆алкілтіо, С₁₋₆алкілсульфінілу, С₁₋₆алкілсульфонілу, карбамілу, С₁₋₆алкілкарбамілу, ді(С₁₋₆алкіл)карбамілу, карбокси, С₁₋₆алкілкарбонілу, С₁₋₆алкоксикарбонілу, С₁₋₆алкілкарбоніламіно, С₁₋₆алкілсульфоніламіно, аміносульфонілу, С₁₋₆алкіламіносульфонілу, ді(С₁₋₆алкіл)аміносульфонілу, аміносульфоніламіно, С₁₋₆алкіламіносульфоніламіно, ді(С₁₋₆алкіл)аміносульфоніламіно, амінокарбоніламіно, С₁₋₆алкіламінокарбоніламіно і ді(С₁₋₆алкіл)амінокарбоніламіно;

Су^{A3} являє собою С₃₋₇-циклоалкіл, феніл, 5-6-членний гетероарил або 4-7-членний гетероциклоалкіл; причому кожен 5-6-членний гетероарил і 4-7-членний гетероциклоалкіл має щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю і 1, 2, 3 або 4 утворюючі цикл гетероатоми, які незалежно вибрані з N, O і S; де N і S необов'язково окиснені; при цьому, що утворюючий цикл атом вуглецю С₃₋₇-циклоалкілу і 4-7-членного гетероциклоалкілу необов'язково заміщений оксо з утворенням карбонільної групи; і при цьому С₃₋₇-циклоалкіл, феніл, 5-6-членний гетероарил і 4-7-членний гетероциклоалкіл, кожен, необов'язково заміщені 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^{A3};

кожен R^{A3} незалежно вибраний з OH, NO₂, CN, галогену, С₁₋₆алкілу, С₁₋₆галогеналкілу, С₁₋₆алкокси, С₁₋₆галогеналкокси, ціано-С₁₋₃алкілу, HO-С₁₋₃алкілу, H₂N-С₁₋₃алкілу, аміно, С₁₋₆алкіламіно, ді(С₁₋₆алкіл)аміно, тіо, С₁₋₆алкілтіо, С₁₋₆алкілсульфінілу, С₁₋₆алкілсульфонілу, карбамілу, С₁₋₆алкілкарбамілу, ді(С₁₋₆алкіл)карбамілу, карбокси, С₁₋₆алкілкарбонілу, С₁₋₆алкоксикарбонілу, С₁₋₆алкілкарбоніламіно, С₁₋₆алкілсульфоніламіно, аміносульфонілу, С₁₋₆алкіламіносульфонілу, ді(С₁₋₆алкіл)аміносульфонілу, аміносульфоніламіно, С₁₋₆алкіламіносульфоніламіно, ді(С₁₋₆алкіл)аміносульфоніламіно, амінокарбоніламіно, С₁₋₆алкіламінокарбоніламіно і ді(С₁₋₆алкіл)амінокарбоніламіно;

кожен R^C незалежно вибраний з OH, CN, галогену, С₁₋₄алкілу, С₁₋₃галогеналкілу, С₁₋₄алкокси, С₁₋₃галогеналкокси, ціано-С₁₋₃алкілу, HO-С₁₋₃алкілу, аміно, С₁₋₄алкіламіно, ді(С₁₋₄алкіл)аміно, С₁₋₄алкілсульфінілу, С₁₋₄алкілсульфонілу, карбамілу, С₁₋₄алкілкарбамілу, ді(С₁₋₄алкіл)карбамілу, карбокси, С₁₋₄алкілкарбонілу, С₁₋₄алкоксикарбонілу, С₁₋₄алкілкарбоніламіно, С₁₋₄алкілсульфоніламіно, аміносульфонілу, С₁₋₄алкіламіносульфонілу і ді(С₁₋₄алкіл)аміносульфонілу;

Су^B являє собою С₃₋₁₀-циклоалкіл або 4-10-членний гетероциклоалкіл; причому щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю С₃₋₁₀-циклоалкілу і 4-10-членного гетероциклоалкілу заміщений оксо з утворенням карбонільної групи; при цьому 4-10-членний гетероциклоалкіл має щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю і 1, 2, 3 або 4 утворюючі цикл гетероатоми, які незалежно вибрані з N, O і S; де N і S необов'язково окиснені; і при цьому С₃₋₁₀-циклоалкіл і 4-10-членний гетероциклоалкіл, кожен, необов'язково заміщені 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^B; або

Су^B являє собою 6-10-членний арил або 5-10-членний гетероарил; причому 5-10-членний гетероарил має щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю і 1, 2, 3 або 4 утворюючі цикл гетероатоми, які незалежно вибрані з N, O і S; де N і S необов'язково окиснені; при цьому: (a) щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю 5-10-членного гетероарилу заміщений оксо з утворенням карбонільної групи; або (b) 6-10-членний арил або 5-10-членний гетероарил заміщений галогеном, CN, NO₂, OR^{a2}, SR^{a2}, C(O)R^{b2}, C(O)NR^{c2R^{d2}}, C(O)OR^{a2}, OC(O)R^{b2}, OC(O)NR^{c2R^{d2}}, NR^{c2R^{d2}}, NR^{c2OR^{d2}}, NR^{c2C(O)R^{b2}}, NR^{c2C(O)OR^{a2}}, NR^{c2C(O)NR^{c2R^{d2}}}, NR^{c2S(O)R^{b2}}, NR^{c2S(O)₂R^{b2}}, NR^{c2S(O)₂NR^{c2R^{d2}}}, S(O)R^{b2}, S(O)NR^{c2R^{d2}}, S(O)₂R^{b2} і S(O)₂NR^{c2R^{d2}}; і при тому, що 6-10-членний арил або 5-10-членний гетероарил додатково необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^B; кожен R^B незалежно вибраний з галогену, С₁₋₆алкілу, С₁₋₆галогеналкілу, С₃₋₆-циклоалкілу, фенілу, 5-6-членного гетероарилу, 4-7-членного гетероциклоалкілу, CN, NO₂, OR^{a2}, SR^{a2}, C(O)R^{b2}, C(O)NR^{c2R^{d2}}, C(O)OR^{a2}, OC(O)R^{b2}, OC(O)NR^{c2R^{d2}}, NR^{c2R^{d2}}, NR^{c2OR^{d2}}, NR^{c2C(O)R^{b2}}, NR^{c2C(O)OR^{a2}}, NR^{c2C(O)NR^{c2R^{d2}}}, NR^{c2S(O)R^{b2}}, NR^{c2S(O)₂R^{b2}}, NR^{c2S(O)₂NR^{c2R^{d2}}}, S(O)R^{b2}, S(O)NR^{c2R^{d2}}, S(O)₂R^{b2} і S(O)₂NR^{c2R^{d2}}; де вказані С₁₋₆алкіл, С₃₋₆-циклоалкіл, феніл, 5-6-членний гетероарил і 4-7-членний гетероциклоалкіл, кожен, необов'язково заміщені 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R¹²;

кожен R¹¹ незалежно вибраний з CN, NO₂, OR^{a3}, SR^{a3}, C(O)R^{b3}, C(O)NR^{c3R^{d3}}, C(O)OR^{a3}, OC(O)R^{b3}, OC(O)NR^{c3R^{d3}}, NR^{c3R^{d3}}, NR^{c3OR^{d3}}, NR^{c3C(O)R^{b3}}, NR^{c3C(O)OR^{a3}}, NR^{c3C(O)NR^{c3R^{d3}}}, NR^{c3S(O)R^{b3}}, NR^{c3S(O)₂R^{b3}}, NR^{c3S(O)₂NR^{c3R^{d3}}}, S(O)R^{b3}, S(O)NR^{c3R^{d3}}, S(O)₂R^{b3} і S(O)₂NR^{c3R^{d3}};

кожен R¹² незалежно вибраний з галогену, CN, NO₂, С₁₋₆алкілу, С₁₋₆галогеналкілу, С₃₋₆-циклоалкілу, фенілу, 5-6-членного гетероарилу, 4-7-членного гетероциклоалкілу, OR^{a4}, SR^{a4}, C(O)R^{b4}, C(O)NR^{c4R^{d4}}, C(O)OR^{a4}, OC(O)R^{b4}, OC(O)NR^{c4R^{d4}}, NR^{c4R^{d4}}, NR^{c4OR^{d4}}, NR^{c4C(O)R^{b4}}, NR^{c4C(O)OR^{a4}}, NR^{c4C(O)NR^{c4R^{d4}}}, NR^{c4S(O)R^{b4}}, NR^{c4S(O)₂R^{b4}}, NR^{c4S(O)₂NR^{c4R^{d4}}}, S(O)R^{b4}, S(O)NR^{c4R^{d4}}, S(O)₂R^{b4} і S(O)₂NR^{c4R^{d4}}; де вказані С₁₋₆алкіл, С₃₋₆-циклоалкіл, феніл, 5-6-членний гетероарил і 4-7-членний гетероциклоалкіл, кожен, необов'язково заміщені 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R⁹;

R^{a1}, R^{c1} і R^{d1}, кожен, незалежно вибраний з H, С₁₋₆алкілу і С₁₋₆галогеналкілу; де вказаний С₁₋₆алкіл необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R⁹; або

в іншому випадку, R^{c1} і R^{d1}, приєднані до того ж атому N, разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членну гетероциклоалкілну групу, необов'язково заміщену 1, 2 або 3 замісниками, незалежно вибраними з R⁹;

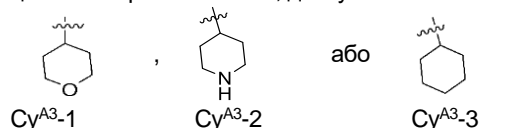
R^{b1} вибраний з С₁₋₆алкілу і С₁₋₆галогеналкілу, кожен з яких необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R⁹;

R^{e1} вибраний з H, CN, С₁₋₆алкілу, С₁₋₆галогеналкілу, С₁₋₆алкілтіо, С₁₋₆алкілсульфонілу, С₁₋₆алкілкарбонілу, С₁₋₆алкіламіносульфонілу, карбамілу, С₁₋₆алкілкарбамілу, ді(С₁₋₆алкіл)карбамілу, аміносульфонілу, С₁₋₆алкіламіносульфонілу і ді(С₁₋₆алкіл)аміносульфонілу;

кожен R^{a2} , R^{c2} і R^{d2} незалежно вибраний з Н, C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{3-6} циклоалкілу, фенілу, 5-6-членного гетероарилу і 4-7-членного гетероциклоалкілу; де вказані C_{1-6} алкіл, C_{3-6} циклоалкіл, феніл, 5-6-членний гетероарил і 4-7-членний гетероциклоалкіл, кожен, необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^{12} ; або в іншому випадку, будь-який R^{c2} і R^{d2} , приєднані до того ж атому N, разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членну гетероциклоалکیلну групу, необов'язково заміщену 1, 2 або 3 замісниками, незалежно вибраними з R^{12} ; кожен R^{b2} незалежно вибраний з C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{3-6} циклоалкілу, фенілу, 5-6-членного гетероарилу і 4-7-членного гетероциклоалкілу, кожен з яких необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^{12} ; кожен R^{a3} , R^{c3} і R^{d3} незалежно вибраний з Н, C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{3-6} циклоалкілу, фенілу, 5-6-членного гетероарилу, 4-7-членного гетероциклоалкілу, C_{3-6} циклоалкіл- C_{1-4} алкілену, феніл- C_{1-4} алкілену, 5-6-членного гетероарил- C_{1-4} алкілену і 4-7-членного гетероциклоалкіл- C_{1-4} алкілену; де вказані C_{1-6} алкіл, C_{3-6} циклоалкіл, феніл, 5-6-членний гетероарил, 4-7-членний гетероциклоалкіл, C_{3-6} циклоалкіл- C_{1-4} алкілен, феніл- C_{1-4} алкілен, 5-6-членний гетероарил- C_{1-4} алкілен і 4-7-членний гетероциклоалкіл- C_{1-4} алкілен, кожен, необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^9 ; або в іншому випадку, будь-який R^{c3} і R^{d3} , приєднані до того ж атому N, разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членну гетероциклоалکیلну групу, необов'язково заміщену 1, 2 або 3 замісниками, незалежно вибраними з R^9 ; кожен R^{b3} незалежно вибраний з C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{3-6} циклоалкілу, фенілу, 5-6-членного гетероарилу, 4-7-членного гетероциклоалкілу, C_{3-6} циклоалкіл- C_{1-4} алкілену, феніл- C_{1-4} алкілену, 5-6-членного гетероарил- C_{1-4} алкілену і 4-7-членного гетероциклоалкіл- C_{1-4} алкілену, кожен з яких необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^9 ; кожен R^{a4} , R^{c4} і R^{d4} , незалежно вибраний з Н, C_{1-6} алкілу і C_{1-6} галогеналкілу; де вказаний C_{1-6} алкіл необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^9 ; або в іншому випадку, будь-який R^{c4} і R^{d4} , приєднані до того ж атому N, разом з атомом N, до якого вони приєднані, утворюють 4-, 5-, 6- або 7-членну гетероциклоалکیلну групу, необов'язково заміщену 1, 2 або 3 замісниками, незалежно вибраними з R^9 ; кожен R^{b4} незалежно вибраний з C_{1-6} алкілу і C_{1-6} галогеналкілу, кожен з яких необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^9 ; і кожен R^9 незалежно вибраний з ОН, NO_2 , CN, галогену, C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} галогеналкокси, ціано- C_{1-3} алкілу, $HO-C_{1-3}$ алкілу, H_2N-C_{1-3} алкілу, аміно, C_{1-6} алкіламіно, ді(C_{1-6} алкіл)аміно, тіо, C_{1-6} алкілтіо, C_{1-6} алкілсульфінілу, C_{1-6} алкілсульфонілу, карбамілу, C_{1-6} алкілкарбамілу, ді(C_{1-6} алкіл)карбамілу, карбокси, C_{1-6} алкілкарбонілу, C_{1-6} алкоксикарбонілу, C_{1-6} алкілкарбоніламіно, C_{1-6} алкілсульфоніламіно, аміносульфонілу, C_{1-6} алкіламіносульфонілу, ді(C_{1-6} алкіл)аміносульфонілу, аміносульфоніламіно,

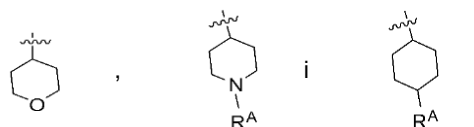
C_{1-6} алкіламіносульфоніламіно, ді(C_{1-6} алкіл)аміносульфоніламіно, амінокарбоніламіно, C_{1-6} алкіламінокарбоніламіно і ді(C_{1-6} алкіл)амінокарбоніламіно; за умови, що:

- 1) $A^1-A^2-A^3$ не являє собою Y-Y, коли один з A^1 , A^2 або A^3 являє собою зв'язок або Y-Y-Y; і
- 2) коли A^3 являє собою -Y- або - C_{1-3} алкілен-Y-, тоді R^A являє собою Н, C_{1-6} алкіл або C_{1-6} галогеналкіл, де вказаний C_{1-6} алкіл або C_{1-6} галогеналкіл необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^{11} .
2. Сполука за п. 1 або її фармацевтично прийнятна сіль, де R^1 являє собою Н, галоген, C_{1-6} алкіл або C_{1-6} галогеналкіл.
3. Сполука за п. 1 або її фармацевтично прийнятна сіль, де R^1 являє собою C_{1-6} алкіл.
4. Сполука за п. 1 або її фармацевтично прийнятна сіль, де R^1 являє собою $A^2-A^3-R^A$.
5. Сполука за п. 1 або 4 або її фармацевтично прийнятна сіль, де R^1 являє собою $Cy^{A3}-R^A$.
6. Сполука за будь-яким з пп. 1, 4 і 5 або її фармацевтично прийнятна сіль, де Cy^{A3} являє собою C_{3-7} циклоалкіл, 5-6-членний гетероарил або 4-7-членний гетероциклоалкіл; кожен необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^{A3} .
7. Сполука за будь-яким з пп. 1 і 4-6 або її фармацевтично прийнятна сіль, де Cy^{A3} являє собою C_{3-6} циклоалкіл або 4-6-членний гетероциклоалкіл, кожен з яких необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з R^{A3} .
8. Сполука за будь-яким з пп. 1 і 4-7 або її фармацевтично прийнятна сіль, де Cy^{A3} являє собою піперидиніл, циклогексил, тетрагідропіраніл, піразоліл, прідиніл, азетидиніл, циклопропіл або морфолініл; кожен з яких необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з R^{A3} .
9. Сполука за будь-яким з пп. 1 і 4-8 або її фармацевтично прийнятна сіль, де Cy^{A3} являє собою піперидиніл, циклогексил або тетрагідропіраніл; кожен з яких необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з R^{A3} .
10. Сполука за будь-яким з пп. 1 і 4-9 або її фармацевтично прийнятна сіль, де Cy^{A3} являє собою



де Cy^{A3-1} , Cy^{A3-2} і Cy^{A3-3} , кожен, необов'язково заміщений 1, 2 або 3 замісниками, незалежно вибраними з R^{A3} .

11. Сполука за будь-яким з пп. 1-5 або її фармацевтично прийнятна сіль, де R^1 вибраний з метилу, етилу,



12. Сполука за будь-яким з пп. 1-5 або її фармацевтично прийнятна сіль, де R^A являє собою C_{1-6} алкіл, CN, OR^{a1} , $NR^{c1}R^{d1}$, $C(O)R^{b1}$, $C(O)NR^{c1}R^{d1}$, $C(O)OR^{a1}$, $S(O)R^{b1}$, $S(O)NR^{c1}R^{d1}$, $S(O)_2R^{b1}$ або $S(O)_2NR^{c1}R^{d1}$; де

вказаний C_{1-6} алкіл необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з R^{11} , за умови, що якщо R^A приєднаний до атома азоту, то R^A не являє собою CN, OR^{a1} або $NR^{c1}R^{d1}$.

13. Сполука за будь-яким з пп. 1-5 або її фармацевтично прийнятна сіль, де R^A являє собою C_{1-6} алкіл, CN, OR^{a1} , $C(O)R^{b1}$, $C(O)NR^{c1}R^{d1}$, $C(O)OR^{a1}$ і $S(O)_2R^{b1}$; причому вказаний C_{1-6} алкіл необов'язково заміщений 1 замісником, вибраним з R^{11} , за умови, що якщо R^A приєднаний до атома азоту, то R^A не являє собою CN або OR^{a1} .

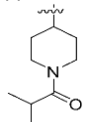
14. Сполука за будь-яким з пп. 1-13 або її фармацевтично прийнятна сіль, де кожен R^{11} незалежно являє собою OR^{a3} .

15. Сполука за будь-яким з пп. 1-14 або її фармацевтично прийнятна сіль, де кожен R^{11} незалежно являє собою OH або OCH_3 .

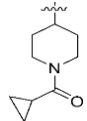
16. Сполука за будь-яким з пп. 1-5 або її фармацевтично прийнятна сіль, де Su^{A3} являє собою піперидиніл, циклогексил, тетрагідропіраніл, піразоліл, піридиніл, азетидиніл, циклопропіл або морфолініл; кожен з яких необов'язково заміщений R^A , незалежно вибраними з CH_3 , CN, OH, CH_2CH_2OH , $CH_2CH_2OCH_3$, $C(O)CH_3$, $C(O)CH_2CH_3$, $C(O)CH(CH_3)_2$, $C(O)CH_2OH$, $C(O)CH(CH_3)OH$, $S(O)_2CH_3$, $C(O)OCH_3$, $C(O)N(CH_3)_2$, $C(O)NH(CH_3)$, $C(O)N(CH_2CH_3)_2$, $C(O)NH(CH_2CH_3)$, $C(O)N(CH_3)(CH_2CH_3)$, $CH_2C(O)N(CH_3)_2$, 1-метил-2-оксопіролідин-3-іл, $C(O)$ (циклопропіл), $N(CH_3)_2$ і $C(O)$ (морфолін-4-іл).

17. Сполука за будь-яким з пп. 1-5 або її фармацевтично прийнятна сіль, де Su^{A3} являє собою піперидиніл, циклогексил або тетрагідропіраніл; кожен з яких необов'язково заміщений R^A , незалежно вибраними з CH_3 , CN, OH, CH_2CH_2OH , $CH_2CH_2OCH_3$, $C(O)CH_3$, $C(O)CH_2CH_3$, $C(O)CH(CH_3)_2$, $C(O)CH_2OH$, $C(O)CH(CH_3)OH$, $S(O)_2CH_3$, $C(O)OCH_3$, $C(O)N(CH_3)_2$, $C(O)NH(CH_3)$, $C(O)N(CH_2CH_3)_2$, $C(O)NH(CH_2CH_3)$, $C(O)N(CH_3)(CH_2CH_3)$ і $C(O)$ (морфолін-4-іл).

18. Сполука за будь-яким з пп. 1-5 або її фармацевтично прийнятна сіль, де R^1 являє собою



19. Сполука за будь-яким з пп. 1-5 або її фармацевтично прийнятна сіль, де R^1 являє собою



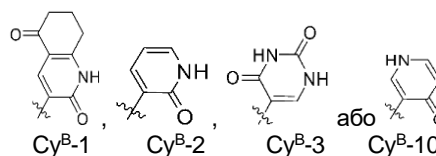
20. Сполука за будь-яким з пп. 1-19 або її фармацевтично прийнятна сіль, де Su^B являє собою C_{3-10} циклоалкіл або 4-10-членний гетероциклоалкіл; причому щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю C_{3-10} циклоалкілу і 4-10-членного гетероциклоалкілу заміщений оксо з утворенням карбонільної групи; при цьому 4-10-членний гетероциклоалкіл має щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю і 1, 2, 3 або 4 утворюючі цикл гетероатоми, які незалежно вибрані з N, O і S; де N і S необов'язково окиснені; і при цьому C_{3-10} циклоалкіл і 4-10-членний гетероциклоалкіл, кожен, необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^B ; або

Su^B являє собою 5-10-членний гетероарил; причому 5-10-членний гетероарил має щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю і 1, 2, 3 або 4 утворюючі цикл гетероатоми, які незалежно вибрані з N, O і S; де N і S необов'язково окиснені; при цьому: (a) щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю 5-10-членного гетероарилу заміщений оксо з утворенням карбонільної групи; або (b) 5-10-членний гетероарил заміщений галогеном, CN, NO_2 , OR^{a2} , SR^{a2} , $C(O)R^{b2}$, $C(O)NR^{c2}R^{d2}$, $C(O)OR^{a2}$, $OC(O)R^{b2}$, $OC(O)NR^{c2}R^{d2}$, $NR^{c2}R^{d2}$, $NR^{c2}OR^{d2}$, $NR^{c2}C(O)R^{b2}$, $NR^{c2}C(O)OR^{a2}$, $NR^{c2}C(O)NR^{c2}R^{d2}$, $NR^{c2}S(O)_2R^{b2}$, $NR^{c2}S(O)_2NR^{c2}R^{d2}$, $S(O)_2R^{b2}$, $S(O)_2NR^{c2}R^{d2}$, $S(O)_2R^{b2}$ і $S(O)_2NR^{c2}R^{d2}$; і причому 5-10-членний гетероарил додатково необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^B .

21. Сполука за будь-яким з пп. 1-20 або її фармацевтично прийнятна сіль, де Su^B являє собою 4-10-членний гетероциклоалкіл; причому щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю 4-10-членного гетероциклоалкілу заміщений оксо з утворенням карбонільної групи; при цьому 4-10-членний гетероциклоалкіл має щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю і 1, 2, 3 або 4 утворюючі цикл гетероатоми, які незалежно вибрані з N, O і S; і при цьому 4-10-членний гетероциклоалкіл необов'язково заміщений 1, 2 або 3 замісниками, незалежно вибраними з R^B ; або

Su^B являє собою 5-6-членний гетероарил, що має щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю, заміщений оксо з утворенням карбонільної групи і 1 або 2 утворюючі цикл гетероатоми, які незалежно вибрані з N, O і S; де N і S необов'язково окиснені; причому 5-6-членний гетероарил додатково необов'язково заміщений 1, 2 або 3 замісниками, незалежно вибраними з R^B .

22. Сполука за будь-яким з пп. 1-21 або її фармацевтично прийнятна сіль, де Su^B являє собою



де Su^B -1, Su^B -2, Su^B -3 і Su^B -10, кожен, необов'язково заміщений 1, 2 або 3 замісниками, незалежно вибраними з R^B .

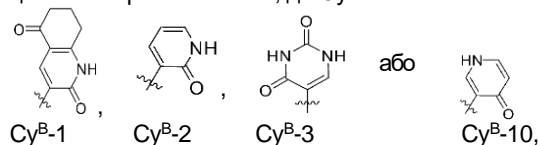
23. Сполука за будь-яким з пп. 1-22 або її фармацевтично прийнятна сіль, де кожен R^B незалежно вибраний з галогену, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкінілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{3-6} циклоалкілу, фенілу, 5-6-членного гетероарилу, 4-7-членного гетероциклоалкілу, CN, OR^{a2} , $C(O)R^{b2}$, $C(O)NR^{c2}R^{d2}$, $C(O)OR^{a2}$, $NR^{c2}R^{d2}$, $NR^{c2}C(O)R^{b2}$ і $NR^{c2}C(O)OR^{a2}$; де вказані C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкініл, C_{3-6} циклоалкіл, феніл, 5-6-членний гетероарил і 4-7-членний гетероциклоалкіл, кожен, необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^{12} .

24. Сполука за будь-яким з пп. 1-22 або її фармацевтично прийнятна сіль, де кожен R^B незалежно являє собою незаміщений феніл, 4-фторфеніл, 3-фторфеніл, 2-фторфеніл, CH_2 (феніл), $CH(CH_2OH)$ феніл, Br, Cl, CN, CH_3 , CHF_2 , CH_2CH_3 , CH_2OCH_3 , $CH_2OCH_2CH_3$, $CH(CH_3)_2$, $CH(CH_2OH)CH_2CH_3$, $CH(CH_2OH)CH_3$,

$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{OH})(\text{CH}_3)$, OCH_3 , OCH_2CH_3 , $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$, $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$, 2,5-дифторфеніл, 3-піридиніл, 2-піридиніл, 1-метил-1Н-піразол-4-іл, 1-метил-1Н-піразол-3-іл, 1-метил-1Н-піразол-5-іл, 1,4-диметил-1Н-піразол-3-іл, 1,5-диметил-1Н-піразол-3-іл, 2-метилтіазол-5-іл, циклогексил, 3-ціанофеніл, 5-метилізоксазол-3-іл, 5-фторпіридин-3-іл, 5-фторпіридин-2-іл, 3-ціанофеніл, CH_2CN , тіазол-4-іл, 6-метилпіридин-3-іл, 2-метилпіридин-3-іл, 6-метилпіридин-2-іл, піримідин-2-іл, морфолін-4-іл, циклопропіл, оксазол-2-іл, $\text{CCCH}(\text{OH})(\text{CH}_3)$ або $\text{C}(\text{O})\text{NH}(4\text{-фторфеніл})$.

25. Сполука за будь-яким з пп. 1-22 або її фармацевтично прийнятна сіль, де кожен R^B незалежно являє собою незаміщений феніл, 4-фторфеніл, 3-фторфеніл, 2-фторфеніл, 2-піридиніл, $\text{CH}_2(\text{феніл})$, $\text{CH}(\text{CH}_2\text{OH})\text{феніл}$, CH_3 , CH_2CH_3 , $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{CH}(\text{CH}_2\text{OH})\text{CH}_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_2\text{OH})\text{CH}_3$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, OCH_3 , OCH_2CH_3 або $\text{C}(\text{O})\text{NH}(4\text{-фторфеніл})$.

26. Сполука за будь-яким з пп. 1-22 або її фармацевтично прийнятна сіль, де Cy^B являє собою



де $\text{Cy}^B\text{-1}$, $\text{Cy}^B\text{-2}$, $\text{Cy}^B\text{-3}$ і $\text{Cy}^B\text{-10}$, кожен, необов'язково заміщені 1, 2 або 3 замісниками, незалежно вибраними з R^B ;

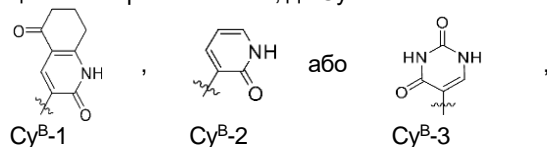
кожен R^B незалежно являє собою метил, етил, ізопропіл, втор-бутил, 2-піридиніл або феніл, кожен з яких необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з R^{12} ;

кожен R^{12} незалежно вибраний з C_{1-6} алкілу, галогену, фенілу і OR^{a4} ; де вказані C_{1-6} алкіл і феніл, кожен, необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з групи R^g ;

кожен R^{a4} являє собою Н або C_{1-3} алкіл; і

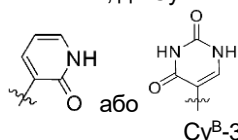
кожен R^g незалежно вибраний з галогену.

27. Сполука за будь-яким з пп. 1-22 або її фармацевтично прийнятна сіль, де Cy^B являє собою



де $\text{Cy}^B\text{-1}$, $\text{Cy}^B\text{-2}$ і $\text{Cy}^B\text{-3}$, кожен, необов'язково заміщені 1, 2 або 3 групами, незалежно вибраними з незаміщеного фенілу, 4-фторфенілу, 3-фторфенілу, 2-фторфенілу, 2-піридинілу, $\text{CH}_2(\text{фенілу})$, $\text{CH}(\text{CH}_2\text{OH})\text{фенілу}$, CH_3 , CH_2CH_3 , $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{CH}(\text{CH}_2\text{OH})\text{CH}_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_2\text{OH})\text{CH}_3$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, OCH_2CH_3 і OCH_3 .

28. Сполука за будь-яким з пп. 1-22 або її фармацевтично прийнятна сіль, де Cy^B являє собою



де $\text{Cy}^B\text{-2}$ і $\text{Cy}^B\text{-3}$, кожен, необов'язково заміщені 1, 2 або 3 групами, незалежно вибраними з незаміщеного фенілу, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ і 2-піридинілу.

29. Сполука за будь-яким з пп. 1-28 або її фармацевтично прийнятна сіль, де кожен R^C незалежно являє собою F, Cl або метил.

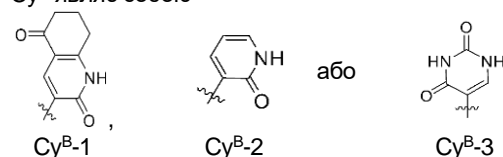
30. Сполука за будь-яким з пп. 1-29 або її фармацевтично прийнятна сіль, де кожен R^C являє собою F.

31. Сполука за п. 1 або її фармацевтично прийнятна сіль, де R^1 являє собою



де R^A являє собою CH_3 , CH_2CH_3 , CN, OH, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$, $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(\text{O})\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{C}(\text{O})(\text{циклопропіл})$, $\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_3$, $\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{OH}$, $\text{C}(\text{O})\text{CH}(\text{OH})\text{CH}_3$, SO_2CH_3 , $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_3$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)$ або $\text{C}(\text{O})(\text{морфолін-4-іл})$;

Cy^B являє собою



де $\text{Cy}^B\text{-1}$, $\text{Cy}^B\text{-2}$ і $\text{Cy}^B\text{-3}$, кожен, необов'язково заміщені 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з R^B ;

кожен R^B незалежно являє собою незаміщений феніл, 4-F-феніл, 3-F-феніл, 2-F-феніл, 2-піридиніл, $\text{CH}_2(\text{феніл})$, $\text{CH}(\text{феніл})\text{CH}_2\text{OH}$, метил, етил, ізопропіл, $\text{CH}(\text{CH}_2\text{OH})\text{CH}_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_2\text{OH})\text{CH}_3$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ або OCH_2CH_3 ; і

R^C являє собою F, Cl або Br.

32. Сполука за п. 1 або її фармацевтично прийнятна сіль, де:

R^1 являє собою $\text{A}^1\text{-A}^2\text{-A}^3\text{-R}^A$, (1) де вказані A^1 , A^2 і A^3 , кожен, являють собою зв'язок і R^A являє собою C_{1-6} алкіл або $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{c1}\text{R}^{d1}$, (2) де вказаний A^1 являє собою зв'язок A^2 являє собою зв'язок або -C_{1-3} алкілен-, A^3 являє собою $\text{Cy}^{\text{A}3}$ і R^A являє собою C_{1-6} алкіл, CN, OR^{a1} , $\text{NR}^{c1}\text{R}^{d1}$, $\text{C}(\text{O})\text{R}^{b1}$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{c1}\text{R}^{d1}$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{a1}$ або $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{b1}$; де вказаний C_{1-6} алкіл з R^A необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^{11} або (3) де A^1 являє собою $\text{Cy}^{\text{A}1}$, A^2 являє собою зв'язок або $\text{C}(\text{O})$, A^3 являє собою $\text{Cy}^{\text{A}3}$ і R^A являє собою Н;

$\text{Cy}^{\text{A}1}$ являє собою C_{3-7} циклоалкіл або 4-7-членний гетероциклоалкіл; причому 4-7-членний гетероциклоалкіл має щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю і 1, 2, 3 або 4 утворюючі цикл гетероатом, які незалежно вибрані з N, O і S; де N і S необов'язково окиснені; при тому, що утворюючий цикл атом вуглецю C_{3-7} циклоалкілу і 4-7-членного гетероциклоалкілу необов'язково заміщений оксо з утворенням карбонільної групи;

$\text{Cy}^{\text{A}3}$ являє собою C_{3-7} циклоалкіл, 6-членний гетероарил або 4-7-членний гетероциклоалкіл; причому кожен 6-членний гетероарил і 4-7-членний гетероциклоалкіл має щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю і 1, 2, 3 або 4 утворюючі цикл гетероатом, які незалежно вибрані з N, O і S; де N і S необов'язково окиснені; при тому, що утворюючий цикл атом вуглецю C_{3-7} циклоалкілу і 4-7-членного гетероциклоалкілу необов'язково заміщений оксо з утворенням карбонільної групи; і при цьому C_{3-7} циклоалкіл, 6-членний гетероарил і 4-7-членний гетеро-

циклоалкіл, кожен, необов'язково заміщені 1, 2, 3 або 4 C_{1-6} алкілом;

Su^B являє собою C_{3-10} циклоалкіл або 4-10-членний гетероциклоалкіл; причому щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю C_{3-10} циклоалкілу і 4-10-членного гетероциклоалкілу заміщений оксо з утворенням карбонільної групи; при цьому 4-10-членний гетероциклоалкіл має щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю і 1, 2, 3 або 4 утворюючі цикл гетероатоми, які незалежно вибрані з N, O і S; і при цьому C_{3-10} циклоалкіл і 4-10-членний гетероциклоалкіл, кожен, необов'язково заміщені 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з R^B ; або

Su^B являє собою 5-10-членний гетероарил, що має один утворюючий кільце атом вуглецю, який заміщений оксо з утворенням карбонільної групи і 1, 2, 3 або 4 утворюючі цикл гетероатоми, які незалежно вибрані з N, O і S; де N і S необов'язково окиснені; причому 5-10-членний гетероарил додатково необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^B ;

кожен R^B незалежно вибраний з C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкінілу, CN, галогену, фенілу, 5-6-членного гетероарилу, C_{3-7} циклоалкілу, 4-7-членного гетероциклоалкілу, OR^{a2} , $C(O)R^{b2}$ і $C(O)NR^{c2}R^{d2}$; де вказані C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкініл, феніл, 5-6-членний гетероарил, C_{3-7} циклоалкіл і 4-7-членний гетероциклоалкіл, кожен, необов'язково заміщені 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^{12} ;

кожен R^C незалежно вибраний з галогену і C_{1-4} алкілу; кожен R^{11} незалежно являє собою OR^{a3} або $C(O)NR^{c3}R^{d3}$;

кожен R^{12} незалежно вибраний з галогену, C_{1-6} алкілу, CN, фенілу і OR^{a4} ;

кожен R^{a1} , R^{c1} і R^{d1} незалежно вибраний з H і C_{1-6} алкілу;

кожен R^{b1} незалежно вибраний з C_{1-6} алкілу;

кожен R^{a3} , R^{c3} , R^{d3} і R^{a4} незалежно вибраний з H і C_{1-6} алкілу; і

кожен R^{a2} , R^{b2} , R^{c2} і R^{d2} незалежно вибраний з H, C_{1-6} алкілу і фенілу; де вказані C_{1-6} алкіл і феніл, кожен, необов'язково заміщені 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^{12} .

33. Сполука за п. 1 або її фармацевтично прийнятна сіль, де:

R^1 являє собою $A^1-A^2-A^3-R^A$, (1) де вказані A^1 , A^2 і A^3 , кожен, являють собою зв'язок, і R^A являє собою C_{1-6} алкіл, або (2) де вказані A^1 і A^2 , кожен, являють собою зв'язок, A^3 являє собою Su^{A3} , і R^A являє собою C_{1-6} алкіл, CN, OR^{a1} , $C(O)R^{b1}$, $C(O)NR^{c1}R^{d1}$, $C(O)OR^{a1}$ або $S(O)_2R^{b1}$; де вказаний C_{1-6} алкіл необов'язково заміщений 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^{11} ;

Su^{A3} являє собою C_{3-7} циклоалкіл або 4-7-членний гетероциклоалкіл; причому 4-7-членний гетероциклоалкіл має щонайменше один утворюючий цикл атом вуглецю і 1, 2, 3 або 4 утворюючі цикл гетероатоми, які незалежно вибрані з N, O і S; при цьому утворюючий цикл атом вуглецю C_{3-7} циклоалкілу і 4-7-членного гетероциклоалкілу необов'язково заміщений оксо з утворенням карбонільної групи;

Su^B являє собою 5-6-членний гетероарил, що має один утворюючий кільце атом вуглецю, який заміщений оксо з утворенням карбонільної групи і 1 або 2 утворюючі цикл гетероатоми, які незалежно вибрані з N, O і S; де N і S необов'язково окиснені; при-

чому 5-6-членний гетероарил додатково необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, незалежно вибраними з R^B ;

кожен R^B незалежно вибраний з C_{1-6} алкілу і фенілу; де вказані C_{1-6} алкіл і феніл необов'язково заміщені 1, 2, 3 або 4 замісниками, незалежно вибраними з R^{12} ;

кожен R^C незалежно являє собою галоген;

кожен R^{11} незалежно являє собою OR^{a3} ;

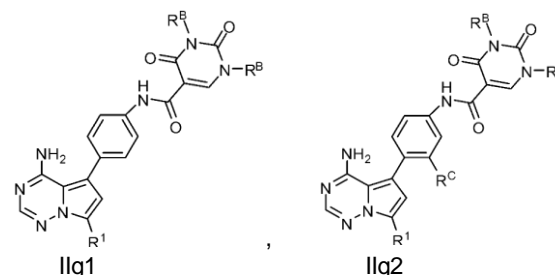
кожен R^{12} незалежно вибраний з галогену, фенілу і OR^{a4} ;

кожен R^{a1} , R^{c1} і R^{d1} незалежно вибраний з H і C_{1-6} алкілу;

кожен R^{b1} незалежно вибраний з C_{1-6} алкілу; і

кожен R^{a3} і R^{a4} незалежно вибраний з H і C_{1-6} алкілу.

34. Сполука за п. 1 Формули (Ilg1) або Формули (Ilg2):



або її фармацевтично прийнятна сіль.

35. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що сполука вибрана з:

N-[4-(4-аміно-7-етилпіроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл]-1-(4-фторфеніл)-2,5-діоксо-1,2,5,6,7,8-гексагідрохінолін-3-карбоксаміду;

N-[4-(4-аміно-7-етилпіроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл]-1-[(1R)-2-гідрокси-1-фенілетил]-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаміду;

N-[4-(4-аміно-7-етилпіроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл]-1-[(1R)-2-гідрокси-1-метилетил]-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаміду;

N-[4-(4-аміно-7-етилпіроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл]-1-[(1R)-1-(гідроксиметил)пропіл]-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаміду;

N-[4-(4-аміно-7-етилпіроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл]-1-бензил-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаміду;

N-[4-(4-аміно-7-етилпіроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл]-1-метил-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаміду;

N-[4-[4-аміно-7-(цис-4-гідроксициклогексил)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл]феніл]-2-оксо-1-феніл-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаміду;

N-[4-[4-аміно-7-(транс-4-гідроксициклогексил)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл]феніл]-2-оксо-1-феніл-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаміду;

N-[4-(4-аміно-7-метилпіроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл]-2-оксо-1-феніл-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаміду;

N-[4-(4-аміно-7-метилпіроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл]-1-(4-фторфеніл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаміду;

N-[4-(4-аміно-7-метилпіроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)-3-фторфеніл]-2-оксо-1-феніл-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаміду;

N-[4-(4-аміно-7-метилпіроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)-3-фторфеніл]-1-(4-фторфеніл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаміду;

N-{4-[4-аміно-7-(транс-4-ціаноциклогексил)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл]-3-фторфеніл}-2-оксо-1-феніл-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаїду;
N-{4-[4-аміно-7-(цис-4-ціаноциклогексил)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл]-3-фторфеніл}-1-(4-фторфеніл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаїду;
N-{4-[4-аміно-7-(транс-4-ціаноциклогексил)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл]-3-фторфеніл}-1-(4-фторфеніл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаїду;
N-{4-(4-аміно-7-пінеридин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл}-2-оксо-1-феніл-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаїду;
N-{4-(4-аміно-7-пінеридин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл}-1-(4-фторфеніл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаїду;
N-{4-(4-аміно-7-пінеридин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл}-3-фторфеніл}-2-оксо-1-феніл-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаїду;
N-{4-(4-аміно-7-пінеридин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл}-3-фторфеніл}-1-(4-фторфеніл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаїду;
метил-4-[4-аміно-5-(4-((2-оксо-1-феніл-1,2-дигідропіридин-3-іл)карбоніл)аміно)феніл]піроло[2,1-f][1,2,4]триаизн-7-іл]пінеридин-1-карбоксілату;
метил-4-[4-аміно-5-[4-(((1-(4-фторфеніл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-іл)карбоніл)аміно)феніл]піроло[2,1-f][1,2,4]триаизн-7-іл]пінеридин-1-карбоксілату;
метил-4-[4-аміно-5-(2-фтор-4-((2-оксо-1-феніл-1,2-дигідропіридин-3-іл)карбоніл)аміно)феніл]піроло[2,1-f][1,2,4]триаизн-7-іл]пінеридин-1-карбоксілату;
метил-4-[4-аміно-5-[2-фтор-4-(((1-(4-фторфеніл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-іл)карбоніл)аміно)феніл]піроло[2,1-f][1,2,4]триаизн-7-іл]пінеридин-1-карбоксілату;
N-(4-{4-аміно-7-[1-(метилсульфоніл)пінеридин-4-іл]піроло[2,1-f][1,2,4]триаизн-5-іл}феніл)-2-оксо-1-феніл-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаїду;
N-(4-{4-аміно-7-[1-(метилсульфоніл)пінеридин-4-іл]піроло[2,1-f][1,2,4]триаизн-5-іл}феніл)-1-(4-фторфеніл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаїду;
N-(4-{4-аміно-7-[1-(метилсульфоніл)пінеридин-4-іл]піроло[2,1-f][1,2,4]триаизн-5-іл]-3-фторфеніл)-2-оксо-1-феніл-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаїду;
N-(4-{4-аміно-7-[1-(метилсульфоніл)пінеридин-4-іл]піроло[2,1-f][1,2,4]триаизн-5-іл]-3-фторфеніл)-1-(4-фторфеніл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаїду;
N-{4-(4-аміно-7-{1-[(диметиламіно)карбоніл]пінеридин-4-іл]піроло[2,1-f][1,2,4]триаизн-5-іл})феніл}-2-оксо-1-феніл-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаїду;
N-{4-(4-аміно-7-{1-[(диметиламіно)карбоніл]пінеридин-4-іл]піроло[2,1-f][1,2,4]триаизн-5-іл})феніл}-1-(4-фторфеніл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаїду;
N-{4-(4-аміно-7-{1-[(диметиламіно)карбоніл]пінеридин-4-іл]піроло[2,1-f][1,2,4]триаизн-5-іл)-3-фторфеніл}-2-оксо-1-феніл-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаїду;
N-{4-(4-аміно-7-{1-[(диметиламіно)карбоніл]пінеридин-4-іл]піроло[2,1-f][1,2,4]триаизн-5-іл)-3-фторфеніл}-1-(4-фторфеніл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаїду;

N-(4-{4-аміно-7-[1-(2-метоксіетил)піперидин-4-іл]піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл}-3-фторфеніл)-1-(4-фторфеніл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксамід;
N-(4-{4-аміно-7-[1-(2-гідроксіетил)піперидин-4-іл]піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл}-3-фторфеніл)-1-(4-фторфеніл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксамід;
N-(4-{4-аміно-7-(1-{етил(метил)аміно}карбоніл)піперидин-4-іл}піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл)-1-(4-фторфеніл)-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксамід;
N-(4-{4-аміно-7-(1-{етил(метил)аміно}карбоніл)піперидин-4-іл}піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл)-1-(4-фторфеніл)-2,5-діоксо-1,2,5,6,7,8-гексагідрохінолін-3-карбоксамід;
N-(4-{4-аміно-7-(1-{етил(метил)аміно}карбоніл)піперидин-4-іл}піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл}-3-фторфеніл)-1-(4-фторфеніл)-2,5-діоксо-1,2,5,6,7,8-гексагідрохінолін-3-карбоксамід;
N-(4-{4-аміно-7-[1-(2-гідроксіетил)піперидин-4-іл]піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл)-1-(4-фторфеніл)-2,5-діоксо-1,2,5,6,7,8-гексагідрохінолін-3-карбоксамід;
N-(4-{4-аміно-7-[1-(2-гідроксіетил)піперидин-4-іл]піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл)-1-(4-фторфеніл)-2,5-діоксо-1,2,5,6,7,8-гексагідрохінолін-3-карбоксамід;
і
N-(4-{4-аміно-7-[1-(2-гідроксіетил)піперидин-4-іл]піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл}-3-фторфеніл)-1-(4-фторфеніл)-2,5-діоксо-1,2,5,6,7,8-гексагідрохінолін-3-карбоксамід;
або її фармацевтично прийнятної солі.
37. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що сполука вибрана з:

N-(4-{4-аміно-7-(1-(диметилкарбамоїл)піперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;
N-(4-{4-аміно-7-(1-(етил(метил)карбамоїл)піперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;
N-(4-{4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;
N-(4-{4-аміно-7-(1-метилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;
N-(4-{4-аміно-7-(1-(диметилкарбамоїл)піперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл)-3-(4-фторфеніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;
N-(4-{4-аміно-7-(1-(етил(метил)карбамоїл)піперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл)-3-(4-фторфеніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;
N-(4-{4-аміно-7-(1-(диметилкарбамоїл)піперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл)-1-етил-3-(4-фторфеніл)-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;
N-(4-{4-аміно-7-(1-(морфолін-4-карбоніл)піперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл)-1-етил-3-(4-фторфеніл)-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;
N-(4-{4-аміно-7-(1-(етил(метил)карбамоїл)піперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл)-3-(2-фторфеніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;
N-(4-{4-аміно-7-(1-(диметилкарбамоїл)піперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл}феніл)-3-(3-фтор

феніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіри-
мідин-5-карбоксаміду;

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-3-(3-фторфеніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;

Н-(4-(4-аміно-7-(1-(диметилкарбамоїл)піперидин-4-іл)піроло[1,2-*f*][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-етил-3-(3-фторфеніл)-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксаміду;

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-етил-3-(3-фторфеніл)-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід; і

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-2,5-діоксо-1-феніл-1,2,5,6,7,8-гексагідрохінолін-3-карбоксаміду;

або її фармацевтично прийнятної солі.

38. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що сполука вибрана з:

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)-3-фторфеніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]тріазин-5-іл)-3-фторфеніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)-3-метилфеніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-(піридин-3-іл)-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;

(R)-N-(4-(4-аміно-7-(1-(2-гідроксипропанойл)піперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-етил-3-(4-фторфеніл)-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксаміду;

N-(4-(4-аміно-7-(1-(циклопропанкарбоніл)піперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-(2-гідроксипропіл)-2,4-діоксо-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід:

Н-(4-(4-аміно-7-(1-(2-диметиламіно)-2-оксоетил)піперидин-4-іл)піроло[1,2-*fj*[1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксаміду:

N-(4-(4-аміно-7-(1-(1-метил-2-оксопіролідін-3-іл)пі-
перидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-
1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропі-
римідин-5-карбоксамід;

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-(піридин-2-іл)-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;

N-(4-(4-аміно-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)піро-
ло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-3-(3-фторфеніл)-
1-ізопропіл-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-
карбоксаміду;

N-(4-(4-аміно-7-(1,3,5-триметил-1Н-піразол-4-іл)піро-
ло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-3-(3-фторфеніл)-
1-ізопропіл-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-
карбоксаміду;

N-(4-(4-аміно-7-(6-(диметилкарбамоїл)-4-метилпіридин-3-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксаміду;

4-аміно-5-(4-(3-(3-фторфеніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамідо)феніл)-N,N-диметилпіроло[2,1-f][1,2,4]триазин-7-карбоксаміду;

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-3-(1-метил-1H-піразол-4-іл)-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксаміду;

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-3-(1-метил-1H-піразол-3-іл)-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксаміду;

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-3-(2-метилтіазол-5-іл)-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-3-циклогексил-1-ізопропіл-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксаміду;

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-3-(3-ціанофеніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксаміду;

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-3-(5-метилізоксазол-3-іл)-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;

N-(4-(4-аміно-7-(4-(диметиламіно)циклогексил)піро-
ло[2, 1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-2,4-діок-
со-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбокса-
мідю;

N-(4-(4-аміно-7-(1-(циклопропанкарбоніл)азетидин-3-іл)піролол[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксаміду;

N-(4-(4-аміно-7-(морфолінометил)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-

п[1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-2-ізопропіл-3,5-діоксо-4-феніл-2,3,4,5-тетрагідро-1,2,4-триазин-6-карбокса-мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-

η [1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-6-метил-5-(1-метил-1Н-піразол-5-іл)-4-оксо-1,4-дигідропіридин-3-карбоксамід;

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-

1-[1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-5-фтор-1-ізопропіл-2-метил-4-оксо-1,4-дигідро-[3,3'-біпіридин]-5-карбоксаміду;

N-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-*f*]1,2,4-триазин-5-іл)феніл)-5-бром-1-(5-фторпіридин-

1,2,4-триазин-5-іл)феніл-5-бром-1-(5-фторпіридин-3-іл)-6-метил-2-оксо-1,2-дигідропіридин-3-карбоксаміду;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-5-(ціанометил)-5-фтор-

6-метил-2-оксо-2Н-[1,3'-біпіридин]-3-карбоксаміду;

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-6-метил-5-(1-метил-1Н-піразол-5-іл)-2-оксо-2Н-[1,2'-біпіридин]-3-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-5-хлор-6-метил-2-оксо-2Н-[1,2'-біпіридин]-3-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-6-метил-5-(1-метил-1Н-піразол-3-іл)-2-оксо-2Н-[1,2'-біпіридин]-3-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-6-метил-5-(оксазол-2-іл)-2-оксо-2Н-[1,2'-біпіридин]-3-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-5-(диформетил)-6-метил-2-оксо-2Н-[1,2'-біпіридин]-3-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-4-оксо-5-(піридин-3-іл)-1,4-дигідропіридин-3-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-5-(5-фторпіридин-3-іл)-1-ізопропіл-4-оксо-1,4-дигідропіридин-3-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-5-бром-6-метил-2-оксо-2Н-[1,3'-біпіридин]-3-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-5-хлор-6-метил-2-оксо-2Н-[1,3'-біпіридин]-3-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-5,6-диметил-2-оксо-2Н-[1,3'-біпіридин]-3-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-6-метил-5-(1-метил-1Н-піразол-4-іл)-2-оксо-2Н-[1,3'-біпіридин]-3-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-6-метил-5-(1-метил-1Н-піразол-5-іл)-2-оксо-2Н-[1,3'-біпіридин]-3-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-6-метил-5-(1-метил-1Н-піразол-3-іл)-2-оксо-2Н-[1,3'-біпіридин]-3-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-5-бром-6-(метоксиметил)-2-оксо-1-феніл-1,2-дигідропіридин-3-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-5-ціано-6-(етоксиметил)-2-оксо-1-феніл-1,2-дигідропіридин-3-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-3-(1,4-диметил-1Н-піразол-3-іл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-циклопропіл-2,4-діоксо-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-циклопропіл-2,4-діоксо-3-(піридин-3-іл)-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбокса-
мідү;
N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1'-циклопропіл-2'-метил-4'-оксо-1',4'-дигідро-[2,3'-біпіридин]-5'-карбокса-
мідү;

N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[2,1-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-циклопропіл-2,2'-диметил-4-оксо-1,4-дигідро-[3,3'-біпіридин]-5-карбоксамід;
 N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-(піримідин-2-іл)-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;
 N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-циклопропіл-2,4-діоксо-3-(піридин-2-іл)-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;
 N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-3-(5-фторпіридин-2-іл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;
 N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-4-оксо-5-(піридин-2-іл)-1,4-дигідропіридин-3-карбоксамід;
 N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-циклопропіл-6-метил-4-оксо-5-(піридин-3-іл)-1,4-дигідропіридин-3-карбоксамід;
 N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-3-(1,5-диметил-1H-піразол-3-іл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід; і
 N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-3-(6-метилпіридин-2-іл)-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід;
 або її фармацевтично прийнятної солі.

40. Сполука за п. 1, яка являє собою N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-(піридин-2-іл)-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід, або її фармацевтично прийнятна сіль.

41. Сполука за п. 1, яка являє собою N-(4-(4-аміно-7-(1-ізобутирилпіперидин-4-іл)піроло[1,2-f][1,2,4]триазин-5-іл)феніл)-1-ізопропіл-2,4-діоксо-3-феніл-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-5-карбоксамід, або її фармацевтично прийнятна сіль.

42. Фармацевтична композиція, яка містить сполуку за будь-яким з пп. 1-41 або її фармацевтично прийнятну сіль і фармацевтично прийнятний носій.

43. Спосіб інгібування ТАМ-кінази в клітині пацієнта, який страждає на рак, який включає приведення в контакт ТАМ-кінази зі сполукою за будь-яким з пп. 1-41 або її фармацевтично прийнятною сіллю.

44. Спосіб інгібування AXL і MER-кінази в клітині пацієнта, який страждає на рак, який включає приведення в контакт AXL і MER-кінази зі сполукою за будь-яким з пп. 1-41 або її фармацевтично прийнятною сіллю.

45. Спосіб лікування раку у пацієнта, який включає введення пацієнту терапевтично ефективної кількості сполуки за будь-яким з пп. 1-41 або її фармацевтично прийнятної солі.

46. Спосіб за п. 45, який **відрізняється** тим, що рак вибраний з гепатоцелюлярного раку, раку сечового міхура, раку молочної залози, раку шийки матки, колоректального раку, раку ендометрія, раку шлунка, раку голови і шиї, раку нирки, раку печінки, раку легень, раку яєчників, раку передміхурової залози, раку стравоходу, раку жовчного міхура, раку підшлункової залози, раку щитовидної залози, раку шкіри, лейкозу, множинної мієломи, хронічної лімфоцитар-

ної лімфоми, лейкозу Т-клітин дорослих, лімфоми В-клітин, гострого мієлолейкозу, ходжкінської або неходжкінської лімфоми, макроглобулінемії Вальденст-рема, волосатоклітинної лімфоми, лімфоми Беркіта, гліобластоми, меланоми і рабдоміосаркоми.

47. Спосіб за п. 45, який **відрізняється** тим, що рак являє собою рак легень, рак передміхурової залози, рак товстої кишки, рак молочної залози, меланому, карциному нирок, множинну мієлому, рак шлунка або рабдоміосаркому.

48. Спосіб за п. 45, який **відрізняється** тим, що рак являє собою рак голови і шиї.

49. Спосіб за п. 45, який **відрізняється** тим, що рак являє собою саркому, вибрану з хондросаркоми, саркоми Юїнга, остеосаркоми, рабдоміосаркоми, ангіосаркоми, фібросаркоми, ліпосаркоми, міксом, рабдоміом, рабдосаркоми, фіброми, ліпоми, гамартоми і тератоми.

(11) 123794

(51) МПК (2021.01)

C07D 487/04 (2006.01)

C07D 495/04 (2006.01)

A61K 31/519 (2006.01)

A61P 35/00

(21) а 2019 00217

(22) 09.06.2017

(24) 03.06.2021

(31) 1655392

(32) 10.06.2016

(33) FR

(86) РСТ/ЕР2017/064067, 09.06.2017

(72) Котші Андраш (HU), Вебер Чаба (HU), Вашаш Аттила (HU), Мольнар Балаж (HU), Кішш Арпад (HU), Маціаш Альба (GB), Мюррей Джеймс Брук (GB), Левкович Елоді (FR), Генесте Олів'є (FR), Шанріон Майя (FR), Демерль Дідьє (FR)

(73) ЛЕ ЛАБОРАТУАР СЕРВЬС

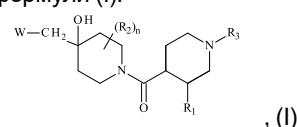
35 rue de Verdun, 92284 Suresnes, France (FR)

БЕРНАЛІС (АР ЕНД ДІ) ЛІМІТЕД

100 Berkshire Place, Wharfedale Road, Berkshire, WINNERSH Berkshire RG41 5RD, United Kingdom (GB)

(54) НОВІ ПОХІДНІ ПІПЕРИДИНІЛУ, СПОСІБ ЇХНЬОГО ОТРИМАННЯ ТА ФАРМАЦЕВТИЧНІ КОМПОЗИЦІЇ, ЩО ЇХ МІСТЯТЬ

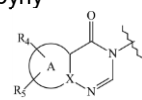
(57) 1. Сполука формули (I):



(I)

де:

- R₁ являє собою арильну групу або гетероарильну групу,
- R₂ являє собою атом водню або атом галогену,
- R₃ являє собою атом водню, нерозгалужену або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу, нерозгалужений або розгалужений гало(C₁-C₆)алкіл, -C(O)-R₈ групу, -C(O)-OR₈ групу,
- n являє собою ціле число, що дорівнює 0, 1 або 2,
- W являє собою групу



де:

A являє собою гетероарильний цикл,

- X являє собою атом вуглецю або атом азоту,

- R₄ являє собою атом водню, атом галогену, нерозгалужену або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу, нерозгалужену або розгалужену (C₂-C₆)алкенільну групу, нерозгалужену або розгалужену (C₂-C₆)алкінільну групу, -Y₁-NR₆R₇ групу, -Y₁-OR₆ групу, нерозгалужену або розгалужену гало(C₁-C₆)алкільну групу, оксогрупу, -Y₁-Cy₁ групу, -Cy₁-R₇ групу, -Cy₁-OR₇ групу, або -Y₁-NR₆-C(O)-R₇ групу,

- R₅ являє собою атом водню, атом галогену, нерозгалужену або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу, ціаногрупу або -гідрокси(C₁-C₆)алкільну групу,

- R₆ являє собою атом водню або нерозгалужену або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу або -Y₂-Si[(C₁-C₄)алкіл]₃ групу,

- R₇ являє собою атом водню, нерозгалужену або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу або -Y₂-Cy₂ групу,

- Y₁ та Y₂ один незалежно від одного являють собою зв'язок або нерозгалужену або розгалужену (C₁-C₄)алкіленову групу,

- R₈ являє собою атом водню або нерозгалужену або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу,

- Cy₁ та Cy₂ один незалежно від одного являють собою циклоалкільну групу, гетероциклоалкільну групу, арильну групу або гетероарильну групу,

зрозуміло, що:

- "арил" означає фенільну, нафтильну або інданільну групу,

- "гетероарил" означає будь-яку моно- або конденсовану біциклічну групу, що складається з від 5 до 10 елементів кільця, які мають щонайменше один ароматичний фрагмент, та що містить від 1 до 3 гетероатомів, вибраних з кисню, сірки та азоту,

- "циклоалкіл" означає будь-яку моно- або конденсовану біциклічну неароматичну карбоциклічну групу, що містить від 3 до 7 елементів кільця,

- "гетероциклоалкіл" означає будь-яку неароматичну моно- або конденсовану біциклічну групу, що містить від 3 до 10 елементів кільця, та що містить від 1 до 3 гетероатомів, вибраних з кисню, сірки та азоту, можливим є, щоб арильні, гетероарильні, циклоалкільні та гетероциклоалкільні групи, визначені таким чином, були заміщені від 1 до 4 групами, вибраними з нерозгалуженого або розгалуженого (C₁-C₆)алкілу, нерозгалуженого або розгалуженого (C₂-C₆)алкенілу, нерозгалуженого або розгалуженого (C₂-C₆)алкінілу, нерозгалуженого або розгалуженого гало(C₁-C₆)алкілу, -Y₁-OR', -Y₁-NR'R'', -Y₁-S(O)_m-R', оксо (або N-оксиду, якщо прийнятно), нітро, ціано, -C(O)-R' -C(O)-OR', -O-C(O)-R', -C(O)-NR'R'' -Y₁-NR'-C(O)-R'', -Y₁-NR'-C(O)-OR'', галогену, циклопропілу та піридинілу, які можуть бути заміщені нерозгалуженою або розгалуженою (C₁-C₆)алкільною групою,

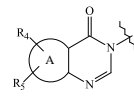
зрозуміло, що R' та R'' один незалежно від одного являють собою атом водню, нерозгалужену або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу, нерозгалужену або розгалужену (C₂-C₆)алкенільну групу, нерозгалужену або розгалужену (C₁-C₆)алкоксигрупу, нерозгалужений або розгалужений гало(C₁-C₆)алкіл, нерозгалужену або розгалужену гідроксі(C₁-C₆)алкільну групу, нерозгалужену або розгалужену (C₁-C₆)алкоксі(C₁-C₆)алкільну групу, фенільну групу, циклопропілметил групу, тетрагідропіранільну групу,

або замісники пари (R', R'') утворюють разом з атомом азоту, на якому вони розташовані, неароматичний цикл, що складається з від 5 до 7 елементів циклу, що може містити додатково до атому азоту другий гетероатом, вибраний з кисню та азоту, зрозуміло, що атом азоту, що розглядається, може бути заміщений від 1 до 2 груп, що являють собою атом водню або нерозгалужену або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу,

та зрозуміло, що m являє собою ціле число, що дорівнює 0, 1 та 2,

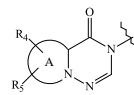
її енантіомери, діастереомери та їхні адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

2. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що W являє собою групу



де R₄, R₅ та A є такими, як визначено у п. 1.

3. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що W являє собою групу



де R₄, R₅ та A є такими, як визначено у п. 1.

4. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що R₁ являє собою фенільну групу.

5. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що R₂ являє собою атом водню.

6. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що R₃ являє собою атом водню, метильну групу,

-CH₂-CH(CH₃)₂ групу, -CH₂-CF₃ групу, -C(O)-CH₃ групу, -C(O)-CH(CH₃)₂ групу, -C(O)-CH₂-C(CH₃)₃ групу або -C(O)-OC(CH₃)₃ групу.

7. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що R₄ являє собою атом водню, нерозгалужену або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу, нерозгалужену або розгалужену (C₂-C₆)алкенільну групу, нерозгалужену або розгалужену (C₂-C₆)алкінільну групу, -Y₁-NR₆R₇ групу, -Y₁-OR₆ групу, нерозгалужену або розгалужену гало(C₁-C₆)алкільну групу, -Y₁-Cy₁ групу, -Cy₁-R₇ групу або -Cy₁-OR₇ групу.

8. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що R₅ являє собою атом водню, атом йоду, атом хлору, метильну групу або -CH₂-OH групу.

9. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що R₆ являє собою атом водню, метильну групу або -(CH₂)₂-Si(CH₃)₃ групу.

10. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що R₇ являє собою атом водню, метильну групу або -CH₂-Cy₂ групу.

11. Сполука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що являє собою:

- трет-бутил-(3S,4S)-4-[(4-гідрокси-4-[(4-оксотієно[2,3-d]піримідин-3(4H)-іл)метил]піперидин-1-іл)карбоніл]-3-фенілпіперидин-1-карбоксилат;

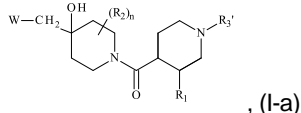
- трет-бутил-(3R,4R)-4-[(4-гідрокси-4-[(4-оксо-7-(піридин-2-іл)-4,7-дигідро-3H-піроло[2,3-d]піримідин-3-іл)метил]піперидин-1-іл)карбоніл]-3-фенілпіперидин-1-карбоксилат;

- трет-бутил-(3R,4R)-4-[(4-гідрокси-4-[(7-(4-метокси-феніл)-4-оксо-4,7-дигідро-3H-піроло[2,3-d]піримідин-3-іл)метил]піперидин-1-іл)карбоніл]-3-фенілпіперидин-1-карбоксилат;

сполуку формули (V) додатково піддають реакції сполучення зі сполукою формули (VI):

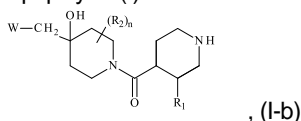


де W є таким, як визначено для формули (I), з отриманням сполуки формули (I-a), окремого випадку сполук формули (I):



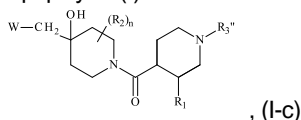
де R₁, R₂, R₃', n та W є такими, як визначено у цій заявці вище,

де сполука формули (I/a) може бути потім, за необхідності, піддана реакції з видаленням R₃' групи, з отриманням сполуки формули (I-b), окремого випадку сполук формули (I):



де R₁, R₂, n та W є такими, як визначено у цій заявці вище,

де сполука формули (I/b) може бути потім, за необхідності, піддана реакції сполучення зі сполукою формули R₃'-Cl, де R₃' являє собою нерозгалужену або розгалужену (C₁-C₆)алкільну групу, нерозгалужений або розгалужений гало(C₁-C₆)алкіл, або -C(O)-R₈ групу, де R₈ є таким, як визначено для формули (I), з отриманням сполуки формули (I-c), окремого випадку сполук формули (I):



де R₁, R₂, R₃', n та W є такими, як визначено у цій заявці вище,

де сполуки формул (I-a)-(I-c), які складають сукупність сполук формули (I), можуть бути потім очищені за звичайною методикою розділення, та при бажанні перетворені на їх адитивну сіль з фармацевтично прийнятною кислотою або основою, яку не обов'язково розділяють на ізомери, відповідно до традиційної методики розділення, зрозуміло, що у будь-який момент, який вважається доцільним в ході описаного вище процесу, деякі групи (гідрокси, аміно ...) вихідних реагентів або проміжних сполук синтезу можуть бути захищені, з наступним видаленням захисної групи та функціоналізовані, як того вимагає синтез.

13. Фармацевтична композиція, яка містить сполуку формули (I) за будь-яким із пп. 1-11 або її адитивну сіль з фармацевтично прийнятною кислотою або основою в комбінації з одним чи більше фармацевтично прийнятних ексципієнтів.

14. Фармацевтична композиція за п. 13 для застосування як проапоптотичного та/або антипроліферативного агентів.

15. Фармацевтична композиція за п. 14 для застосування у лікуванні ракових захворювань та аутоімунних захворювань та захворювань імунної системи.

16. Фармацевтична композиція за п. 15 для застосування у лікуванні ракових захворювань сечового міхура, головного мозку, молочної залози та матки, хронічного лімфоїдного лейкозу, раку товстої кишки,

стравоходу та печінки, лімфобластної лейкемії, гострої мієлоїдної лейкемії, лімфом, меланоми, злоякісних гемопатій, мієлом, раку яєчників, недрібноклітинного раку легень, раку передміхурової залози, раку підшлункової залози та дрібноклітинного раку легень.

17. Застосування фармацевтичної композиції за п. 13 у виробництві медикаментів для застосування як проапоптотичних та/або антипроліферативних агентів.

18. Застосування фармацевтичної композиції за п. 13 у виробництві медикаментів для застосування в лікуванні ракових захворювань та аутоімунних захворювань та захворювань імунної системи.

19. Застосування фармацевтичної композиції за п. 13 у виробництві медикаментів для застосування в лікуванні ракових захворювань сечового міхура, головного мозку, молочної залози та матки, хронічного лімфоїдного лейкозу, раку товстої кишки, стравоходу та печінки, лімфобластної лейкемії, гострої мієлоїдної лейкемії, лімфом, меланоми, злоякісних гемопатій, мієлом, раку яєчників, недрібноклітинного раку легень, раку передміхурової залози, раку підшлункової залози та дрібноклітинного раку легень.

20. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-11 або її адитивна сіль з фармацевтично прийнятною кислотою чи основою для застосування в лікуванні ракових захворювань сечового міхура, головного мозку, молочної залози та матки, хронічного лімфоїдного лейкозу, раку товстої кишки, стравоходу та печінки, лімфобластної лейкемії, гострої мієлоїдної лейкемії, лімфом, меланоми, злоякісних гемопатій, мієлом, раку яєчників, недрібноклітинного раку легень, раку передміхурової залози, раку підшлункової залози та дрібноклітинного раку легень.

21. Застосування сполуки формули (I) за будь-яким з пп. 1-11 або її адитивної солі з фармацевтично прийнятною кислотою чи основою у виготовленні медикаментів для застосування в лікуванні ракових захворювань сечового міхура, головного мозку, молочної залози та матки, хронічного лімфоїдного лейкозу, раку товстої кишки, стравоходу та печінки, лімфобластної лейкемії, гострої мієлоїдної лейкемії, лімфом, меланоми, злоякісних гемопатій, мієлом, раку яєчників, недрібноклітинного раку легень, раку передміхурової залози, раку підшлункової залози та дрібноклітинного раку легень.

22. Комбінація сполуки формули (I) за будь-яким з пп. 1-11 з протираковими агентами, вибраними з генотоксичних агентів, мітотоксичних отрут, антиметаболітів, інгібіторів протеасоми, інгібіторів кінази, інгібіторів взаємодії білок-білок, імуномодуляторів, інгібіторів Е3-лігази, терапії Т-клітинним химерним антигенним рецептором та антитілами.

23. Фармацевтична композиція, яка містить комбінацію за п. 22, у комбінації з одним чи більше фармацевтично прийнятних ексципієнтів.

24. Комбінація за п. 22 для застосування у лікуванні ракових захворювань.

25. Застосування комбінації за п. 22 у виготовленні медикаментів для застосування у лікуванні ракових захворювань.

26. Сполуки формули (I) за будь-яким з пп. 1-11 для застосування у лікуванні ракових захворювань, що потребують променевої терапії.

(11) 123775

(51) МПК

C07D 498/10 (2006.01)

A61K 31/5386 (2006.01)

A61P 25/32 (2006.01)

A61P 25/34 (2006.01)

A61P 25/36 (2006.01)

(21) а 2018 06353

(22) 15.11.2016

(24) 03.06.2021

(31) 15382566.6

(32) 16.11.2015

(33) EP

(86) PCT/EP2016/001907, 15.11.2016

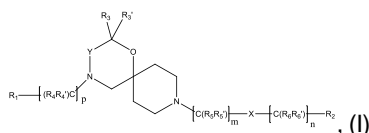
(72) Віргілі-Бернадо Маріна (ES), Алманса-Росалес Кармен (ES), Алегрет-Моліна Карлос (ES)

(73) ЕСТЕВ ФАРМАС'ЮТИКАЛЗ, С.А.

Passeig de la Zona Franca, 109, 4a Planta, 08038, Barcelona, Spain (ES)

(54) ОКСАДІАЗСПІРОСПОЛУКИ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ЗЛОВЖИВАННЯ НАРКОТИЧНИМИ ЗАСОБАМИ ТА ЗАЛЕЖНОСТІ ВІД НИХ

(57) 1. Сполука із загальною формулою (I):



де

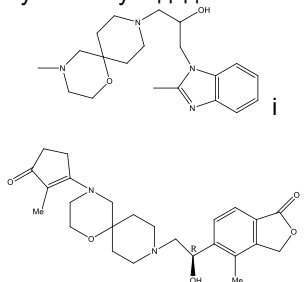
р дорівнює 0 або 1, або 2; переважно р дорівнює 0 або 1;

m дорівнює 1, 2 або 3;

n дорівнює 0, 1 або 2;

Y являє собою -CH₂- або -C(O)-;X являє собою зв'язок -C(R_xR_x')-, -C(O)- або -O-;де R_x вибраний із галогену, заміщеного або незаміщеного С₁-алкілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкенілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкінілу й -OR₈;R_x' вибраний із водню, галогену або заміщеного або незаміщеного С₁-алкілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкенілу та заміщеного або незаміщеного С₂-алкінілу;R₈ вибраний із водню, заміщеного або незаміщеного С₁-алкілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкенілу та заміщеного або незаміщеного С₂-алкінілу;R₁ вибраний із заміщеного або незаміщеного С₁-алкілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкенілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкінілу та заміщеного або незаміщеного циклоалкілу;де зазначений циклоалкіл у R₁, якщо заміщений, є заміщеним одним або більше замісником/ами, вибраними з галогену, -R₁₁, -OR₁₁, -NO₂, -NR₁₁R₁₁'", -NR₁₁C(O)R₁₁', -NR₁₁S(O)₂R₁₁', -S(O)₂NR₁₁R₁₁', -NR₁₁C(O)NR₁₁R₁₁', -SR₁₁, -S(O)R₁₁, S(O)₂R₁₁, -CN, галогеналкілу, галогеналкокси, -C(O)OR₁₁, -C(O)NR₁₁R₁₁', -OCH₂CH₂OH, -NR₁₁S(O)₂NR₁₁R₁₁' і C(CH₃)₂OR₁₁;крім того, циклоалкіл у R₁, якщо заміщений, може також бути заміщений на ∇ або =O;де алкіл, алкеніл або алкініл у R₁, якщо заміщений, є заміщеним одним або більше замісником/ами, вибраними з -OR₁₁, галогену, -CN, галогеналкілу, галогеналкокси та -NR₁₁R₁₁'";де R₁₁, R₁₁' і R₁₁" незалежно вибрані з водню, незаміщеного С₁-алкілу, незаміщеного С₂-алкенілу та незаміщеного С₂-алкінілу;і де R₁₁" вибраний з водню, незаміщеного С₁-алкілу, незаміщеного С₂-алкенілу, незаміщеного С₂-алкінілу та -Вос;R₂ вибраний із водню, заміщеного або незаміщеного С₁-алкілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкенілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкінілу, заміщеного або незаміщеного циклоалкілу, заміщеного або незаміщеного арилу та заміщеного або незаміщеного гетероциклілу,де зазначений циклоалкіл, арил або гетероцикліл у R₂, якщо заміщений, є заміщеним одним або більше замісником/ами, вибраними з галогену, -R₁₂, -OR₁₂, -NO₂, -NR₁₂R₁₂'", NR₁₂C(O)R₁₂', -NR₁₂S(O)₂R₁₂', -S(O)₂NR₁₂R₁₂', -NR₁₂C(O)NR₁₂R₁₂', -SR₁₂, -S(O)R₁₂, S(O)₂R₁₂, -CN, галогеналкілу, галогеналкокси, -C(O)OR₁₂, -C(O)NR₁₂R₁₂', -OCH₂CH₂OH, -NR₁₂S(O)₂NR₁₂R₁₂' і C(CH₃)₂OR₁₂;крім того, циклоалкіл або неароматичний гетероцикліл у R₂, якщо заміщений, може також бути заміщений на ∇ або =O;де алкіл, алкеніл або алкініл у R₂, якщо заміщений, є заміщеним одним або більше замісником/ами, вибраними з -OR₁₂, галогену, -CN, галогеналкілу, галогеналкокси та -NR₁₂R₁₂'";де R₁₂, R₁₂' і R₁₂" незалежно вибрані з водню, незаміщеного С₁-алкілу, незаміщеного С₂-алкенілу та незаміщеного С₂-алкінілу;і де R₁₂" вибраний з водню, незаміщеного С₁-алкілу, незаміщеного С₂-алкенілу, незаміщеного С₂-алкінілу та -Вос;R₃ і R₃' незалежно вибрані з водню, заміщеного або незаміщеного С₁-алкілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкенілу та заміщеного або незаміщеного С₂-алкінілу;альтернативно, R₃ і R₃', що взяті разом із з'єднуючим С-атомом, можуть утворювати заміщений або незаміщений циклоалкіл;R₄ і R₄' незалежно вибрані з водню, заміщеного або незаміщеного С₁-алкілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкенілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкінілу, -CHOR₉ і -C(O)OR₉;де R₉ вибраний із водню, заміщеного або незаміщеного С₁-алкілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкенілу та заміщеного або незаміщеного С₂-алкінілу;R₅ і R₅' незалежно вибрані з водню, заміщеного або незаміщеного С₁-алкілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкенілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкінілу, -CHOR₇ і -C(O)OR₇;де R₇ вибраний із водню, заміщеного або незаміщеного С₁-алкілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкенілу та заміщеного або незаміщеного С₂-алкінілу;альтернативно, R₅ і R₅', що взяті разом із з'єднуючим С-атомом, можуть утворювати заміщений або незаміщений циклоалкіл, або заміщений або незаміщений неароматичний гетероцикліл;R₆ і R₆' незалежно вибрані з водню, заміщеного або незаміщеного С₁-алкілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкенілу, заміщеного або незаміщеного С₂-алкінілу, -OR₁₀, -CHOR₁₀ і -C(O)OR₁₀;де R₁₀ вибраний із водню, заміщеного або незаміщеного С₁-алкілу, заміщеного або незаміщеного С₂-

алкенілу та заміщеного або незаміщеного C₂₋₆алкінілу;
необов'язково у вигляді одного зі стереоізомерів, переважно енантіомерів або діастереомерів, рацемату або у вигляді суміші щонайменше двох стереоізомерів, переважно енантіомерів і/або діастереомерів, у будь-якому співвідношенні компонентів у суміші, або їх відповідної солі, або їх відповідного сольовату; із застосуванням наступних умов:
коли Y являє собою -C(O)-, а R₂ являє собою заміщений або незаміщений арил, або заміщений або незаміщений гетероциклі, тоді -[CR₅R₅]_m-X-[CR₆R₆]_n- не є ані -CH₂CH₂-, ані -CH₂CH(OH)-, а R₃ не є воднем; причому наступні сполуки додатково виключені:

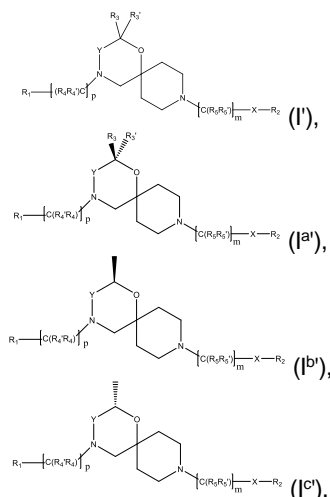


2. Сполука за п. 1, де

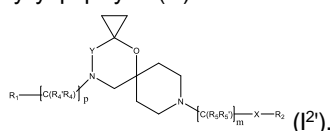
R₃ вибраний із заміщеного або незаміщеного C₁₋₆-алкілу, заміщеного або незаміщеного C₂₋₆алкенілу, заміщеного або незаміщеного C₂₋₆алкінілу;
R₃' вибраний із водню, заміщеного або незаміщеного C₁₋₆алкілу, заміщеного або незаміщеного C₂₋₆алкенілу та заміщеного або незаміщеного C₂₋₆алкінілу; альтернативно, R₃ і R₃', що взяті разом із з'єднуючим C-атомом, можуть утворювати заміщений або незаміщений циклоалкіл.

3. Сполука за пп. 1-2, де R₃ являє собою заміщений або незаміщений C₁₋₆алкіл, а R₃' являє собою водень.

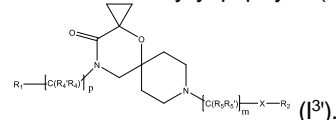
4. Сполука за будь-яким із пп. 1-3, де сполука формули (I) являє собою сполуку формули (I'), (I^a'), (I^b') або (I^c')



5. Сполука за пп. 1-4, де сполука формули (I) являє собою сполуку формули (I²):

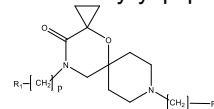


6. Сполука за будь-яким із пп. 1-5, де сполука формули (I) являє собою сполуку формули (I³):



7. Сполука за будь-яким із пп. 1-6, де X являє собою зв'язок або -O-.

8. Сполука за будь-яким із пп. 1-7, де сполука формули (I) являє собою сполуку формули (I⁴):



(I⁴).

9. Сполука за будь-яким із пп. 1-8, де

R₁ являє собою заміщений або незаміщений C₁₋₆алкіл; більш переважно R₁ являє собою заміщену або незаміщену групу, вибрану з метилу, етилу та пропілу, ще більш переважно R₁ являє собою незаміщену групу, вибрану з метилу, етилу та пропілу.

10. Сполука за будь-яким із пп. 1-9, де R₂ вибраний із водню, заміщеного або незаміщеного C₁₋₆алкілу, заміщеного або незаміщеного арилу та заміщеного або незаміщеного гетероциклілу; більш переважно R₂ являє собою водень або заміщену або незаміщену групу, вибрану з метилу, етилу, пропілу, ізопропілу, ізобутилу, фенілу та піридину; більш переважно водень або незаміщену групу, вибрану з метилу, етилу, пропілу, ізопропілу та ізобутилу, або заміщену або незаміщену групу, вибрану з фенілу та піридину.

11. Сполука за будь-яким із пп. 1-10, де сполука вибрана із наступних:

1	12-етил-8-ізопентил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
2	4-етил-9-ізопентил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
3	8-ізопентил-12-метил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
4	(R)-4-етил-9-ізопентил-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
5	8-ізопентил-12-ізопропіл-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
6	12-етил-8-ізобутил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
7	(S)-4-етил-9-ізопентил-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
8	12-етил-8-(2-ізопропоксиетил)-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
9	8-ізопентил-12-пропіл-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
10	12-ізобутил-8-ізопентил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
12	8-бутил-12-етил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
13	8-(2-етоксіетил)-12-етил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
14	8-циклопентил-12-етил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
15	4-етил-9-ізопентил-2,2-диметил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
16	12-етил-8-(4-фторбензил)-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он

17	8-бензил-12-етил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
18	8-бензил-12-метил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
19	(R)-9-бензил-4-етил-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
20	8-бензил-12-ізопропіл-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
21	8,12-діетил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
22	(S)-9-бензил-4-етил-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
23	12-етил-8-(3-фторбензил)-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
24	8-(3,4-дифторбензил)-12-етил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
25	12-етил-8-(піридин-3-ілметил)-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
26	8-бензил-12-пропіл-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
27	8-бензил-12-ізобутил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
28	12-етил-8-(піридин-4-ілметил)-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
29	12-етил-8-(піридин-2-ілметил)-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
30	12-етил-8-пропіл-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
31	12-етил-8-(2-фторбензил)-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
32	9-бензил-4-етил-2,2-диметил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
33	8-циклобутил-12-етил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
34	8-циклогексил-12-етил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
35	12-етил-8-(тетрагідро-2H-піран-4-іл)-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
36	8-(2-(3-фторпіридин-2-іл)етил)-12-ізопропіл-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан
37	9-(2-(3-фторпіридин-2-іл)етил)-4-ізопропіл-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан
38	(S)-9-(2-(3-фторпіридин-2-іл)етил)-4-ізопропіл-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан
39	(R)-9-(2-(3-фторпіридин-2-іл)етил)-4-ізопропіл-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан
40	8-(2-(3-фторпіридин-2-іл)етил)-12-пропіл-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан
41	12-етил-8-(2-(3-фторпіридин-2-іл)етил)-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан
42	8-(2-(3-фторпіридин-2-іл)етил)-12-ізобутил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан
43	8-(2-(3-фторпіридин-2-іл)етил)-12-метил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан

і/або

44	(S)-9-ізопентил-4-ізопропіл-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
45	9-ізопентил-4-ізопропіл-2,2-диметил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он

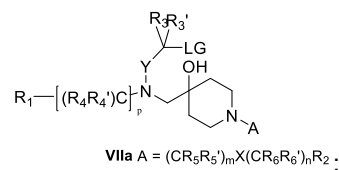
46	8-(2,5-дифторфенетил)-12-ізобутил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан
47	12-ізобутил-8-(2-(6-метоксипіридин-2-іл)етил)-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан
48	9-(3,3-диметилбутил)-4-пропіл-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
49	9-ізопентил-4-пропіл-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
50	9-(3,3-диметилбутил)-4-ізопропіл-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
51	9-(3,3-диметилбутил)-4-етил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
52	(S)-9-(3,3-диметилбутил)-4-етил-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
53	9-ізопентил-4-ізопропіл-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
54	9-ізопентил-2,2-диметил-4-пропіл-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
55	(S)-9-ізопентил-2-метил-4-пропіл-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
56	4-циклопропіл-9-ізопентил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
57	(S)-9-(2-ізопропоксиетил)-4-ізопропіл-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
58	(S)-4-циклопропіл-9-ізопентил-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
59	4-циклопропіл-9-(2-ізопропоксиетил)-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
60	(S)-4-етил-9-(2-ізопропоксиетил)-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
61	9-(2-ізопропоксиетил)-4-ізопропіл-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
62	(S)-4-циклопропіл-9-(2-ізопропоксиетил)-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
63	(S)-9-(2-циклопропілетил)-4-етил-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
64	9-(2-циклопропілетил)-4-етил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
65	(S)-9-(2-циклопропілетил)-4-ізопропіл-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
66	(S)-9-(2-ізопропоксиетил)-2-метил-4-пропіл-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
67	8-(4-фторбензил)-12-метил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
68	4-етил-9-(4-фторбензил)-2,2-диметил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
69	(S)-9-(4-фторбензил)-4-ізопропіл-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
70	(R)-4-етил-9-(4-фторбензил)-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
71	(S)-4-етил-9-(4-фторбензил)-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
72	(S)-9-(4-хлорбензил)-4-етил-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
73	(R)-9-(4-хлорбензил)-4-етил-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
74	(R)-4-((4-етил-2-метил-3-оксо-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-9-іл)метил)бензонітрил

75	(R)-4-етил-9-(4-метоксибензил)-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
76	9-(4-хлорбензил)-4-етил-2,2-диметил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
77	4-((4-етил-2,2-диметил-3-оксо-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-9-іл)метил)бензонітрил
78	4-етил-9-(4-метоксибензил)-2,2-диметил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
79	(S)-4-етил-2-метил-9-неопентил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
80	(S)-4-етил-9-(4-метоксибензил)-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
81	(S)-4-((4-етил-2-метил-3-оксо-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-9-іл)метил)бензонітрил
82	(R)-4-((2,4-диметил-3-оксо-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-9-іл)метил)бензонітрил
83	(S)-4-((4-ізопропіл-2-метил-3-оксо-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-9-іл)метил)бензонітрил
84	(R)-9-(4-фторбензил)-2,4-диметил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
85	(S)-4-циклопропіл-9-(4-фторбензил)-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
86	(S)-9-бензил-4-циклопропіл-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
87	(S)-4-((4-циклопропіл-2-метил-3-оксо-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-9-іл)метил)бензонітрил
88	(S)-4-((2,4-диметил-3-оксо-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-9-іл)метил)бензонітрил
89	(S)-9-(4-фторбензил)-2,4-диметил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
90	(S)-9-бензил-2,4-диметил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
91	(S)-2,4-диметил-9-(4-(трифторметокси)бензил)-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
92	(S)-3-((4-етил-2-метил-3-оксо-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-9-іл)метил)бензонітрил
93	(S)-4-((4-етил-2-метил-3-оксо-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-9-іл)метил)-2-фторбензонітрил
94	(S)-5-((4-етил-2-метил-3-оксо-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-9-іл)метил)-2-фторбензонітрил
95	(S)-9-(2,4-дифторбензил)-4-етил-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
96	(S)-3-((4-ізопропіл-2-метил-3-оксо-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-9-іл)метил)бензонітрил
97	(S)-9-бензил-4-ізопропіл-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
98	(R)-9-бензил-4-ізопропіл-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
99	(R)-9-(4-фторбензил)-4-ізопропіл-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-3-он
100	(R)-4-((4-ізопропіл-2-метил-3-оксо-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан-9-іл)метил)бензонітрил
101	8-(2-(3-хлорпіридин-2-іл)етил)-12-ізобутил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан

102	2-(2-(12-ізобутил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-8-іл)етил)нікотинітрил
103	8-(2-(3-фторпіридин-2-іл)етил)-12-ізопентил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан
104	8-(2-(3-фторпіридин-2-іл)етил)-12-неопентил-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан
105	12-(втор-бутил)-8-(2-(3-фторпіридин-2-іл)етил)-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан
106	4-етил-9-(2-(3-фторпіридин-2-іл)етил)-2,2-диметил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан
107	(S)-4-етил-9-(2-(3-фторпіридин-2-іл)етил)-2-метил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан
108	(S)-9-(2-(3-фторпіридин-2-іл)етил)-2-метил-4-пропіл-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан
109	4-ізопропіл-2-метил-9-фенетил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан
111	4-(циклопропілметил)-9-фенетил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан
112	4-етил-2-метил-9-фенетил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан
113	4-ізопропіл-2,2-диметил-9-фенетил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан

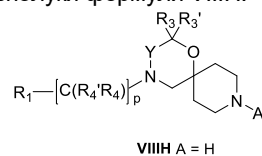
12. Спосіб одержання сполук формули (I) за будь-яким із пп. 1-11, що включає:

а) внутрішньомолекулярну циклізацію сполуки формули VIIa:

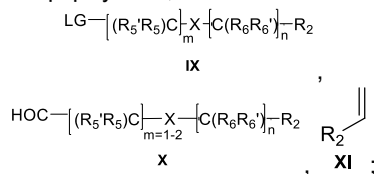


або

б) реакцію сполуки формули VIIIH:

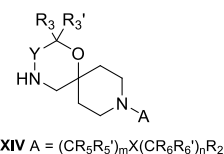


зі сполукою формули IX, X або XI:

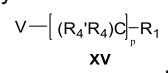


або

с1) коли Y являє собою CH₂ шляхом алкілювання сполуки формули XIV:

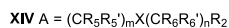
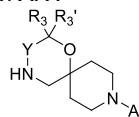


зі сполукою формули XV:

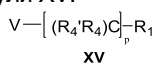


причому сполука формули XV являє собою алкілюючий засіб, а V являє собою відхідну групу, або, альтернативно, шляхом реакції відновного амінування сполуки формули XIV, за допомогою сполуки формули XV, причому сполука формули XV являє собою альдегід, а V являє собою C(O)H групу; або

c2) коли Y являє собою C(O) шляхом алкілювання сполуки формули XIV:

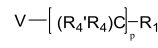
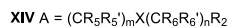
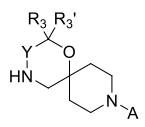
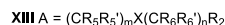
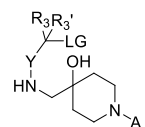
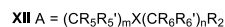
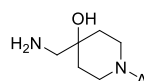
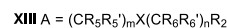
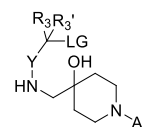
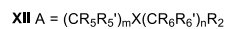
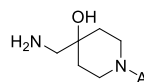
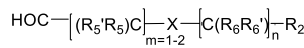
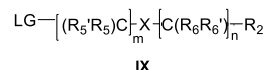
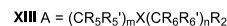
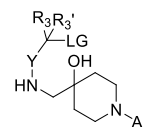
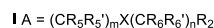
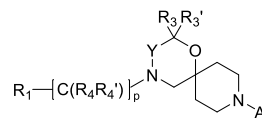
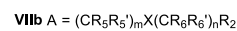
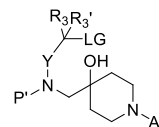
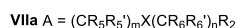
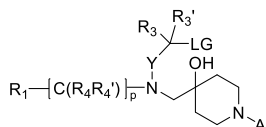
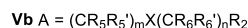
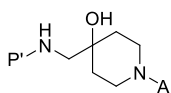
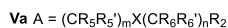
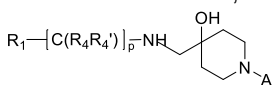
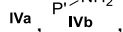
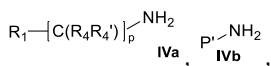
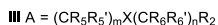
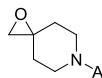
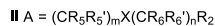
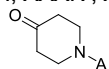


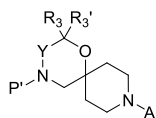
зі сполукою формули XV:



причому сполука формули XV являє собою алкілюючий засіб, а V являє собою відхідну групу.

13. Застосування однієї або більше сполук формули: II, IIP, III, IIIP, IVa, IVb, Vb, VbP, Va, VaP, VI, VIIa, VIIb, VIIbP, VIIIbP, VIIIH, IX, X, XI, XII, XIIIP, XIII, XIIIP, XIV, XIVP, XIVH, XV, XVI, XVIIP, XVIIH, Ia, XVIIIP, XVIII, Ib, XVIIIIP, Ic, XIXP, XIXH, Id, XXP, XXH, XXI, XXIP, XXIH, XXII, XXIIIP, XXIIH, XXIII, XXIIIP, XXIIH, XXIV, XXIVP, XXIVH, XXV, XXVP, XXVH, Ie, XXVIP, XXVIH, XXVIIa, XXVIIb, XXVIIc, If, XXVIIIIP, XXVIIIH, Ig, XXIXP, XXIXH, Ih, XXXP, XXXH, XXXI, XXXIP, XXXIH, XXXII, XXXIIP, XXXIIH, XXXIII, XXXIIIP, XXXIIH, XXXIV, XXXIIP або XXXIVH,

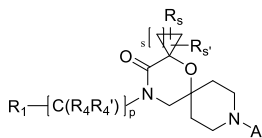




XVI A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XVIP A = P

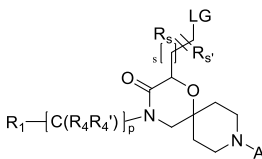
XVIH A = H



Ia A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

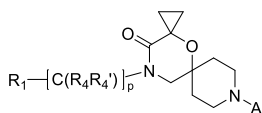
XVIIP A = P

XVIIH A = H



Ib A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XVIIP A = P

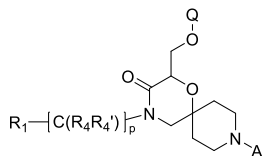


XIXH A = H

Ic A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XIXP A = P

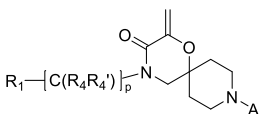
XIXH A = H



Id A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XXP A = P

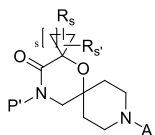
XXH A = H



XXI A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XXIP A = P

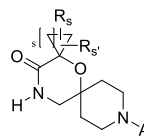
XXIH A = H



XXII A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XXIIP A = P

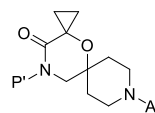
XXIIH A = H



XXIII A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XXIIIP A = P

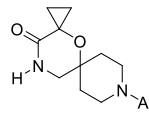
XXIIH A = H



XXIV A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XXIVP A = P

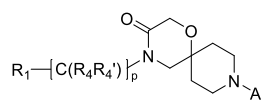
XXIVH A = H



XXV A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XXVP A = P

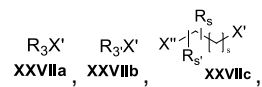
XXVH A = H



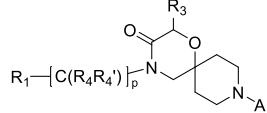
Ie A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XXVIP A = P

XXVIH A = H



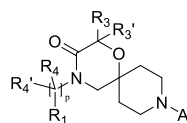
XXVIIa, **XXVIIb**, **XXVIIc**



If A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XXVIIIIP A = P

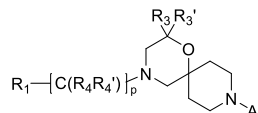
XXVIIIH A = H



Ig A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XXIXP A = P

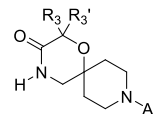
XXIXH A = H



Ih A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XXXP A = P

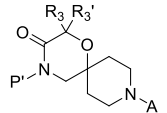
XXXH A = H



XXXI A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XXXIP A = P

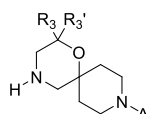
XXXIH A = H



XXXII A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XXXIIP A = P

XXXIIH A = H

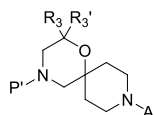


XXXIII A = (CR₅R_{5'})_mX(CR₆R_{6'})_nR₂

XXXIIP A = P

XXXIIH A = H

a60



XXXIV A = (CR₅R₅)_mX(CR₆R₆)_nR₂
 XXXIVP A = P
 XXXIVH A = H

для одержання сполук формули (I) за будь-яким із пп. 1-11.

14. Фармацевтична композиція, що містить сполуку формули (I) за будь-яким із пп. 1-11 або її фармацевтично прийнятну сіль і фармацевтично прийнятний носій, допоміжну речовину або основу.

15. Сполука формули (I) за будь-яким із пп. 1-11 для застосування як лікарського засобу.

16. Сполука формули (I) за будь-яким із пп. 1-11 для застосування як лікарського засобу; переважно для застосування як лікарського засобу для лікування зловживання наркотичними засобами та залежності від них.

17. Сполука, що вибрана з наступного:

11	12-етил-8-(2-феноксіетил)-4-окса-8,12-діазадиспіро[2.1.5.3]тридекан-13-он
110	4-(2-циклопропілетил)-2-метил-9-фенетил-1-окса-4,9-діазаспіро[5.5]ундекан

необов'язково у вигляді одного зі стереоізомерів, переважно енантіомерів або діастереомерів, рацемату, або у вигляді суміші щонайменше двох стереоізомерів, переважно енантіомерів і/або діастереомерів, у будь-якому співвідношенні компонентів у суміші, або їх відповідної солі.

ний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль вибрані з:

Ac-[(D)Phe]-[Pen]-NTWQ[Pen]-[Phe(4-OMe)]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-[Cit]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:679);

Ac-[(D)Phe]-[Pen]-NTWQ[Pen]-[Phe(4-OMe)]-[2-Nal]-[Acb]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:681);

Ac-[Pen]-NTWQ[Pen]-[Phe(4-CONH₂)]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:682);

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[α-Me-Lys]-[Lys(ізовалеріанова кислота)]-NG-NH₂ (SEQ ID NO:861);

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-QNG-NH₂ (SEQ ID NO:877);

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NA-NH₂ (SEQ ID NO:880);

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-(ацетиламіноетокси)]]-[2-Nal]-[α-Me-Lys(Ac)]-[Lys(Ac)]-NG-NH₂ (SEQ ID NO:900);

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[α-Me-Lys]-ENQ-NH₂ (SEQ ID NO:911);

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[α-Me-Lys]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:912);

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[α-MeVal]-[Lys(Ac)]-NG-NH₂ (SEQ ID NO:915);

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[α-Me-Leu]-[Cit]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:954);

Ac-[(D)Phe]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[α-Me-Lys]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:970);

Ac-T-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[α-Me-Lys]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:972);

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Acb]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:976);

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Acb]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:977)

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:980);

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[α-Me-Leu]-QNG-NH₂ (SEQ ID NO:983);

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[α-Me-Leu]-QN(β-Ala)-NH₂ (SEQ ID NO:984);

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[α-Me-Leu]-QDG-NH₂ (SEQ ID NO:985);

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-QN(β-Ala)-NH₂ (SEQ ID NO:987);

Ac-(D)Phe-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:992);

Ac-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:993);

Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Acp]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:1043);

[Palm]-[isoGlu]-[ПЕГ4]-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1115);

Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(ПЕГ4-isoGlu-Palm)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1116);

Ac-[Pen]-QWQC-[Pen]-Phe(4-CONH₂)-[2-Nal]-[α-Me-Lys(Ac)]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1117);

[Октаніл]-[isoGlu]-[ПЕГ4]-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1118);

[Октаніл]-[ПЕГ4]-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1119);

[Октаніл]-[ПЕГ4]-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1119);

[Октаніл]-[ПЕГ4]-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1119);

(11) 123772

(51) МПК

C07K 7/08 (2006.01)

C07K 7/52 (2006.01)

A61K 38/10 (2006.01)

A61K 38/12 (2006.01)

A61P 1/04 (2006.01)

(21) а 2018 01482

(22) 15.07.2016

(24) 03.06.2021

(31) PCT/US15/40658

(32) 15.07.2015

(33) US

(31) 14/800,627

(32) 15.07.2015

(33) US

(31) 62/264,820

(32) 08.12.2015

(33) US

(31) 62/281,123

(32) 20.01.2016

(33) US

(86) PCT/US2016/042680, 15.07.2016

(72) Борн Грегорі (AU), Чен Сяолі (US), Фредерік Брайан Трой (US), Чжан Цзе (AU), Пател Дінеш В. (US), Лю Девід (US), Бхандарі Ашок (US)

(73) ПРОТАГОНИСТ ТЕРЕПЬЮТИКС, ІНК.

521 Cottonwood Drive, Suite A, Milpitas, California 95035, United States of America (US)

(54) ПЕПТИДНИЙ ІНГІБІТОР РЕЦЕПТОРА ІНТЕРЛЕЙКІНУ-23 ТА СПОСІБ ЛІКУВАННЯ ЗАПАЛЬНОГО ЗАХВОРЮВАННЯ КИШЕЧНИКУ (IBD)

(57) 1. Пептидний інгібітор рецептора інтерлейкіну-23 або його фармацевтично придатна сіль, причому пептид-

[Palm]-[ПЕГ4]-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1120);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(ПЕГ4-октаніл)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1121);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(ПЕГ4-Palm)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1122);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-(ПЕГ4-Palm)]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1123);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-(ПЕГ4-лаурил)]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1124);
 Ac-[Pen]-QWQ-[Pen]-Phe(4-CONH₂)-[2-Nal]-[α-Me-Lys(ПЕГ4-Palm)-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1125);
 Ac-[Pen]-QWQ-[Pen]-Phe(4-CONH₂)-[2-Nal]-[α-Me-Lys(ПЕГ4-лаурил)]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1126);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-(ПЕГ4-IsoGlu-Palm)]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1127);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-(ПЕГ4-IsoGlu-лаурил)]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1128);
 Ac-[Pen]-QWQ-[Pen]-Phe(4-CONH₂)-[2-Nal]-[α-Me-Lys(ПЕГ4-IsoGlu-Palm)]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1129);
 Ac-[Pen]-QWQ-[Pen]-Phe(4-CONH₂)-[2-Nal]-[α-Me-Lys(ПЕГ4-IsoGlu-лаурил)]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1130);
 Ac-[Pen]-QWQ-[Pen]-Phe(4-CONH₂)-[2-Nal]-[α-Me-Lys(IVA)]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1131);
 Ac-[Pen]-QWQ-[Pen]-Phe(4-CONH₂)-[2-Nal]-[α-Me-Lys(біотин)]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1132);
 Ac-[Pen]-QWQ-[Pen]-Phe(4-CONH₂)-[2-Nal]-[α-Me-Lys(октаніл)]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1133);
 Ac-[Pen]-[Lys(IVA)]-TWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1134);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-[Lys(IVA)]-N-NH₂ (SEQ ID NO:1135);
 Ac-[Pen]-[Lys(біотин)]-TWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1136);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-[Lys(біотин)]-N-NH₂ (SEQ ID NO:1137);
 Ac-[Pen]-[Lys(Октаніл)]-TWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1138);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-[Lys(октаніл)]-N-NH₂ (SEQ ID NO:1139);
 Ac-[Pen]-[Lys(Palm)]-TWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1140);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-[Lys(Palm)]-N-NH₂ (SEQ ID NO:1141);
 Ac-[Pen]-[Lys(ПЕГ8)]-TWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1142);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-[Lys(ПЕГ8)]-N-NH₂ (SEQ ID NO:1143);
 Ac-[Pen]-K(ПЕГ11-Palm)TWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1144);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-[Lys(ПЕГ11-palm)]-N-NH₂ (SEQ ID NO:1145);
 Ac-[Pen]-[Cit]-TW-[Cit]-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1146);
 Ac-[Pen]-[Lys(Ac)]-TW-[Cit]-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1147);
 Ac-[Pen]-NT-[Phe(3,4-ОСН3)2]-Q-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1148);

Ac-[Pen]-NT-[Phe(2,4-CH3)2]-Q-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1149);
 Ac-[Pen]-NT-[Phe(3-CH3)]-Q-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1150);
 Ac-[Pen]-NT-[Phe(4-CH3)]-Q-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1151);
 Ac(D)Arg-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-N-β-Ala-NH₂ (SEQ ID NO:1152);
 Ac-[(D)Tyr]-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-N-β-Ala-NH₂ (SEQ ID NO:1153);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-QN-NH₂ (SEQ ID NO:1154);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-[Lys(Ac)]-N-NH₂ (SEQ ID NO:1155);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-N-[Lys(Ac)]-NH₂ (SEQ ID NO:1156);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-QQ-NH₂ (SEQ ID NO:1157);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-Q-β-Ala-NH₂ (SEQ ID NO:1158);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-N-[Cit]-NH₂ (SEQ ID NO:1159);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-[Cit]-NNH₂ (SEQ ID NO:1160);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-[Cit]-Q-NH₂ (SEQ ID NO:1161);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-[Cit]-[Lys(Ac)]-NH₂ (SEQ ID NO:1162);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-[Lys(Ac)]-[Cit]-NH₂ (SEQ ID NO:1163);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-QN-β-Ala-NH₂ (SEQ ID NO:1164);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-E-[Cit]-Q-NH₂ (SEQ ID NO:1165);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Cit]-N-[Cit]-NH₂ (SEQ ID NO:1166);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Cit]-Q-[Cit]-NH₂ (SEQ ID NO:1167);
 Ac-[Pen]-[Cit]-TWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1168);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1169);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-QNN-NH₂ (SEQ ID NO:1170);
 Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-ENQ-NH₂ (SEQ ID NO:1171);
 Ac-[Pen]-GPWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1172);
 Ac-[Pen]-PGWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1173);
 Ac-[Pen]-NTWN-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1174);
 Ac-[Pen]-NSWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1175);
 Ac-[Pen]-N-[Aib]-WQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1176);
 Ac-[Pen]-NTW-[Aib]-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]N-[Aib]-NH₂ (SEQ ID NO:1177);
 Ac-[Pen]-QTW-[Lys(Ac)]-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1178);
 Ac-[Pen]-[Lys(Ac)]-TWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]NNNH₂ (SEQ ID NO:1179);
 Ac-[Pen]-QVWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1180);

Ac-[Pen]-NT-[2-Nal]-Q-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-
[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1181);
Ac-[Pen]-NT-[1-Nal]-Q-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-
[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1182);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[α-MeLeu]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1183);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[α-Me-Lys]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1184);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂
(SEQ ID NO:1185);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[α-MeLeu]-[Lys(Ac)]-N-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1186);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[α-Me-Lys]-[Lys(Ac)]-N-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1187);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-[Lys(Ac)]-N-[β-
Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1188);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-LN-NH₂ (SEQ ID NO:1189);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-GN-NH₂ (SEQ ID NO:1190);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-SN-NH₂ (SEQ ID NO:1191);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-[Aib]-N-NH₂ (SEQ ID NO:1192);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-FN-NH₂ (SEQ ID NO:1193);
Ac-[Pen]-NTW-[Cit]-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-
[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1194);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-[Tic]-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1195);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-[nLeu]-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1196);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-G-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1197);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-R-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1198);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-W-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1199);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-S-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1200);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-L-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1201);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-[AIB]-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1202);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-[N-MeAla]-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1203);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-[2-Nal]-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1204);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-F-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1205);
Ac-[(D)Arg]-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-
[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-[Lys(Ac)]-
NN-NH₂ (SEQ ID NO:1206);
Біотин-[ПЕГ4]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-
[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-ENN-NH₂
(SEQ ID NO:1269);
Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-[4-
аміно-4-карбокситетрагідропіран]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂
(SEQ ID NO:1270);
Ac-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-
[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-[Lys(Ac)]-
NN-NH₂ (SEQ ID NO:1271);

Ac-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-
[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-[Lys(Ac)]-
NN-NH₂ (SEQ ID NO:1272);
Ac-E-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-
[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-ENN-NH₂
(SEQ ID NO:1273);
Ac-[(D)Asp]-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміно-
етокси)]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-
ENN-NH₂ (SEQ ID NO:1274);
Ac-R-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-
[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-ENN-NH₂
(SEQ ID NO:1275);
Ac-[(D)Arg]-[(D)Arg]-цикло[[Abu]-QWQC]-[Phe[4-(2-
аміноетокси)]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідро-
піран]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:1276);
Ac-F-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-
[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-ENN-NH₂
(SEQ ID NO:1277);
Ac-[(D)Phe]-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміно-
етокси)]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-
ENN-NH₂ (SEQ ID NO:1278);
Ac-[2-Nal]-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноет-
окси)]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-
ENN-NH₂ (SEQ ID NO:1279);
Ac-T-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-
[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-ENN-NH₂
(SEQ ID NO:1280);
Ac-L-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-
[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-ENN-NH₂
(SEQ ID NO:1281);
Ac-[(D)Gln]-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміно-
етокси)]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-
ENN-NH₂ (SEQ ID NO:1282);
Ac-[(D)Asn]-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміно-
етокси)]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-
ENN-NH₂ (SEQ ID NO:1283);
Ac-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-(ПЕГ4-
Alexa488)]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідро-
піран]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:1284);
[Alexa488]-[ПЕГ4]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноет-
окси)]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-
ENN-NH₂ (SEQ ID NO:1285);
[Alexa647]-[ПЕГ4]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-аміноет-
окси)]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-
ENN-NH₂ (SEQ ID NO:1286);
[Alexa647]-[ПЕГ4]-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-
аміноетокси)]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідро-
піран]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1287);
[Alexa647]-[ПЕГ12]-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-
аміноетокси)]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідро-
піран]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1288);
[Alexa488]-[ПЕГ4]-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe[4-(2-
аміноетокси)]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідро-
піран]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1289);
Ac-[Pen]-QWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[α-MeLeu]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:602);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:632);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe[4-(2-аміноетокси)]-[2-Nal]-
[Aib]-[Lys(Ac)]-N-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:639);
Ac-[Pen]-QWQ-[Pen]-[Phe(4-OMe)]-[2-Nal]-[α-Me-Lys]-
[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:666);
Ac-[Pen]-QWQ-[Pen]-[Phe(4-CONH₂)]-[2-Nal]-[α-Me-
Lys]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:668); або

Ac-[Pen]-QWQ-[Pen]-[Phe(4-CONH₂)]-[2-Nal]-[α-MeVal]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:669) або їх фармацевтично придатної солі, де пептидний інгібітор є циклізованим за допомогою тіоетерного зв'язку між Abu та Cys або за допомогою дисульфідного зв'язку між Pen та Pen.

2. Пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль за п. 1, де пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль являють собою: Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-Me-Lys]-[Lys(ізовалеріанова кислота)]-NG-NH₂ (SEQ ID NO:861); Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[Aib]-QNG-NH₂ (SEQ ID NO:877) або Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NA-NH₂ (SEQ ID NO:880), або їх фармацевтично придатну сіль, де пептидний інгібітор є циклізованим за допомогою тіоетерного зв'язку між Abu та C.

3. Пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль за п. 1, де пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль являють собою: Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-(ацетиламіноетокси)))-[2-Nal]-[α-Me-Lys(Ac)]-[Lys(Ac)]-NG-NH₂ (SEQ ID NO:900); Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-Me-Lys]-ENQ-NH₂ (SEQ ID NO:911); Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-Me-Lys]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:912); Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-MeVal]-[Lys(Ac)]-NG-NH₂ (SEQ ID NO:915); Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-Me-Leu]-[Cit]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:954); Ac-[(D)Phe]-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-Me-Lys]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:970); Ac-T-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-Me-Lys]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:972) або Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[acbc]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:976), або їх фармацевтично придатну сіль, де пептидний інгібітор є циклізованим за допомогою тіоетерного зв'язку між Abu та C.

4. Пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль за п. 1, де пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль являють собою: Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[acpc]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:1043); Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[achc]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:977) або Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:980), або їх фармацевтично придатну сіль, де пептидний інгібітор є циклізованим за допомогою тіоетерного зв'язку між Abu та C.

5. Пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль за п. 1, де пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль являють собою Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-метил-L-лейцин]-QN-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:984) або його фармацевтично придатну сіль, де пептидний інгібітор є циклізованим за допомогою тіоетерного зв'язку між Abu та C.

6. Пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль за п. 1, де пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль являють собою Ac-(D)Phe-

[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:992) або його фармацевтично придатну сіль, де пептидний інгібітор є циклізованим за допомогою тіоетерного зв'язку між Abu та C.

7. Пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль за п. 1, де пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль являють собою Ac-[(D)Arg]-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:993) або його фармацевтично придатну сіль, де пептидний інгібітор є циклізованим за допомогою тіоетерного зв'язку між Abu та C.

8. Пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль за п. 1, де пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль являють собою Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-Me-Leu]-QNG-NH₂ (SEQ ID NO:983); Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-Me-Leu]-QN(β-Ala)-NH₂ (SEQ ID NO:984); Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-Me-Leu]-QDG-NH₂ (SEQ ID NO:985) або Ac-[Abu]-QWQC-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[Aib]-QN(β-Ala)-NH₂ (SEQ ID NO:987), або їх фармацевтично придатну сіль, де пептидний інгібітор є циклізованим за допомогою тіоетерного зв'язку між Abu та C.

9. Пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль за п. 1, де пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль являють собою: Ac-[Pen]-QW-[Lys(Ac)]-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1178); Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-MeLeu]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1183); Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-MeLeu]-[Lys(Ac)]-N-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1186); Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-Me-Lys]-[Lys(Ac)]-N-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1187); Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-[Lys(Ac)]-N-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1188); Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-SN-NH₂ (SEQ ID NO:1191); Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-FN-NH₂ (SEQ ID NO:1193); Ac-[Pen]-NTW-[Cit]-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1194); Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-G-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1197); Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-R-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1198); Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-S-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1200); Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-[2-Nal]-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1204) або Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-F-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:1205), або їх фармацевтично придатну сіль, де пептидний інгібітор є циклізованим за допомогою дисульфідного зв'язку між Pen.

10. Пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль за п. 1, де пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль являють собою:

Ac-[Pen]-QTWQ-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-MeLeu]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:602);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:632);
Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-N-[β-Ala]-NH₂ (SEQ ID NO:639);
Ac-[Pen]-QTWQ-[Pen]-[Phe(4-OMe)]-[2-Nal]-[α-Me-Lys]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:666);
Ac-[Pen]-QTWQ-[Pen]-[Phe(4-CONH₂)]-[2-Nal]-[α-Me-Lys]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:668) або
Ac-[Pen]-QTWQ-[Pen]-[Phe(4-CONH₂)]-[2-Nal]-[α-MeVal]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:669),
або їх фармацевтично придатну сіль, де пептидний інгібітор є циклізованим за допомогою дисульфідного зв'язку між Pen.

11. Пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль за п. 1, де пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль являють собою:

Ac-[(D)Phe]-[Pen]-NTWQ[Pen]-[Phe(4-OMe)]-[2-Nal]-[4-аміно-4-карбокситетрагідропіран]-[Cit]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:679) або

Ac-[(D)Phe]-[Pen]-NTWQ[Pen]-[Phe(4-OMe)]-[2-Nal]-[Achc]-ENN-NH₂ (SEQ ID NO:681),

або їх фармацевтично придатну сіль, де пептидний інгібітор є циклізованим за допомогою дисульфідного зв'язку між Pen.

12. Пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль за п. 1, де пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль являють собою:

Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe(4-CONH₂)]-[2-Nal]-[Aib]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:682)

або його фармацевтично придатну сіль, де пептидний інгібітор є циклізованим за допомогою дисульфідного зв'язку між Pen.

13. Пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль за п. 1, де пептидний інгібітор або його фармацевтично придатна сіль являють собою:

Ac-[Pen]-NTWQ-[Pen]-[Phe(4-(2-аміноетокси))]-[2-Nal]-[α-MeLeu]-[Lys(Ac)]-NN-NH₂ (SEQ ID NO:1183)

або його фармацевтично придатну сіль, де пептидний інгібітор є циклізованим за допомогою дисульфідного зв'язку між Pen.

14. Фармацевтична композиція, яка містить пептидний інгібітор або його фармацевтично придатну сіль за будь-яким із пп. 1-13.

15. Спосіб лікування запального захворювання кишечнику (IBD) у суб'єкта, який включає введення суб'єкту ефективної кількості пептидного інгібітора або його фармацевтично придатної солі за будь-яким із пп. 1-13, або фармацевтичної композиції за п. 14.

16. Спосіб за п. 15, де пептидний інгібітор або його фармацевтично придатну сіль, або фармацевтичну композицію вводять перорально.

17. Спосіб за п. 15, де IBD являє собою виразковий коліт.

18. Спосіб за п. 15, де IBD являє собою хворобу Крона.

19. Спосіб за п. 15, де IBD являє собою паучит, що виникає після проктоколектомії й ілеоанального анастомозу.

A61K 38/18 (2006.01)

A61P 35/00

(21) а 2017 03593

(22) 22.10.2015

(24) 03.06.2021

(31) 62/067,824

(32) 23.10.2014

(33) US

(86) PCT/US2015/056830, 22.10.2015

(72) Ліндхаут Деррін Ентоні (US), Олсон Чарльз В. (US)

(73) ЕНДЖІЕМ БАЙОФАРМАСЬЮТИКАЛЗ, ІНК.

333 Oyster Point Blvd. South San Francisco, CA 94080, United States of America (US)

(54) **ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ ДЛЯ КОНТРОЛЮ АБО ЛІКУВАННЯ ЗАХВОРЮВАННЯ АБО ПОРУШЕННЯ, ПОВ'ЯЗАНОГО З FGF19**

(57) 1. Фармацевтична композиція для контролю або лікування захворювання або порушення, пов'язаного з FGF19, у суб'єкта, де композиція містить:

а) пептид, який має амінокислотну послідовність, яка містить або складається з SEQ ID NO:70, при концентрації від 1 до 10 мг/мл; і

б) фармацевтично прийнятний носій, який містить:

i) Tris, присутній у діапазоні від 5 до 50 мМ,

ii) трегалозу, присутню у діапазоні від 1 до 20 % (мас./об.), і

iii) полісорбат-20 (TWEEN-20), присутній у діапазоні від 0,001 до 0,01 %.

2. Фармацевтична композиція за п. 1, де пептид має амінокислотну послідовність, яка містить SEQ ID NO:70.

3. Фармацевтична композиція за п. 1, де пептид має амінокислотну послідовність, яка складається з SEQ ID NO:70.

4. Фармацевтична композиція за п. 1, яка містить пептид у концентрації 1 мг/мл.

5. Фармацевтична композиція за п. 1, яка містить пептид у концентрації 5 мг/мл.

6. Фармацевтична композиція за п. 1, яка містить пептид у концентрації 10 мг/мл.

7. Фармацевтична композиція за п. 1, де Tris присутній у діапазоні від 10 до 45 мМ.

8. Фармацевтична композиція за п. 1, де Tris присутній у діапазоні від 10 до 20 мМ.

9. Фармацевтична композиція за п. 1, де Tris присутній у діапазоні від 15 до 40 мМ.

10. Фармацевтична композиція за п. 1, де Tris присутній у діапазоні від 20 до 35 мМ.

11. Фармацевтична композиція за п. 1, де Tris присутній у діапазоні від 20 до 30 мМ.

12. Фармацевтична композиція за п. 1, де Tris присутній у діапазоні від 20 до 25 мМ.

13. Фармацевтична композиція за п. 1, де Tris присутній у концентрації 20 мМ.

14. Фармацевтична композиція за п. 1, де трегалоза присутня у діапазоні від 2 до 15 %.

15. Фармацевтична композиція за п. 1, де трегалоза присутня у діапазоні від 3 до 10 %.

16. Фармацевтична композиція за п. 1, де трегалоза присутня у діапазоні від 4 до 9,5 %.

17. Фармацевтична композиція за п. 1, де трегалоза присутня у діапазоні від 5 до 9,25 %.

18. Фармацевтична композиція за п. 1, де трегалоза присутня у діапазоні від 6 до 9 %.

19. Фармацевтична композиція за п. 1, де трегалоза присутня у діапазоні від 7 до 8,5 %.

(11) 123763

(51) МПК (2021.01)

C07K 14/50 (2006.01)

G01N 33/68 (2006.01)

20. Фармацевтична композиція за п. 1, де трегалоза присутня у діапазоні від 8 до 8,4 %.

21. Фармацевтична композиція за п. 1, де трегалоза присутня у концентрації 8,2 %.

22. Фармацевтична композиція за п. 1, де трегалоза присутня у концентрації 8,3 %.

23. Фармацевтична композиція за п. 1, де трегалоза присутня у концентрації 8,4 %.

24. Фармацевтична композиція за п. 1, де трегалоза присутня у діапазоні від 9,2 до 9,3 %.

25. Фармацевтична композиція за п. 1, де трегалоза присутня у концентрації 9,3 %.

26. Фармацевтична композиція за п. 1, де концентрація полісорбату-20 становить від 0,0025 до 0,075 % (об./об.).

27. Фармацевтична композиція за п. 1, де концентрація полісорбату-20 становить від 0,005 до 0,05 % (об./об.).

28. Фармацевтична композиція за п. 1, де концентрація полісорбату-20 становить від 0,0075 до 0,025 % (об./об.).

29. Фармацевтична композиція за п. 1, де концентрація полісорбату-20 становить 0,01 % (об./об.).

30. Фармацевтична композиція за п. 1, де концентрація полісорбату-20 становить 0,02 % (об./об.).

31. Фармацевтична композиція за п. 1, де фармацевтична композиція має значення рН у діапазоні від 7,0 до 9,0, виміряне при температурі 4 або 25 °С.

32. Фармацевтична композиція за п. 1, де фармацевтична композиція має значення рН у діапазоні від 7,5 до 8,5, виміряне при температурі 4 або 25 °С.

33. Фармацевтична композиція за п. 1, де фармацевтична композиція має значення рН 8,0, виміряне при температурі 4 °С.

34. Фармацевтична композиція за п. 1, де фармацевтична композиція має значення рН 8,0, виміряне при температурі 25 °С.

35. Фармацевтична композиція для контролю або лікування захворювання або порушення, пов'язаного з FGF19, у суб'єкта, де композиція містить:

а) пептид, який має амінокислотну послідовність, яка складається з SEQ ID NO:70, при концентрації від 1 до 10 мг/мл; і

б) фармацевтично прийнятний носій, який містить:

i) 20 mM Tris,

ii) від 8,2 до 8,4 % (мас./об.) трегалози і

iii) 0,01 % (об./об.) полісорбату-20; і

де фармацевтична композиція має значення рН 8,0, виміряне при температурі 25 °С.

36. Фармацевтична композиція за п. 35, де пептид присутній у концентрації 1 мг/мл.

37. Фармацевтична композиція за п. 35, де пептид присутній у концентрації 5 мг/мл.

38. Фармацевтична композиція за п. 35, де пептид присутній у концентрації 10 мг/мл.

39. Фармацевтична композиція для контролю або лікування захворювання або порушення, пов'язаного з FGF19, у суб'єкта, де композиція містить:

а) пептид, який має амінокислотну послідовність, яка складається з SEQ ID NO:70, при концентрації від 1 до 10 мг/мл; і

б) фармацевтично прийнятний носій, який містить:

i) 20 mM Tris,

ii) від 9,2 до 9,3 % (мас./об.) трегалози і

iii) 0,01 % (об./об.) полісорбату-20; і

де фармацевтична композиція має значення рН 8,0, виміряне при температурі 25 °С.

40. Фармацевтична композиція за п. 39, де пептид присутній у концентрації 1 мг/мл.

41. Фармацевтична композиція за п. 39, де пептид присутній у концентрації 5 мг/мл.

42. Фармацевтична композиція за п. 39, де пептид присутній у концентрації 10 мг/мл.

43. Фармацевтична композиція для контролю або лікування захворювання або порушення, пов'язаного з FGF19, у суб'єкта, де композиція містить:

а) пептид, який має амінокислотну послідовність, яка складається з SEQ ID NO:70, при концентрації від 1 до 10 мг/мл; і

б) фармацевтично прийнятний носій, який містить:

i) Tris, присутній у діапазоні від 10 до 20 mM,

ii) від 9,2 до 9,3 % (мас./об.) трегалози, і

iii) полісорбат-20, присутній у діапазоні від 0,0075 до 0,25 % (об./об.).

44. Фармацевтична композиція за п. 43, де пептид присутній у концентрації 1 мг/мл.

45. Фармацевтична композиція за п. 43, де пептид присутній у концентрації 5 мг/мл.

46. Фармацевтична композиція за п. 43, де пептид присутній у концентрації 10 мг/мл.

47. Фармацевтична композиція за п. 43, де фармацевтична композиція має значення рН у діапазоні від 7,0 до 9,0, виміряне при температурі 4 або 25 °С.

48. Фармацевтична композиція за п. 43, де фармацевтична композиція має значення рН у діапазоні від 7,5 до 8,5, виміряне при температурі 4 або 25 °С.

49. Фармацевтична композиція за п. 43, де фармацевтична композиція має значення рН 8,0, виміряне при температурі 4 °С.

50. Фармацевтична композиція за п. 43, де фармацевтична композиція має значення рН 8,0, виміряне при температурі 25 °С.

51. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 1-50, де пептид злитий з Fc-ділянкою імуноглобуліну.

52. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 1-50, де фармацевтична композиція не містить солі.

53. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 1-50, де фармацевтична композиція не містить NaCl.

54. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 1-50, де менше 10 % пептиду агрегує через певний період часу при зберіганні при температурі 4 або 37 °С.

55. Фармацевтична композиція за п. 54, де період часу становить 4 тижні при температурі 4 °С.

56. Фармацевтична композиція за п. 54, де період часу становить 4 тижні при температурі 37 °С.

57. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 1-50, де менше 5 % пептиду агрегує через певний період часу при зберіганні при температурі 4 або 37 °С.

58. Фармацевтична композиція за п. 57, де період часу становить 4 тижні при температурі 4 °С.

59. Фармацевтична композиція за п. 57, де період часу становить 4 тижні при температурі 37 °С.

60. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 1-50, де менше 2 % пептиду агрегує через певний період часу при зберіганні при температурі 4 або 37 °С.

61. Фармацевтична композиція за п. 60, де період часу становить 4 тижні при температурі 4 °С.

62. Фармацевтична композиція за п. 60, де період часу становить 4 тижні при температурі 37 °С.

63. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 1-50, де фармацевтична композиція знаходиться у рідкій формі.

64. Фармацевтична композиція за п. 63, де менше 10 % пептиду агрегує через певний період часу при зберіганні при температурі 4 або 37 °C.

65. Фармацевтична композиція за п. 64, де період часу становить 4 тижні при температурі 4 °C.

66. Фармацевтична композиція за п. 64, де період часу становить 4 тижні при температурі 37 °C.

67. Фармацевтична композиція за п. 63, де менше 5 % пептиду агрегує через певний період часу при зберіганні при температурі 4 або 37 °C.

68. Фармацевтична композиція за п. 67, де період часу становить 4 тижні при температурі 4 °C.

69. Фармацевтична композиція за п. 67, де період часу становить 4 тижні при температурі 37 °C.

70. Фармацевтична композиція за п. 63, де менше 2 % пептиду агрегує через певний період часу при зберіганні при температурі 4 або 37 °C.

71. Фармацевтична композиція за п. 70, де період часу становить 4 тижні при температурі 4 °C.

72. Фармацевтична композиція за п. 70, де період часу становить 4 тижні при температурі 37 °C.

73. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 1-50, де композицію надають у одноразовому контейнері.

74. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 1-50, де композицію надають у шприці або автоін'єкторі.

75. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 1-50, де композицію надають у багаторазовому контейнері.

76. Фармацевтична композиція за п. 63, де композицію надають у одноразовому контейнері.

77. Фармацевтична композиція за п. 63, де композицію надають у шприці або автоін'єкторі.

78. Фармацевтична композиція за п. 63, де композицію надають у багаторазовому контейнері.

79. Спосіб запобігання, лікування або контролю захворювання або порушення, пов'язаного з FGF19, у суб'єкта, який включає введення суб'єкту ефективної кількості фармацевтичної композиції за будь-яким з пунктів 1-50.

80. Спосіб за п. 79, де захворювання або порушення включає порушення гомеостазу жовчних кислот або пов'язане з гомеостазом жовчних кислот або супутнім захворюванням.

81. Спосіб за п. 79, де захворювання або порушення включає захворювання або порушення, вибране з групи, що складається з метаболічного синдрому; порушення метаболізму ліпідів або глюкози; порушення метаболізму холестерину або тригліцеридів; діабету 2 типу; холестаза, внутрішньопечінкового холестаза, первинного біліарного цирозу (PBC), первинного сімейного внутрішньопечінкового холестаза (PFIC), прогресуючого PFIC, первинного склерозивного холангіту (PSC), внутрішньопечінкового холестаза вагітних (PIC), неонатального холестаза і медікаментозного холестаза, захворювань позапечінкового холестаза, стиснення жовчних протоків через пухлини, блокування жовчних протоків жовчним камінням, синдрому недостатності всмоктування жовчних кислот і інших захворювань із залученням дистального відділу тонкого кишечника, резек-

ції клубової кишки, запальних захворювань кишечника, хвороби Крона, виразкового коліту, ідіопатичних порушень, що призводять до зменшення всмоктування жовчних кислот, діареї, хологенної діареї (BAD), ШК симптомів, раку ШК тракту, раку печінки, раку жовчних протоків, раку товстого кишечника, печінковоклітинного раку, аномалій синтезу жовчних кислот, неалкогольного стеатогепатиту (NASH), цирозу і портальної гіпертензії, а також їхніх комбінацій.

82. Спосіб за п. 81, де захворювання або порушення включає синдром недостатності всмоктування жовчних кислот або діарею.

83. Спосіб за п. 81, де захворювання або порушення включає холестаз або первинний біліарний цироз.

84. Спосіб за п. 81, де захворювання або порушення включає первинний склерозивний холангіт.

85. Спосіб за п. 81, де захворювання або порушення включає PFIC або прогресуючий PFIC.

86. Спосіб за п. 81, де захворювання або порушення включає неалкогольний стеатогепатит (NASH).

87. Спосіб за п. 79, де захворювання або порушення є фіброзом печінки.

88. Спосіб за п. 79, де захворювання або порушення є цирозом.

89. Спосіб за п. 79, де захворювання або порушення включає метаболічне порушення.

90. Спосіб за п. 89, де метаболічне порушення включає гіперглікемічний стан, стійкість до інсуліну, гіперінсулінемію, непереносимість глюкози або метаболічний синдром.

91. Спосіб за п. 90, де гіперглікемічний стан включає діабет.

92. Спосіб за п. 90, де гіперглікемічний стан включає інсулінозалежний діабет (I типу), діабет II типу або гестаційний діабет.

93. Спосіб за п. 81, де захворювання або порушення є раком або пухлиною.

94. Спосіб за п. 93, де рак або пухлина є FGF19-залежним раком або пухлиною.

95. Спосіб за п. 94, де рак або пухлина є печінково-клітинною карциномою.

96. Спосіб за п. 94, де рак або пухлина є раком або пухлиною товстого кишечника.

97. Спосіб за п. 94, де рак або пухлина є раком або пухлиною передміхурової залози.

98. Спосіб за п. 94, де рак або пухлина є раком або пухлиною легені.

99. Застосування фармацевтичної композиції за будь-яким з пп. 1-50 для запобігання, лікування або контролю захворювання або порушення, пов'язаного з FGF19, у суб'єкта.

100. Застосування за п. 99, де захворювання або порушення включає порушення гомеостазу жовчних кислот або пов'язане з гомеостазом жовчних кислот або супутнім захворюванням.

101. Застосування за п. 99, де захворювання або порушення включає захворювання або порушення, вибране з групи, що складається з метаболічного синдрому; порушення метаболізму ліпідів або глюкози; порушення метаболізму холестерину або тригліцеридів; діабету 2 типу; холестаза, внутрішньопечінкового холестаза, первинного біліарного цирозу (PBC), первинного сімейного внутрішньопечінкового холестаза (PFIC), прогресуючого PFIC, первинного склерозивного холангіту (PSC), внутрішньопе-

чінкового холестази вагітних (PIC), неонатального холестази і медикаментозного холестази, захворювань позапечінкового холестази, стиснення жовчних протоків через пухлини, блокування жовчних протоків жовчним камінням, синдрому недостатності всмоктування жовчних кислот і інших захворювань із залученням дистального відділу тонкого кишечника, резекції клубової кишки, запальних захворювань кишечника, хвороби Крона, виразкового коліту, ідіопатичних порушень, що призводять до зменшення всмоктування жовчних кислот, діареї, хологенної діареї (BAD), ШК симптомів, раку ШК тракту, раку печінки, раку жовчних протоків, раку товстого кишечника, печінковоклітинного раку, аномалій синтезу жовчних кислот, неалкогольного стеатогепатиту (NASH), цирозу і портальної гіпертензії, а також їхніх комбінацій.

102. Застосування за п. 101, де захворювання або порушення включає синдром недостатності всмоктування жовчних кислот або діарею.

103. Застосування за п. 101, де захворювання або порушення включає холестаз або первинний біліарний цироз.

104. Застосування за п. 101, де захворювання або порушення включає первинний склерозивний холангіт.

105. Застосування за п. 101, де захворювання або порушення включає PFIC або прогресуючий PFIC.

106. Застосування за п. 101, де захворювання або порушення включає неалкогольний стеатогепатит (NASH).

107. Застосування за п. 99, де захворювання або порушення є фіброзом печінки.

108. Застосування за п. 99, де захворювання або порушення є цирозом.

109. Застосування за п. 99, де захворювання або порушення включає метаболічне порушення.

110. Застосування за п. 99, де метаболічне порушення включає гіперглікемічний стан, стійкість до інсуліну, гіперінсулінемію, непереносимість глюкози або метаболічний синдром.

111. Застосування за п. 110, де гіперглікемічний стан включає діабет.

112. Застосування за п. 110, де гіперглікемічний стан включає інсулінозалежний діабет (I типу), діабет II типу або гестаційний діабет.

113. Застосування за п. 99, де захворювання або порушення є раком або пухлиною.

114. Застосування за п. 113, де рак або пухлина є FGF19-залежним раком або пухлиною.

115. Застосування за п. 114, де рак або пухлина є печінковоклітинною карциномою.

116. Застосування за п. 114, де рак або пухлина є раком або пухлиною товстого кишечника.

117. Застосування за п. 114, де рак або пухлина є раком або пухлиною передміхурової залози.

118. Застосування за п. 114, де рак або пухлина є раком або пухлиною легені.

(31) 14184838.2

(32) 15.09.2014

(33) EP

(86) PCT/IB2015/057049, 14.09.2015

(72) Бонданца Аттиліо (IT), Казуччі Моніка (IT), Боніні Марія Кьяра (IT)

(73) МОЛМЕД СПА

Via Olgettina 58, I-20132 Milan, Italy (IT)

(54) ХИМЕРНИЙ РЕЦЕПТОР АНТИГЕНУ ТА ЙОГО ЗАС-ТОСУВАННЯ ПРИ ЛІКУВАННІ ПУХЛИН, ЯКІ ЕКС-ПРЕСУЮТЬ CD44

(57) 1. Химерний рецептор антигену (CAR), що включає екстраклітинний спейсер, який включає щонайменше частину екстраклітинного домену рецептора фактора росту нервів з низькою спорідненістю (LNGFR) людини, де екстраклітинний спейсер включає перші три TNFR-Cys домени LNGFR.

2. CAR за п. 1, причому вказана щонайменше частина LNGFR придатна для полегшення імуноселекції і ідентифікації клітин, трансдукованих вказаним CAR.

3. CAR за п. 1 або 2, причому у спейсері відсутній внутрішньоклітинний домен LNGFR.

4. CAR за будь-яким із попередніх пунктів, причому спейсер включає всі чотири TNFR-Cys домени LNGFR.

5. CAR за будь-яким з попередніх пунктів, причому спейсер включає четвертий TNFR-Cys домен (TNFR-Cys 4), але при цьому із вказаного домену видалена наступна амінокислотна послідовність: NHVDPCLPCTVCECTERQLRECTRW, і вона замінена наступною амінокислотою послідовністю: ARA.

6. CAR за будь-яким з попередніх пунктів, причому спейсер включає багату на серин/треонін ніжку LNGFR.

7. CAR за будь-яким з пп. 1-5, причому у спейсері відсутня багата на серин/треонін ніжка LNGFR.

8. CAR за будь-яким з пп. 1-3, причому вказаний спейсер включає весь екстраклітинний домен LNGFR.

9. CAR за будь-яким з пп. 1-3, причому вказаний спейсер включає екстраклітинний домен LNGFR, за винятком багатой на серин/треонін ніжки.

10. CAR за будь-яким з пп. 1-3, причому спейсер включає послідовність, вибрану з групи, яка складається з SEQ ID NO: 1, SEQ ID NO: 3, SEQ ID NO: 5 або SEQ ID NO: 7, або послідовність, яка щонайменше на 90 % ідентична їй.

11. CAR за будь-яким з пп. 1-3, причому спейсер складається з послідовності, вибраної з групи, яка складається з SEQ ID NO: 1, SEQ ID NO: 3, SEQ ID NO: 5 або SEQ ID NO: 7, або послідовності, яка щонайменше на 90 % ідентична їй.

12. Химерний рецептор антигену (CAR), що включає

(i) антигенспецифічний таргетуючий домен;

(ii) екстраклітинний спейсерний домен, визначений у будь-якому з пп. 1-11;

(iii) трансмембранний домен;

(iv) необов'язково щонайменше один костимулювальний домен; і

(v) внутрішньоклітинний домен, що передає сигнали.

13. CAR за п. 12, причому антигенспецифічний таргетуючий домен включає антитіло або його фрагмент.

14. CAR за п. 13, причому антигенспецифічний таргетуючий домен являє собою одноланцюговий варіабельний фрагмент.

(11) 123764

(51) МПК

C07K 14/725 (2006.01)

C07K 14/705 (2006.01)

(21) а 2017 03663

(22) 14.09.2015

(24) 03.06.2021

15. CAR за будь-яким з пп. 12-14, причому мішенню антигенспецифічного таргетуючого домену є пухлинний антиген.

16. CAR за п. 15, причому пухлинний антиген вибирають з групи, яка складається з CD44, CD19, CD20, CD22, CD23, CD123, CS-1, ROR1, мезотеліну, c-Met, PSMA, Her2, GD-2, CEA, MAGE A3 TCR та їхніх комбінацій.

17. CAR за п. 15, причому пухлинним антигеном є ізоформа 6 CD44 (CD44v6).

18. CAR за будь-яким з пп. 12-17, причому трансмембранний домен включає будь-який один або більше з трансмембранного домену дзета-ланцюга Т-клітинного рецепторного комплексу, CD28, CD8a і їхніх комбінацій.

19. CAR за будь-яким з пп. 12-18, причому коstimулювальний домен включає коstimулювальний домен з будь-якого одного або більше з CD28, CD137 (4-1BB), CD134 (OX40), Dap10, CD27, CD2, CD5, ICAM-1, LFA-1, Lck, TNFR-I, TNFR-II, Fas, CD30, CD40 та їхніх комбінацій.

20. CAR за будь-яким з пп. 12-19, причому внутрішньоклітинний домен, що передає сигнали, включає внутрішньоклітинний домен, що передає сигнали, з одного або більше з дзета-ланцюга CD3 людини, FcγRIII, FcγRI, цитоплазматичного хвоста Fc-рецептора, що несуть імунорецепторний тирозиновий активуючий мотив (ITAM) цитоплазматичних рецепторів і їхніх комбінацій.

21. CAR за будь-яким з пп. 12-20, причому мішенню антигенспецифічного таргетуючого домену є CD44v6, трансмембранний домен включає трансмембранний домен CD28, внутрішньоклітинний домен, що передає сигнали, включає внутрішньоклітинний домен дзета-ланцюга CD3 людини, що передає сигнали, а коstimулювальний домен включає ендокостимулювальний домен CD28.

22. Полінуклеотид, що кодує CAR за будь-яким з пп. 1-21.

23. Вектор, що включає полінуклеотид за п. 22.

24. Вектор за п. 23, причому вектор являє собою вірусний вектор.

25. Клітина, що включає CAR за будь-яким з пп. 1-21, полінуклеотид за п. 22 або вектор за п. 23 або 24.

26. Клітина за п. 25, причому клітина являє собою Т-клітину.

27. Фармацевтична композиція, що включає клітину за п. 25 або 26.

28. Застосування CAR за будь-яким з пп. 12-21, полінуклеотиду за п. 22, вектора за п. 23 або 24 або клітини за п. 25 або 26 при лікуванні раку.

29. Застосування CAR за п. 21, полінуклеотиду, що кодує вказаний CAR, вектора, що включає вказаний полінуклеотид, або клітини-хазяїна, що включає вказаний CAR, полінуклеотид або вектор, при лікуванні пухлин, які експресують CD44.

C12N 15/09 (2006.01)

C12P 21/08 (2006.01)

(21) а 2018 05269

(22) 16.12.2016

(24) 03.06.2021

(31) 2015-247069

(32) 18.12.2015

(33) JP

(86) PCT/JP2016/087481, 16.12.2016

(72) Сампеї Дзендзіро (SG)

(73) ЧУГАІ СЕЙЯКУ КАБУСІКІ КАЙСЯ

5-1, Ukima 5-chome, Kita-ku, Tokyo 1158543, Japan (JP)

(54) АНТИТІЛА ПРОТИ C5 ТА СПОСОБИ ЗАСТОСУВАННЯ

(57) 1. Антитіло проти C5, яке включає послідовність VH за SEQ ID NO: 106 та послідовність VL за SEQ ID NO: 111.

2. Антитіло за п. 1, яке включає константну ділянку важкого ланцюга, що включає амінокислотну послідовність за SEQ ID NO: 114, і константну ділянку легкого ланцюга, що включає амінокислотну послідовність за SEQ ID NO: 38.

3. Антитіло за будь-яким з пп. 1-2, яке є повнорозмірним антитілом IgG1 або IgG4.

4. Виділена нуклеїнова кислота, яка кодує антитіло за будь-яким з пп. 1-3.

5. Клітина-хазяїн, яка містить нуклеїнову кислоту за п. 4.

6. Спосіб отримання антитіла, який включає культивування клітини-хазяїна за п. 5, так щоб вироблялося антитіло.

7. Фармацевтичний склад, який містить антитіло за будь-яким з пп. 1-3 та фармацевтично прийнятний носій.

(11) 123759

(51) МПК

C07K 16/18 (2006.01)

A61K 39/395 (2006.01)

A61P 25/06 (2006.01)

(21) а 2016 10615

(22) 20.03.2015

(24) 03.06.2021

(31) 61/968,897

(32) 21.03.2014

(33) US

(31) 62/083,809

(32) 24.11.2014

(33) US

(31) 62/119,778

(32) 23.02.2015

(33) US

(86) PCT/US2015/021887, 20.03.2015

(72) Бігел Марсело (US), Уолтер Сара (US), Стерн Генрі (US), Чанг Майкл (US)

(73) ТЕВА ФАРМАСЬЮТИКАЛЗ ІНТЕРНЕШНЛ ГМБХ Rapperswil-Jona, Schluselstrasse 12, Jona, 8645, Switzerland (CH)

(54) ЗАСТОСУВАННЯ МОНОКЛОНАЛЬНОГО АНТИТІЛА, ЯКЕ ІНГІБУЄ ШЛЯХ ПОВ'ЯЗАНОГО З ГЕНОМ КАЛЬЦИНОНІНУ ПЕПТИДУ (CGRP), ДЛЯ ЛІКУВАННЯ АБО ЗНИЖЕННЯ ЧАСТОТИ ВИПАДКІВ МІГРЕНОЗНОГО ГОЛОВНОГО БОЛЮ У СУБ'ЄКТА

(11) 123774

(51) МПК

C07K 16/18 (2006.01)

C12N 1/15 (2006.01)

C12N 1/19 (2006.01)

C12N 1/21 (2006.01)

C12N 5/10 (2006.01)

- (57) 1. Застосування моноклонального антитіла, яке інгібує шлях пов'язаного з геном кальцитоніну пептиду (CGRP), для лікування або зниження частоти випадків мігренозного головного болю у суб'єкта, при цьому моноклональне антитіло вводять підшкірно суб'єкту один раз на місяць в дозі 225 мг та, де моноклональне антитіло містить важкий ланцюг з амінокислотною послідовністю, як представлено в SEQ ID NO:11, та легкий ланцюг з амінокислотною послідовністю, як представлено в SEQ ID NO:12.
2. Застосування за пунктом 1, де мігренозний головний біль являє собою хронічну мігрень.
3. Застосування за пунктом 1, де мігренозний головний біль являє собою епізодичну мігрень.
4. Застосування за пунктом 1, де моноклональне антитіло є сформованим в концентрації щонайменше 150 мг/мл.
5. Застосування за пунктом 4, де моноклональне антитіло вводять в об'ємі приблизно 1,5 мл.
6. Застосування за пунктом 1, де моноклональне антитіло вводять в об'ємі менше ніж 2 мл.
7. Застосування за пунктом 6, де моноклональне антитіло є сформованим в концентрації щонайменше 150 мг/мл.
8. Застосування за пунктом 6, де моноклональне антитіло вводять в об'ємі приблизно 1,5 мл.
9. Застосування за пунктом 1, де введення включає застосування попередньо наповненого шприца, що містить певну кількість моноклонального антитіла.
10. Застосування за пунктом 1, де застосування додатково включає введення суб'єкту другого агента одночасно або послідовно з моноклональним антитілом.
11. Застосування за пунктом 10, де другий агент вибирають з групи, яка складається з: агоністів 5-HT₁, триптанів, алкалоїдів ріжків та нестероїдних протизапальних лікарських засобів.
12. Застосування за пунктом 11, де другий агент являє собою триптан.
13. Застосування за пунктом 1, де суб'єкт являє собою людину.
14. Застосування за пунктом 1, де моноклональне антитіло є людським або гуманізованим.

(11) 123773

(51) МПК (2021.01)
C07K 16/40 (2006.01)
A61K 39/395 (2006.01)
C12N 15/13 (2006.01)
 A61P 27/00

(21) а 2018 04022

(22) 27.10.2016

(24) 03.06.2021

(31) 62/248,871

(32) 30.10.2015

(33) US

(31) 62/345,669

(32) 03.06.2016

(33) US

(31) 62/411,113

(32) 21.10.2016

(33) US

(86) PCT/US2016/059110, 27.10.2016

- (72) Келлі Роберт Ф. (US), Кірчхофер Деніел К (US), Лай Джойс (US), Лі Чінгвей В. (US), Ліанг Вей-Чінг (US), Ліпарі Майкл Т. (US), Лют Келлі М. (US), Сай Тао (US), ван Лукерен Кемпагне Менно (US), Бу Ян (US), Фух Джермейн (US)

(73) ДЖЕНЕНТЕК, ІНК.

1 DNA Way, South San Francisco, CA 94080-4990, United States of America (US)

(54) ВИДІЛЕНЕ АНТИТІЛО ПРОТИ HtrA1 ТА ЙОГО ЗАСТОСУВАННЯ ПРИ ЛІКУВАННІ ПОВ'ЯЗАНОГО З HtrA1 ПОРУШЕННЯ АБО ХВОРОБИ ОКА

- (57) 1. Виділене антитіло, яке специфічно зв'язує HtrA1, причому антитіло містить зв'язуючий домен, що містить наступні шість HVR:
- (a) HVR-H1, що містить амінокислотну послідовність DSEMH (SEQ ID NO: 7);
- (b) HVR-H2, що містить амінокислотну послідовність GVDPETEGAAYNQKFKG (SEQ ID NO: 8);
- (c) HVR-H3, що містить амінокислотну послідовність GYDYDYLALDY (SEQ ID NO: 3);
- (d) HVR-L1, що містить амінокислотну послідовність RASSSVEFIH (SEQ ID NO: 9);
- (e) HVR-L2, що містить амінокислотну послідовність ATSNLAS (SEQ ID NO: 10);
- (f) HVR-L3, що містить амінокислотну послідовність QQWSSAPWT (SEQ ID NO: 11).
2. Антитіло за п. 1, яке **відрізняється** тим, що вказане антитіло містить домен VH, який містить амінокислотну послідовність, що має щонайменше 95 % ідентичність послідовності з амінокислотною послідовністю SEQ ID NO: 21, та домен VL, який містить амінокислотну послідовність, що має щонайменше 95 % ідентичність послідовності з амінокислотною послідовністю SEQ ID NO: 22.
3. Антитіло за п. 2, яке **відрізняється** тим, що домен VH містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO: 21, а домен VL містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO: 22.
4. Антитіло за будь-яким з пп. 1-3, яке **відрізняється** тим, що вказане антитіло є моноклональним, гуманізованим або химерним.
5. Антитіло за будь-яким з пп. 1-4, яке **відрізняється** тим, що вказане антитіло являє собою фрагмент антитіла, який зв'язується з HtrA1.
6. Антитіло за п. 5, яке **відрізняється** тим, що фрагмент антитіла вибраний з групи, що складається з фрагментів Fab, Fab'-SH, Fv, scFv та (Fab')₂.
7. Антитіло за п. 6, яке **відрізняється** тим, що фрагмент антитіла являє собою Fab.
8. Антитіло за п. 7, яке **відрізняється** тим, що Fab містить усичення у верхньому шарнірі константної ділянки важкого ланцюга.
9. Антитіло за п. 8, яке **відрізняється** тим, що константна ділянка важкого ланцюга закінчується положенням 221 (нумерація EU).
10. Антитіло за будь-яким з пп. 5-9, яке **відрізняється** тим, що вказане антитіло містить амінокислотну послідовність важкого ланцюга SEQ ID NO: 160.
11. Антитіло за будь-яким з пп. 5-10, яке **відрізняється** тим, що вказане антитіло містить амінокислотну послідовність легкого ланцюга SEQ ID NO: 159.
12. Антитіло за будь-яким з пп. 1-11, яке **відрізняється** тим, що вказане антитіло специфічно зв'язується з епітопом HtrA1, причому епітоп HtrA1 містить щонайменше одну амінокислоту білка HtrA1, вибра-

ну з групи, що складається з Arg190, Leu192, Pro193, Phe194 та Arg197.

13. Антитіло за п. 1 або 12, яке **відрізняється** тим, що епітоп HtrA1 містить щонайменше одну амінокислоту білка HtrA1, вибрану з групи, що складається з Leu192, Pro193 та Arg197.

14. Антитіло за п. 13, яке **відрізняється** тим, що епітоп HtrA1 містить амінокислоти HtrA1 Leu192, Pro193 та Arg197.

15. Антитіло за п. 14, яке **відрізняється** тим, що епітоп HtrA1 містить амінокислоти HtrA1 Arg190, Leu192, Pro193, Phe194 та Arg197.

16. Антитіло за будь-яким з пп. 1-15, яке **відрізняється** тим, що вказане антитіло являє собою біспецифічне антитіло.

17. Виділена нуклеїнова кислота, що кодує антитіло за будь-яким з пп. 1-16.

18. Спосіб отримання антитіла, при цьому вказаний спосіб включає культивування клітини-хазяїна, що містить вектор, який містить виділену нуклеїнову кислоту за п. 17, та виділення антитіла з клітини-хазяїна або культурального середовища клітини-хазяїна.

19. Фармацевтична композиція, яка містить антитіло за будь-яким з пп. 1-16 та додатково містить щонайменше один фармацевтично прийнятний носій, наповнювач або розбавлювач.

20. Фармацевтична композиція за п. 19, яка **відрізняється** тим, що вказана композиція є ліофілізованою.

21. Комбінована терапія, яка включає антитіло за будь-яким з пп. 1-16 та антагоніст фактора D, причому антагоніст фактора D являє собою антитіло проти фактора D.

22. Комбінована терапія за п. 21, яка **відрізняється** тим, що антитіло проти фактора D являє собою лампалізумаб.

23. Комбінована терапія за п. 21 або 22, яка **відрізняється** тим, що антагоніст проти фактора D вводять послідовно.

24. Застосування антитіла за будь-яким з пп. 1-16 при лікуванні пов'язаного з HtrA1 порушення або хвороби ока.

25. Застосування за п. 24, яке **відрізняється** тим, що пов'язане з HtrA1 порушення або хвороба ока являють собою вікову макулярну дегенерацію (ВМД), діабетичну ретинопатію, ретинопатію недоношених або поліпоподібну хоріоїдальну васкулопатію.

26. Застосування за п. 25, яке **відрізняється** тим, що пов'язане з HtrA1 порушення або хвороба ока являють собою ранню суху ВМД, проміжну суху ВМД або запущену суху ВМД.

27. Застосування за п. 26, яке **відрізняється** тим, що запущена суха ВМД являє собою географічну атрофію.

28. Застосування антитіла за будь-яким з пп. 1-16 для виготовлення лікарського засобу для лікування пов'язаного з HtrA1 порушення або хвороби ока.

29. Застосування за п. 28, яке **відрізняється** тим, що пов'язане з HtrA1 порушення або хвороба ока являють собою ВМД, діабетичну ретинопатію, ретинопатію недоношених або поліпоподібну хоріоїдальну васкулопатію.

30. Застосування за п. 29, яке **відрізняється** тим, що пов'язане з HtrA1 порушення або хвороба ока являють собою ранню суху ВМД, проміжну суху ВМД або запущену суху ВМД.

31. Застосування за п. 30, яке **відрізняється** тим, що запущена суха ВМД являє собою географічну атрофію.

32. Спосіб лікування пов'язаного з HtrA1 порушення або хвороби ока у суб'єкта-людини, яка має в цьому потребу, при цьому вказаний спосіб включає введення терапевтично ефективної кількості вказаного антитіла за будь-яким з пп. 1-16.

33. Спосіб за п. 32, в якому пов'язане з HtrA1 порушення або хвороба ока являють собою ВМД, діабетичну ретинопатію, ретинопатію недоношених або поліпоподібну хоріоїдальну васкулопатію.

34. Спосіб за п. 33, в якому пов'язане з HtrA1 порушення являє собою ранню суху ВМД, проміжну суху ВМД або запущену суху ВМД.

35. Спосіб за п. 34, в якому запущена суха ВМД являє собою географічну атрофію.

36. Спосіб за будь-яким з пп. 32-35, що додатково включає етап введення антагоніста фактора D, причому антагоніст фактора D являє собою антитіло проти фактора D.

37. Спосіб за п. 36, в якому антитіло проти фактора D являє собою лампалізумаб.

38. Спосіб або застосування за будь-яким з пп. 28-37, в якому антитіло вводять у скловидне тіло, очулярно, всередину ока, біля склери, у субтеноновий простір, у супрахоріоїдальний простір або місцево.

39. Спосіб або застосування за п. 38, в якому антитіло вводять у скловидне тіло шляхом ін'єкції.

40. Спосіб або застосування за будь-яким з пп. 28-37, який **відрізняється** тим, що вказане антитіло вводять системою доставки тривалої дії.

41. Спосіб або застосування за п. 40, який **відрізняється** тим, що система доставки тривалої дії являє собою твердий імплантат на основі PLGA або систему доставки з портом, що імплантується.

C 08

(11) 123784

(51) МПК

C08L 61/02 (2006.01)

C08L 89/06 (2006.01)

C08L 97/02 (2006.01)

(21) а 2018 09883

(22) 27.02.2017

(24) 03.06.2021

(31) 16000650.8

(32) 17.03.2016

(33) EP

(86) РСТ/EP2017/054480, 27.02.2017

(72) Едельманн Ханс-Йоахім (DE), Зандер Освальд (DE)

(73) СЕСТЕЦ СП. З О.О.

ul. Prof. M. Zyczkowskiego 16, 31-864 Kraków, Poland (PL)

(54) ЗВ'ЯЗУВАЛЬНА РЕЧОВИНА ДЛЯ ДЕРЕВА, ЯКА НЕ МІСТИТЬ ФОРМАЛЬДЕГІДУ

(57) 1. Зв'язувальна речовина, яка не містить формальдегіду, для целюлозовмісних матеріалів, яка містить гідроксильдегідну смолу, конденсовану із сіллю амонію.
2. Зв'язувальна речовина за п. 1, яка **відрізняється** тим, що гідроксильдегід для зв'язувальної смоли є

вуглеводним альдегідом й, зокрема, гліцеральдегідом.

3. Зв'язувальна речовина за п. 1 або 2, яка **відрізняється** тим, що гідроксальдегід формують із щонайменше біфункціональної гідроксисполуки з окислюючим агентом, зокрема пероксидом.

4. Зв'язувальна речовина за будь-яким із пп. 1-3, яка **відрізняється** тим, що не містить сечовину.

5. Зв'язувальна речовина за будь-яким із пп. 1-4, яка **відрізняється** тим, що містить білковий компонент.

6. Зв'язувальна речовина за п. 5, яка **відрізняється** тим, що білковий компонент оснований на крові тварин і, зокрема, містить гемоглобін крові тварин або концентрат білка крові тварин.

7. Зв'язувальна речовина за будь-яким із пп. 1-6, яка **відрізняється** тим, що сіль амонію є одною сіллю або сумішшю солей, вибраних із групи сульфату амонію, амонієво-алюмінієвих галунів, зокрема подвійної солі амонію й алюмінію, лігносульфонату амонію й гідрофосфату амонію.

8. Зв'язувальна речовина за будь-яким із пп. 1-7, яка **відрізняється** тим, що вміст солі амонію складає щонайменше 50 мас. % відносно всіх азотовмісних компонентів, здатних до поперечного зшивання з гідроксальдегідами, без врахування можливо присутнього білкового компонента, де, зокрема, може бути присутньою частина мелаїну.

9. Зв'язувальна речовина за п. 8, яка **відрізняється** тим, що масова частка суми всіх азотовмісних компонентів, здатних до поперечного зшивання з гідроксальдегідами, включаючи сіль амонію, за винятком білків, складає щонайменше 15 мас. % зв'язувальної речовини.

10. Зв'язувальна речовина за будь-яким із пп. 1-9, яка **відрізняється** тим, що є дво- або багатокомпонентною зв'язувальною речовиною, компоненти якої змішують безпосередньо перед застосуванням або наносять окремо.

11. Виріб з композитного матеріалу, який одержується шляхом зв'язування целюлозовмісного вихідного матеріалу зв'язувальною речовиною за будь-яким із пп. 1-10 і формування виробу.

12. Виріб з композитного матеріалу за п. 11, який **відрізняється** тим, що вихідний матеріал є деревом і/або папером.

13. Виріб з композитного матеріалу за п. 11 або 12, який **відрізняється** тим, що має плоску форму й переважно пресованої плити або ламінату.

14. Спосіб одержання зв'язувальної речовини за будь-яким із пп. 1-10, де сіль амонію змішують із гідроксальдегідом або сіль амонію змішують зі щонайменше біфункціональною гідроксисполукою й окислюючим агентом.

15. Спосіб за п. 14, який **відрізняється** тим, що змішують воду в кількості не більше 48 мас. %, щонайменше одну сіль амонію, гліцерин, пероксид водню, білковий компонент, необов'язково додатковий амін або амід, а також необов'язково добавки й допоміжні речовини.

16. Спосіб зв'язування целюлозовмісних матеріалів, який включає нанесення зв'язувальної речовини за будь-яким із пп. 1-10 на целюлозовмісний матеріал і вплив тепла і тиску.

17. Спосіб за п. 16, який **відрізняється** тим, що зв'язаний целюлозовмісний матеріал формують з одержанням виробу з композитного матеріалу.

C 12

(11) 123757

(51) МПК

C12N 5/14 (2006.01)

C12N 9/02 (2006.01)

C12N 15/29 (2006.01)

C12N 15/63 (2006.01)

C12N 15/82 (2006.01)

A01H 5/10 (2018.01)

(21) а 2016 02348

(22) 12.08.2014

(24) 03.06.2021

(31) 61/864,672

(32) 12.08.2013

(33) US

(31) 61/864,671

(32) 12.08.2013

(33) US

(86) PCT/IB2014/063873, 12.08.2014

(72) Апонте Рафаель (DE), Треш Штефан (DE), Вічель Маттіас (DE), Лерхль Єнс (DE), Масса Даріо (DE), Зайсер Тобіас (DE), Мітцнер Томас (DE), Полік Джілл Марі (US), Броммер Чед (US)

(73) БАСФ АГРО Б. В.

Groningsingel 1, NL-6835 EA Arnhem, The Netherlands (NL)

(54) МУТОВАНА ПРОТОПОРФІРИНОГЕНОКСИДАЗА, ЩО НАДАЄ РОСЛИНАМ СТІЙКОСТІ ДО ППО-ІНГІБУЮЧОГО ГЕРБІЦИДУ

(57) 1. Виділена та/або рекомбінантна, та/або штучна нуклеїнова кислота, яка кодує поліпептид мutowаної протопорфіриногеноксидази (ППО), де нуклеїнова кислота містить варіант нуклеотидної послідовності SEQ ID NO: 1, та де мutowана ППО містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO: 2, в якій амінокислота в положенні 128 являє собою Ala; та де амінокислота в положенні 420 являє собою Val.

2. Поліпептид мutowаної ППО, що містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO: 2, де амінокислота в положенні 128 являє собою Ala, та де амінокислота в положенні 420 являє собою Val, де вказаний поліпептид мutowаної ППО забезпечує підвищену резистентність або толерантність до ППО-інгібуючого гербіциду рослини, порівняно із рослиною дико-го типу.

3. Трансгенна рослинна клітина, яка трансформована та експресує нуклеїнову кислоту, яка кодує поліпептид мutowаної ППО за п. 2, де експресія нуклеїнової кислоти у рослинній клітині приводить до підвищення резистентності або толерантності до ППО-інгібуючого гербіциду, порівняно із рослинною клітиною дико-го типу.

4. Трансгенна рослина, що містить рослинну клітину за п. 3, де експресія нуклеїнової кислоти, що кодує поліпептид мutowаної ППО, у рослині приводить до підвищення резистентності або толерантності до ППО-інгібуючого гербіциду, порівняно із рослиною дико-го типу.

5. Мутантна рослинна клітина, яка експресує нуклеїнову кислоту, що кодує поліпептид мутованої ППО за п. 2.

6. Рослина, що експресує мутагенізований або рекомбінантний поліпептид мутованої ППО за п. 2, та де вказана мутована ППО забезпечує рослину, при експресії в ній, підвищеною толерантністю до гербіциду, порівняно із рослиною дикого типу.

7. Спосіб вирощування рослини за п. 4 або 6 шляхом боротьби із бур'янами поблизу вказаної рослини, де вказаний спосіб включає наступні стадії:

а) вирощування вказаної рослини; та

б) нанесення гербіцидної композиції, що містить ППО-інгібуючий гербіцид, на рослину та бур'яни, де гербіцид в нормі інгібує протопорфіриногеноксидазу, із концентрацією гербіциду, що пригнічує ріст відповідної рослини дикого типу.

8. Насіння рослини, яка містить рослинну клітину за п. 3 або 5, або рослини за п. 4 або 6, де насіння є гомозиготним щодо підвищеної резистентності до ППО-інгібуючого гербіциду, порівняно із насінням рослини дикого типу.

9. Спосіб одержання трансгенної рослинної клітини із підвищеною резистентністю до ППО-інгібуючого гербіциду, порівняно із рослинною клітиною рослини дикого типу, який включає трансформування рослинної клітини експресійною касетою, яка містить нуклеїнову кислоту, що кодує поліпептид мутованої ППО за п. 2.

10. Спосіб одержання трансгенної рослини, який включає (а) трансформування рослинної клітини експресійною касетою, яка містить нуклеїнову кислоту, що кодує поліпептид мутованої ППО за п. 2, та (б) генерування рослини із підвищеною резистентністю до ППО-інгібуючого гербіциду з рослинної клітини.

11. Спосіб за будь-яким з пп. 9-10, де експресійна касета також містить регуляторну ділянку ініціації транскрипції та регуляторну ділянку ініціації трансляції, що функціонують у рослині.

12. Експресійна касета, що містить нуклеїнову кислоту, що кодує поліпептид мутованої ППО за п. 2, регуляторну ділянку ініціації транскрипції та регуляторну ділянку ініціації трансляції, що функціонують у рослині, та хлоропластспрямовуючу послідовність, яка містить нуклеотидну послідовність, що кодує транзитний пептид хлоропласту.

13. Експресійна касета за п. 12, де спрямовуюча послідовність містить нуклеотидну послідовність, що кодує транзитний пептид, який містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO: 49, 50, 51, 52 або 53.

C21D 6/00

B01J 19/02 (2006.01)

F28F 21/08 (2006.01)

B01D 1/06 (2006.01)

C22C 38/58 (2006.01)

(21) а 2018 01224

(22) 20.07.2016

(24) 03.06.2021

(86) PCT/NL2016/050542, 20.07.2016

(72) Гульберг Даніель (SE), Харальдсон Крістіна (SE), Вільсон Андерс (SE), Шердер Александер Алейда Антоніус (NL), Офей Кірк Ангуах (NL)

(73) СТАМІКАРБОН Б.В.

Mercator 3, 6135 KW Sittard, The Netherlands (NL)

(54) ДУПЛЕКСНА НЕРЖАВІЮЧА СТАЛЬ І ІЇ ВИКОРИСТАННЯ

(57) 1. Застосування дуплексної нержавіючої сталі в карбаматному середовищі, де вказане застосування включає вплив на сталь рідинного середовища, що містить карбамат, причому дуплексна нержавіюча сталь містить, мас. %:

C - макс. 0,030,

Si - макс. 0,8,

Mn - 0,5-1,5,

Cr - 29,0-31,0,

Ni - 5,0-9,0,

Mo - менше ніж 4,0,

W - менше ніж 4,0,

N - 0,25-0,45,

Cu - макс. 2,0,

S - макс. 0,02,

P - макс. 0,03

та Ti, Nb, Hf, Ca, Al, Ba, V, Ce, та B у кількості макс. 0,5 мас. % загалом, решта - Fe і неминучі домішки, і де вміст Mo+W перевищує 3,0, але є меншим ніж 4,0.

2. Застосування дуплексної нержавіючої сталі за п. 1, яке **відрізняється** тим, що вміст Si становить 0,010-0,50 мас. %.

3. Застосування дуплексної нержавіючої сталі за будь-яким з пп. 1, 2, яке **відрізняється** тим, що вміст Ni становить 5,5-8,5 мас. %.

4. Застосування дуплексної нержавіючої сталі за будь-яким з пп. 1-3, яке **відрізняється** тим, що вміст N становить 0,28-0,40 мас. %.

5. Застосування дуплексної нержавіючої сталі за п. 1, яке **відрізняється** тим, що вміст Si становить 0,010-0,50 мас. %, вміст Ni становить 5,5-8,5 мас. % і вміст N становить 0,28-0,40 мас. %.

6. Застосування дуплексної нержавіючої сталі за будь-яким з пп. 1-5 у процесі синтезу карбаміду для зниження корозії в одній або більше деталях секції високого тиску для синтезу карбаміду, яка контактує з розчином карбамату амонію.

7. Сформований виріб, який містить дуплексну нержавіючу сталь, як визначено в будь-якому одному з пп. 1-5, який **відрізняється** тим, що вказаний сформований виріб являє собою відпарювальну трубу в устаткуванні для виробництва карбаміду або розподільник рідини для відпарювальної секції в устаткуванні для виробництва карбаміду.

8. Спосіб виробництва карбаміду, що включає реагування аміаку та діоксиду вуглецю в умовах утворення карбаміду в устаткуванні для виробництва карбаміду, який **відрізняється** тим, що принаймні одна деталь обладнання в устаткуванні для виробництва

C 21

(11) 123771

(51) МПК (2021.01)

C21D 8/00

C07C 273/04 (2006.01)

C21D 9/08 (2006.01)

C22C 33/04 (2006.01)

C22C 38/02 (2006.01)

C22C 38/04 (2006.01)

C22C 38/44 (2006.01)

карбаміду виготовлена з дуплексної нержавіючої сталі, як визначено в будь-якому одному з пп. 1-5.

9. Устаткування для виробництва карбаміду, яке **відрізняється** тим, що вказане устаткування містить одну або більше деталей, що містять дуплексну нержавіючу сталь, як визначено в будь-якому одному з пп. 1-5.

10. Устаткування за п. 9, яке **відрізняється** тим, що вказана одна або більше деталей являють собою одну або більше відпарювальних труб.

11. Устаткування за п. 9 або 10, яке містить секцію високого тиску для синтезу карбаміду, яка містить відпарювальну секцію, причому відпарювальна секція містить принаймні один розподільник рідини, який містить дуплексну нержавіючу сталь, як визначено в будь-якому одному з пп. 1-5.

12. Спосіб модифікації існуючого устаткування для виробництва карбаміду, причому вказане устаткування містить один або більше компонентів, вибраних із групи, що складається з розподільників рідини, радарних конусів, (контрольних) клапанів і ежекторів, при цьому вказаний спосіб включає стадію заміни однієї або більше відпарювальних труб відпарювальною трубою, яка містить дуплексну нержавіючу сталь, як визначено в будь-якому одному з пп. 1-5.

B23K 101/18 (2006.01)

B23K 103/18 (2006.01)

(21) а 2019 03456

(22) 05.04.2019

(24) 03.06.2021

(72) Лобанов Леонід Михайлович (UA), Аснїс Юхим Аркадійович (UA), Вржижевський Едуард Леонович (UA), Піскун Наталія Василівна (UA), Статкевич Ігор Іванович (UA)

(73) ІНСТИТУТ ЕЛЕКТРОЗВАРЮВАННЯ ІМ. Є.О. ПАТОНА НАЦІОНАЛЬНОЇ АКАДЕМІЇ НАУК УКРАЇНИ вул. Малевича, 11, м. Київ-150, 03680 (UA)

(54) СПОСІБ ЛОКАЛЬНОЇ ТЕРМІЧНОЇ ОБРОБКИ ЗВАРНИХ З'ЄДНАНЬ ІНТЕРМЕТАЛІДУ СИСТЕМИ ТИТАН-АЛЮМІНІЙ

(57) 1. Спосіб локальної термічної обробки зварних з'єднань інтерметаліду системи титан-алюміній, одержаних електронно-променевим зварюванням, який **відрізняється** тим, що зварювання і термообробку здійснюють у висячому положенні при консольному закріпленні зразків у спеціальному пристрої, при цьому термообробку проводять відразу після закінчення процесу зварювання, забезпечуючи швидкість охолодження зварного з'єднання не більше 70 °C/с.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що електронний промінь розфокусовують від Ø2 мм при зварюванні до Ø15 мм при термообробці, при цьому зварювальний струм зменшують на 1/3.

3. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що щільність струму променя при термообробці знижують до 0,15 мА/мм², що дозволяє підтримувати рівень температури зварного з'єднання - 1000 °C.

4. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що час витримки при термообробці складає не менше 10 хвилин.

C 22

(11) 123798

(51) МПК (2021.01)

C22F 1/18 (2006.01)

C22F 1/04 (2006.01)

B23K 15/00

B23K 101/16 (2006.01)

Розділ Е:**Будівництво****Е 21**

- (11) **123770** (51) МПК (2021.01)
E21C 41/18 (2006.01)
E21D 11/00
- (21) а 2018 00684 (22) 24.06.2016
(24) 03.06.2021
(31) 201510354518.X
(32) 24.06.2015
(33) CN
(31) 201510634165.9
(32) 29.09.2015
(33) CN
(86) PCT/CN2016/086984, 24.06.2016
(72) Хе Маньчао (CN), Го Чжібяо (CN)
(73) **ХЕ МАНЬЧАО**
D11 Xueyuan Road, Haidian District, Beijing 100083,
China (CN)
- (54) **ПРОТИОБВАЛЬНА КОНСТРУКЦІЯ ВІДКОТНОГО ШТРЕКУ, ЗАСТОСОВАНА В СИСТЕМІ 110 РОЗРОБКИ ПОКЛАДІВ КОРИСНИХ КОПАЛИН**

- (57) 1. Протиобвальна конструкція відкотного штреку, застосована в системі 110 розробки покладів корисних копалин, в якій покрівля штреку є аркоподібною, відсічну щілину, що простягається вздовж однієї стінки відкотного штреку, виконано під кутом 15-20 градусів до вертикального напрямку, яка **відрізняється** тим, що аркоподібна покрівля є аркою з трьома центрами, що складається з трьох плавно з'єднаних дуг.
2. Конструкція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що покрівлю штреку підтримують анкерні стрижні та/або канатні відтяжки.
3. Конструкція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що штрек підтримує сітка з композитного матеріалу для стримування маси порожньої породи на боці послабленого тиску.
4. Конструкція за п. 3, яка **відрізняється** тим, що штрек підтримує сталева опора двотаврового перерізу.
5. Конструкція за п. 4, яка **відрізняється** тим, що штрек підтримують густо розташовані тимчасові опори перед робочим вибоєм.
6. Конструкція за п. 5, яка **відрізняється** тим, що сталева опора двотаврового перерізу та опора, що стоїть поруч перед робочим вибоєм, розташовані на віддалі одна від одної і з'єднані сіткою з композитного матеріалу як одне ціле для стримування маси порожньої породи.

Розділ F:

**Машинобудування.
Освітлювання. Опалювання.
Зброя. Підrivні роботи**

F 02

- (11) **123806** (51) МПК
F02D 33/02 (2006.01)
F02D 41/04 (2006.01)
- (21) а 2019 05320 (22) 20.05.2019
(24) 03.06.2021
- (72) Борисенко Анатолій Миколайович (UA), Борисенко Євген Анатолійович (UA), Богаєвський Олександр Борисович (UA)
- (73) **НАЦІОНАЛЬНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ "ХАРКІВСЬКИЙ ПОЛІТЕХНІЧНИЙ ІНСТИТУТ"**
вул. Кирпичова, 2, м. Харків-2, 61002 (UA)
- БОРИСЕНКО АНАТОЛІЙ МИКОЛАЙОВИЧ**
просп. П. Григоренка, 10, кв. 9, м. Харків, 61100 (UA)
- БОРИСЕНКО ЄВГЕН АНАТОЛІЙОВИЧ**
бульвар Жасминовий, 11, кв. 2, м. Харків, 61100 (UA)
- БОГАЄВСЬКИЙ ОЛЕКСАНДР БОРИСОВИЧ**
вул. Олімпійська, 25, кв. 61, м. Харків, 61060 (UA)
- (54) **СИСТЕМА РЕГУЛЮВАННЯ ПОДАЧІ ДОДАТКОВОГО ПОВІТРЯ В ДИЗЕЛЬ**
- (57) Система регулювання подачі додаткового повітря в дизель, що містить блок управління, фотоелектричний димомір і датчик частоти обертання, підключені до входів блока управління, джерело стиснутого повітря з встановленим в ньому датчиком тиску, електропневмоклапан з електродинамічним приводом, встановлений в магістралі подачі повітря від джерела до впускного трубопроводу дизеля, перший неінвертуючий та інвертуючий підсилювачі і реле з нормально розімкнутим контактом, причому вихід датчика тиску через інвертуючий підсилювач з'єднаний з шиною живлення першого неінвертуючого підсилювача, а обмотка реле підключена до виходу блока управління, другий неінвертуючий підсилювач і елемент пам'яті, причому вихід першого неінвертуючого підсилювача через контакт реле з'єднано з входом елемента пам'яті, вихід якого підключено до входу другого неінвертуючого підсилювача, вихід фотоелектричного димоміра з'єднано з входом першого неінвертуючого підсилювача, яка **відрізняється** тим, що з метою підвищення екологічних показників дизеля в неї введено третій неінвертуючий підсилювач з коефіцієнтом підсилення, більшим за одиницю, і баластний резистор, причому вхід третього підсилювача підключено до виходу другого неінвертуючого підсилювача, а вихід - через баластний резистор з'єднано з обмоткою електропневмоклапана з електродинамічним приводом.

- (11) **123799** (51) МПК
F02K 9/82 (2006.01)
- (21) а 2019 03918 (22) 15.04.2019
(24) 03.06.2021
- (72) Ігнат'єв Олександр Дмитрович (UA), Прядко Наталія Сергіївна (UA), Сироткіна Наталія Петрівна (UA), Стрельников Геннадій Опанасович (UA), Токарева Олена Леонідівна (UA)
- (73) **ІНСТИТУТ ТЕХНІЧНОЇ МЕХАНІКИ НАЦІОНАЛЬНОЇ АКАДЕМІЇ НАУК І ДЕРЖАВНОГО КОСМІЧНОГО АГЕНТСТВА УКРАЇНИ**
вул. Лешко-Попеля, 15, м. Дніпро, 49005 (UA)
- (54) **КОМБІНОВАНИЙ СПОСІБ КЕРУВАННЯ ВЕКТОРОМ ТЯГИ РАКЕТНОГО ДВИГУНА**
- (57) Комбінований спосіб керування вектором тяги ракетного двигуна, який оснований на сукупному застосуванні повороту двигуна в карданному шарнірі для створення більших низькочастотних керуючих зусиль для програмного наведення ступеня ракети і упорскуванні компонентів палива у надзвукову частину сопла двигуна для створення невеликих високочастотних зусиль, необхідних для стабілізації ступеня ракети, який **відрізняється** тим, що поворот двигуна в шарнірі на заданий системою керування вектором тяги кут здійснюють силою, яку утворюють за рахунок упорскування компонента палива в надзвукову частину сопла, після чого шарнір фіксують в заданому положенні, а силу, яка повертає двигун, обнуляють, тобто припиняють упорскування палива для повороту двигуна в шарнірі, при цьому малі керуючі зусилля з високою частотою коливань, які оптимізуються системою керування вектором тяги, створюють малими, необхідними порціями компонента палива, що упорскується.

F 16

- (11) **123817** (51) МПК
F16L 15/04 (2006.01)
E21B 17/042 (2006.01)
E21B 17/08 (2006.01)
- (21) а 2019 11836 (22) 11.04.2018
(24) 03.06.2021
- (31) 2017-096651
(32) 15.05.2017
(33) JP
(86) PCT/JP2018/015263, 11.04.2018
- (72) Марута Сатосі (JP), Оку Йоусуке (JP), Накамура Тадасі (JP)
- (73) **НІППОН СТІЛ КОРПОРЕЙШН**
6-1, Marunouchi 2-chome, Chiyoda-ku, Tokyo 1008071, Japan (JP)
- ВАЛЛУРЕК ОЙЛ ЕНД ҐЕС ФРАНС**
54 rue Anatole France, Aulnoye-Aymeries 59620, France (FR)
- (54) **НАРІЗНЕ З'ЄДНАННЯ ДЛЯ СТАЛЕВИХ ТРУБ**
- (57) 1. Нарізне з'єднання для сталевих труб, що містить трубчастий ніпель і трубчасту муфту, в якому

ніпель містить, в порядку від сторони вільного кінця ніпеля до сторони його трубчастого корпусу, внутрішню ущільнювальну поверхню, внутрішню нарізну ділянку із зовнішньою різьєю, ділянку запличика, зовнішню нарізну ділянку із зовнішньою різьєю і зовнішню ущільнювальну поверхню;

муфта містить, в порядку від сторони трубчастого корпусу муфти до її сторони вільного кінця, внутрішню ущільнювальну поверхню, внутрішню нарізну ділянку з внутрішньою різьєю, ділянку запличика, зовнішню нарізну ділянку з внутрішньою різьєю і зовнішню ущільнювальну поверхню, при цьому нарізне з'єднання включає в себе щонайменше одну з наступних конфігурацій (1) і (2):

(1) внутрішня канавка передбачена по окружності між внутрішньою ущільнювальною поверхнею і внутрішньою нарізною ділянкою з внутрішньою різьєю муфти, причому множина витків різі внутрішньої нарізної ділянки із зовнішньою різьєю ніпеля міститься у внутрішній канавці, і

(2) зовнішня канавка передбачена по окружності між зовнішньою ущільнювальною поверхнею і зовнішньою нарізною ділянкою із зовнішньою різьєю ніпеля, причому множина витків різі зовнішньої нарізної ділянки з внутрішньою різьєю муфти міститься у зовнішній канавці.

2. Нарізне з'єднання для сталевих труб за п. 1, в якому, коли передбачена конфігурація (1), довжина вздовж осі труби внутрішньої канавки муфти більша, ніж крок різі внутрішньої нарізної ділянки з внутрішньою різьєю.

3. Нарізне з'єднання для сталевих труб за п. 1, в якому, коли передбачена конфігурація (2), довжина вздовж осі труби зовнішньої канавки ніпеля більша, ніж крок різі зовнішньої нарізної ділянки із зовнішньою різьєю.

4. Нарізне з'єднання для сталевих труб за п. 2, в якому, коли передбачена конфігурація (1), довжина вздовж осі труби внутрішньої канавки муфти не більше ніж в 4 рази більша за крок різі внутрішньої нарізної ділянки з внутрішньою різьєю.

5. Нарізне з'єднання для сталевих труб за п. 3, в якому, коли передбачена конфігурація (2), довжина вздовж осі труби зовнішньої канавки ніпеля не більше ніж в 4 рази більша за крок різі зовнішньої нарізної ділянки із зовнішньою різьєю.

6. Нарізне з'єднання для сталевих труб за будь-яким одним з пп. 2 або 4, в якому, коли передбачена конфігурація (1), глибина внутрішньої канавки муфти не менша, ніж висота різі внутрішньої нарізної ділянки з внутрішньою різьєю, і не більше ніж в два рази більша за висоту різі.

7. Нарізне з'єднання для сталевих труб за будь-яким одним з пп. 3 або 5, в якому, коли передбачена конфігурація (2), глибина зовнішньої канавки ніпеля складає не менше, ніж висота різі зовнішньої нарізної ділянки із зовнішньою різьєю, і не більше ніж в два рази більша за висоту різі

8. Нарізне з'єднання для сталевих труб за будь-яким одним з пп. 1-7, в якому зовнішній діаметр муфти складає не більше 110 % від зовнішнього діаметра трубчастого корпусу ніпеля.

9. Нарізне з'єднання для сталевих труб за будь-яким одним з пп. 1-8, в якому нарізна ділянка, що складається з внутрішньої нарізної ділянки із зовнішньою

різью і внутрішньої нарізної ділянки з внутрішньою різьєю, і нарізна ділянка, що складається із зовнішньої нарізної ділянки із зовнішньою різьєю і зовнішньої нарізної ділянки з внутрішньою різьєю, кожна являє собою конічну різь трапецеїдального типу.

10. Нарізне з'єднання для сталевих труб за п. 9, в якому кожна з конічних різей містить вершини, заглиблення, закладні сторони і опорні сторони, при цьому вершини внутрішньої нарізної ділянки із зовнішньою різьєю і заглиблення внутрішньої нарізної ділянки з внутрішньою різьєю знаходяться в контакті одне з одним, а опорні сторони внутрішньої нарізної ділянки із зовнішньою різьєю і опорні сторони внутрішньої нарізної ділянки з внутрішньою різьєю знаходяться в контакті одна з одною,

заглиблення зовнішньої нарізної ділянки із зовнішньою різьєю і вершини зовнішньої нарізної ділянки із зовнішньою різьєю знаходяться в контакті одне з одним, і опорні сторони зовнішньої нарізної ділянки із зовнішньою різьєю і опорні сторони зовнішньої нарізної ділянки з внутрішньою різьєю знаходяться в контакті одна з одною.

F 26

(11) 123816

(51) МПК (2021.01)
F26B 3/084 (2006.01)
F26B 23/00
F26B 23/10 (2006.01)
F26B 17/10 (2006.01)

(21) а 2019 11792

(22) 14.05.2018

(24) 03.06.2021

(31) 10 2017 110 534.4

(32) 15.05.2017

(33) DE

(86) РСТ/ЕР2018/062336, 14.05.2018

(72) Касперс Геральд (DE), Гафеманн Гартмут (DE)

(73) БМА БРАУНШВАЙГШЕ МАШИНЕНБАУ АНШТАЛТ АГ
Am alten Bahnhof 5, 38122 Braunschweig, Germany (DE)

(54) ВИПАРНА СУШАРКА І СПОСІБ ЇЇ ЕКСПЛУАТАЦІЇ

(57) 1. Випарна сушарка (1) для висушування частинок, з - технологічною камерою (10) щонайменше з одним впуском (11) для продукту для введення висушуваних частинок в технологічну камеру (10) і випуском (12) для продукту для виведення висушених частинок з технологічної камери (10),
- розміщеним всередині технологічної камери (10) теплообмінником (20),
- щонайменше одним впуском (21, 211) в теплообміннику (20) для пари високого тиску як нагрівальної пари і щонайменше одним випуском (22, 222) для конденсату з теплообмінника (20), причому
- згаданий щонайменше один випуск (22, 222) для конденсату з'єднаний з розширювальним баком (30), яка відрізняється тим, що до розширювального бака (30) приєднаний щонайменше один насос (40), який відкачує м'яту пару з розширювального бака (30) і подає її в нагрівальну пару.

2. Випарна сушарка за п. 1, яка відрізняється тим, що насос (40) виконаний у вигляді пароструминного

насоса з підключенням (41) для робочої пари, і до підключення (41) для робочої пари подається щонайменше один частковий потік нагрівальної пари.

3. Випарна сушарка за п. 1 або 2, яка **відрізняється** тим, що насос (40) виконаний як механічний всмоктувальний насос.

4. Випарна сушарка за одним з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що тиск всередині розширювального бака (30) налаштований нижче тиску нагрівальної пари.

5. Випарна сушарка за одним з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що теплообмінник (20) сформований багатоступінчастим, і в перший ступінь (23) може подаватися змішана пара з нагрівальної пари і м'ятої пари, і у другий ступінь (25) підводиться нагрівальна пара теплообмінника (20).

6. Випарна сушарка за п. 5, яка **відрізняється** тим, що з обома ступенями (23, 25) узгоджені окремі конденсатозбірники (33, 35), які зв'язані з розширювальним баком (30).

7. Випарна сушарка за п. 6, яка **відрізняється** тим, що конденсатозбірники (33, 35) через регулювальний вентиль (53, 55) з'єднані з розширювальним баком (30).

8. Випарна сушарка за п. 6 або 7, яка **відрізняється** тим, що конденсатозбірники (33, 35) мають тиск на рівні висоти тиску нагрівальної пари або нижче.

9. Випарна сушарка за одним з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що вона сформована як випарна сушарка з псевдозрідженим шаром з кільцеподібною технологічною камерою (10) і оснащена подавальним транспортером (16) для введення флюїдизуючого агента знизу в технологічну камеру (10), причому технологічна камера (10) утворена протяжними у вертикальному напрямку секціями, з яких одна секція утворює випускную секцію, через яку флюїдизуючий агент не протікає або протікає меншою мірою, на нижньому кінці якої розміщений випуск (12) для продукту, і секції відкриті на своїх верхніх кінцях.

10. Випарна сушарка за одним з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що декілька насосів (40) підключені паралельно один одному.

11. Випарна сушарка за одним з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що в технологічній камері (10) є підвищений тиск.

12. Випарна сушарка за одним з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що від розширювального бака (30) з'єднувальний трубопровід (42) веде до місця (3) змішування, яке знаходиться після парогенератора (2) і в якому нагрівальна пара змішується з конденсатом з розширювального бака (30) і/або з конденсатозбірників (33, 35, 36).

13. Випарна сушарка за одним з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що між насосом (40) і парогенератором (2) розміщений регулювальний вентиль (54).

14. Випарна сушарка за одним з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що конденсат з нагрітих пластин (28) або нагрівальних пристроїв з технологічної камери (10), або які знаходяться поза технологічною камерою (10), подається в розширювальний бак (30), безпосередньо або через конденсатозбірник (33, 35, 36) або відповідний пристрій (37) конденсату.

15. Спосіб експлуатації випарної сушарки (1) для висушування частинок, з

- технологічною камерою (10) щонайменше з одним впуском (11) для продукту, через який висушувати частинки вводяться в технологічну камеру (10), і випуском (12) для продукту, через який висушені частинки виводяться з технологічної камери (10),

- теплообмінником (20), в якому щонайменше через один впуск (21, 211) подається пара високого тиску як нагрівальна пара і з якого щонайменше через один випуск (22, 222) для конденсату виводиться конденсат і подається в розширювальний бак (30), який **відрізняється** тим, що з розширювального бака (30) щонайменше через один насос (40) відкачується м'ята пара і подається в нагрівальну пару.

16. Спосіб за п. 15, який **відрізняється** тим, що нагрівальна пара подається у випарну сушарку (1) з різних парогенераторів (2) з різними властивостями пари.

F 41

(11) 123809

(51) МПК (2021.01)
F41H 1/02 (2006.01)
A43B 15/00
A43B 13/02 (2006.01)
A43B 13/14 (2006.01)
D03D 9/00

(21) а 2019 07912

(22) 10.01.2018

(24) 03.06.2021

(31) P201730023

(32) 12.01.2017

(33) ES

(86) PCT/ES2018/070020, 10.01.2018

(72) Морон Рубіо Хосе Антоніо (ES)

(73) АНТОНІО МОРОН ДЕ БЛАС, С.Л.

Polígono Raposal 38-40, Arnedo, 26580 Arnedo (La Rioja), Spain (ES)

(54) ТКАНИНА З ОСНОВНИХ І УТОКОВИХ НИТОК ДЛЯ ПІДОШОВ СПЕЦІАЛЬНОГО ВЗУТТЯ БЕЗ МЕТАЛЕВИХ ВСТАВОК І ОТРИМАНА УСТІЛКА

(57) 1. Тканина з основних і уткових ниток для підошов спеціального взуття без металевих вставок, яка **відрізняється** тим, що вона є моношаровою композицією тканиною, яка містить принаймні 60 % високоміцних ниток, де нитки мають номери 800-2800 Dtex, і де кожна нитка складається з волокон, які мають тонину 1-6 Dtex, при цьому тканина сформована 1-10 шарами основних ниток, зв'язаних з 5-10 шарами уткових ниток, з одержанням тканини, яка має товщину 2,5-6 мм і масу на одиницю площі 2000-5000 г/м², при цьому її міцність перевищує 1000 Н при пробиванні сталевим гвіздом діаметром 2,5-5,0 мм і виготовлена за допомогою ткання з використанням основних і уткових ниток.

2. Тканина з основних і уткових ниток для підошов спеціального взуття без металевих вставок за п. 1, яка **відрізняється** тим, що високоміцні нитки є поліестерними нитками, поліамідними нитками, поліпропіленовими нитками або їх сумішами.

3. Тканина з основних і уткових ниток для підошов спеціального взуття без металевих вставок за будь-яким із попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим,

що вона має багатоволоконні нитки, виготовлені з синтетичного полімеру, оточеного провідною ниткою.

4. Тканина з основних і утокових ниток для підшов спеціального взуття без металевих вставок за будь-яким із попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що вона містить арамідні волокна в кількості 1-40 %.

5. Тканина з основних і утокових ниток для підшов спеціального взуття без металевих вставок за будь-яким із попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що вона має покриття з полімерної смоли, сформоване натуральним низькосортним каучуком, нанесене скребком на щонайменше одну з її граней, що дозволяє отриманій тканині забезпечити більшу механічну міцність.

6. Устілка для взуття, одержана на основі тканини з основних і утокових ниток за будь-яким із попередніх пунктів.

F 42

(11) 123778

(51) МПК (2021.01)
F42D 3/04 (2006.01)
E21C 41/22 (2006.01)
E21C 37/00

(21) а 2018 07683

(22) 09.07.2018

(24) 03.06.2021

(72) Гапоненко Анатолій Леонідович (UA)

(73) ГАПОНЕНКО АНАТОЛІЙ ЛЕОНІДОВИЧ

м-р 5-й Зарічний, 40, кв. 56, м. Кривий Ріг, 50081 (UA)

(54) СПОСІБ ВЕДЕННЯ ПІДРИВНИХ РОБІТ ПРИ ПІДЗЕМНІЙ РОЗРОБЦІ РУДНИХ ПОКЛАДІВ

(57) 1. Спосіб ведення підривних робіт при підземній розробці рудних покладів, що включає вибурювання вис-

хідної свердловини, розміщення в ній вибухової речовини і засобів ініціювання, ізолювання заряду вибухової речовини забивкою, який **відрізняється** тим, що після вибурювання висхідної свердловини визначають розрахункову довжину концентрованого заряду в ній і у встановленому місці розміщують комплект шашок-бойовиків, при цьому загальна довжина комплекту становить розрахункову довжину концентрованого заряду, після цього ініціюють шашки-бойовики і руйнують за допомогою виконаного вибуху приконтантні до шашок гірські породи, а зруйновану гірську масу під дією сил гравітації переміщують по свердловині на підшву виробки, створюючи порожнину розрахункового об'єму, у яку подають засоби ініціювання і вибухову речовину, при цьому вибухову речовину після заповнення порожнини ізолюють забивкою і ініціюють заряд свердловини, руйнуючи гірський масив блока.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що після розміщення першого комплекту шашок-бойовиків у свердловині на розрахунковій відстані розміщують ближче до устя свердловини другий комплект шашок-бойовиків, довжина якого відповідає розрахунковій довжині концентрованого заряду, після цього послідовно ініціюють другий комплект шашок-бойовиків, а за ним - перший комплект шашок-бойовиків і руйнують за допомогою виконаного вибуху приконтантні до шашок гірські породи, при цьому зруйновану гірську масу під дією сил гравітації переміщують по свердловині на підшву виробки, створюючи порожнину розрахункового об'єму, у якій розміщують засоби ініціювання і вибухову речовину, при цьому вибухову речовину після заповнення порожнини ізолюють забивкою.

Розділ G:

Фізика

G 01

- (11) 123776 (51) МПК (2021.01)
G01D 21/00
H02M 7/00
G01R 27/26 (2006.01)

(21) а 2018 07328 (22) 02.07.2018

(24) 03.06.2021

(72) Кондратов Владислав Тимофійович (UA)

(73) КОНДРАТОВ ВЛАДИСЛАВ ТИМОФІЙОВИЧ

вул. Підлісна, 6, кв. 103, м. Київ-164, 03164 (UA)

(54) СПОСІБ ПЕРЕДАЧІ ЕНЕРГІЇ ПОСТІЙНОГО ЧИ/ТА ЗМІННОГО СТРУМУ ПО ОДНОПРОВІДНІЙ ЛІНІЇ ЕЛЕКТРОПЕРЕДАЧ ТА ПРИСТРІЙ ДЛЯ ЙОГО ЗДІЙСНЕННЯ

(57) 1. Спосіб передачі енергії постійного чи/та змінного струму по однопровідній лінії електропередач для його здійснення, який **відрізняється** тим, що послідовно з'єднують між собою першу шину "земля", перший плоский високочастотний коливальний контур, однопровідну лінію електропередач, другий плоский високочастотний коливальний контур і другу шину "земля", яку з'єднують з першою шиною "земля" через земляний електропровідний прошарок, розташований між зазначеними шинами по коротшому шляху, і ти самим створюють механічну систему замкненого типу, екранують від дії зовнішніх магнітних полів перший та другий плоскі високочастотні коливальні контури і першу та другу двоконтурні високочастотні котушки індуктивності, у непарні та парні півперіоди низької частоти комутації, формують високочастотні, стабільні за частотою і амплітудою, прямокутні імпульси струму типу "меандр" за допомогою двотактного кварцованого генератора пачок імпульсів високої частоти, на первинну обмотку першої двоконтурної високочастотної котушки індуктивності подають струм від джерела електричної енергії, що підлягає передачі, причому струм подають зустрічно струму через вторинну обмотку першої двоконтурної високочастотної котушки індуктивності, яка слугує навантаженням двотактного кварцованого генератора пачок імпульсів високої частоти, здійснюють амплітудну модуляцію струму прямокутної форми і високої частоти, який тече крізь вторинну обмотку першої двоконтурної високочастотної котушки індуктивності, синхронізують процес передавання та приймання електричної енергії, для цього по радіоканалу передають на приймальну сторону парафазний сигнал, який також формують двотактним кварцованим генератором, підсилюють отриманий парафазний сигнал і тим самим відтворюють форму парафазного сигналу до прямокутної, типу "меандр", живлять підсиленням парафазним сигналом первинну обмотку другої двоконтурної високочастотної котушки індуктивності, яку розташовують перпендикулярно площі поверхні другого плоского високочастотного коливального контуру, на площину поверхні

першого та другого плоских високочастотних коливальних контурів періодично, з низькою частотою комутації, діють соленоїдальним імпульсним магнітним полем високої частоти у непарні та парні півперіоди сигналу частоти комутації, відповідно, всередині плоских високочастотних коливальних контурів формують вихрове електричне поле, яке, в свою чергу, створює відповідне магнітне поле, одночасно формують електромагнітну хвилю високої частоти, на приймальному кінці здійснюють перетворення індукції електромагнітного поля зазначеної електромагнітної хвилі високої частоти у електрорушійну силу, за допомогою вторинної обмотки другої високочастотної двоконтурної котушки індуктивності перетворюють наведену електрорушійну силу у струм або напругу на RC-навантаженні, при необхідності змінний струм випрямляють та вимірюють електричні параметри, за якими судять про потужність переданої енергії постійного чи/та змінного струму.

2. Пристрій для здійснення способу передачі енергії постійного чи/та змінного струму за п. 1, що включає в себе: однопровідну лінію електропередач; джерело струму, що підлягає передачі; першу та другу двоконтурні високочастотні котушки індуктивності, перший коливальний контур першої двоконтурної високочастотної котушки індуктивності підключений до виходу джерела струму, який підлягає передачі; перше та друге джерела постійного струму, перші виходи яких з'єднані, відповідно, з першим і другим внутрішніми заземленнями, до яких підключені й перші виводи першого і другого конденсаторів, другі виводи яких з'єднані з другими виходами першого та другого джерел постійного струму відповідно; RC-навантаження, що являє собою паралельно з'єднані між собою резистор та конденсатор, які підключені паралельно другому коливальному контуру другої двоконтурної високочастотної котушки індуктивності, який **відрізняється** тим, що в нього додатково введені передавач радіоімпульсів, приймач, підсилювач потужності, двотактний кварцований генератор пачок імпульсів високої частоти, перша та друга шини "земля", перший та другий плоскі високочастотні коливальні контури, що індуктивно з'єднані з другим і першим коливальними контурами відповідно першої та другої двоконтурних високочастотних котушок індуктивності; другий коливальний контур першої двоконтурної високочастотної котушки індуктивності підключений одним кінцем до другого виходу першого джерела постійного струму і другим кінцем - до першого виходу двотактного кварцованого генератора пачок імпульсів високої частоти, другий вихід якого з'єднаний з входом передавача радіоімпульсів, чий вихід через передавальну і приймальну антени підключений до входу приймача, вхід живлення якого з'єднаний з третім виходом другого джерела постійного струму, вихід підключений до входу підсилювача потужності, вхід живлення якого через перший коливальний контур другої двоконтурної високочастотної котушки індуктивності з'єднаний з другим виходом другого джерела постійного струму, при цьому вихід першого плоского високочастотного коливального контуру через однопровідну лінію електропередачі підключений до входу другого плоского високочастотного коливального конту-

ру, чий вихід і вхід першого плоского високочастотного коливального контуру з'єднані, відповідно, з другою і першою шинами "земля".

3. Пристрій за п. 2, який **відрізняється** тим, що як перша та друга шини "земля" використовують ідентичні за параметрами і виготовлені з того ж металу, що й однопровідна лінія електропередачі, пару стрижнів або пару шарів, або пару плоских однозаходних спіральних котушок індуктивності, або пару плоских двозаходних спіральних котушок індуктивності.

щень (люфт) в рульовому керуванні першого колеса, приймають цей розмах за другий результат: $(R2=M1+M3)$; такі ж дії проводять з другим колесом і отримують третій результат: $(R3=M2+M3)$, після чого в результаті рішення отриманої системи трьох рівнянь з трьома невідомими

$$M1=(R2-R3+R1)/2,$$

$$M2=(R1-R2-R3)/2,$$

$$M3=(R3-R1-R2)/2,$$

отримують сукупність параметрів відгуку - розмах переміщень вільного ходу (люфт) в послідовних ланках рульового приводу ($M1$, $M2$) і в рульовому механізмі ($M3$), за якими здійснюється локалізація в них несправностей.

(11) 123801

(51) МПК

G01M 17/06 (2006.01)

G01B 5/24 (2006.01)

(21) а 2019 04629

(22) 02.05.2019

(24) 03.06.2021

(72) Дитятєв Олександр Васильович (UA), Волков Володимир Петрович (UA)

(73) ХАРКІВСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ АВТОМОБІЛЬНО-ДОРОЖНИЙ УНІВЕРСИТЕТ

вул. Ярослава Мудрого, 25, м. Харків, 61002 (UA)

ДИТЯТЄВ ОЛЕКСАНДР ВАСИЛЬОВИЧ

просп. Науки, 28, кв. 25, м. Харків, 61166 (UA)

ВОЛКОВ ВОЛОДИМИР ПЕТРОВИЧ

пр. Московський, 198, кв. 25, м. Харків, 61082 (UA)

(54) СПОСІБ ДІАГНОСТУВАННЯ РУЛЬОВОГО КЕРУВАННЯ АВТОМОБІЛЯ

(57) Спосіб діагностування рульового керування автомобіля за величиною вільного ходу (люфту), відповідно до якого діагностику здійснюють по частинах, для чого ізолюють частину кінематичної схеми рульового керування, в тій частині, що залишилася і діагностується, прикладають тестові сигнали у вигляді силових впливів на деталі рульового керування і по сукупності параметрів відгуку, отриманих для різних діагностованих частин, в результаті порівняння параметрів відгуку з контрольними значеннями, формують діагноз, який **відрізняється** тим, що локалізацію несправностей здійснюють окремо в рульовому приводі і окремо в рульовому механізмі, для чого в кінематичній схемі рульового управління і, відповідно, в структурі люфтів визначають дві частини - паралельну, що складається з двох ланок послідовних сполучень (люфтів): перше - $M1$ - сумарний люфт сполучень від поворотного важеля першого керованого колеса до рульової рейки; друге - $M2$ - сумарний люфт сполучень від рульової рейки до поворотного важеля другого керованого колеса; і послідовну $M3$, що складається з суми люфтів послідовних сполучень від рульової рейки рульової передачі до рульового колеса, причому при локалізації несправності в рульовому приводі (сумарний люфт $M1+M2$) керовані колеса вивішують або ставлять їх на поворотні майданчики, тестові сигнали прикладають до керованих коліс як періодичне зустрічне зусилля і визначають перший результат: $(R1=M1+M2)$ - розмах переміщень вільного ходу (люфту) між однойменними гранями лівого і правого коліс; далі рульове колесо блокують відносно кузова автомобіля, до першого керованого колеса прикладають повторно-змінні силові впливи, вимірюють розмах переми-

(11) 123787

(51) МПК (2021.01)

G01N 27/00

G01N 22/00

G01N 33/00

(21) а 2018 10986

(22) 07.11.2018

(24) 03.06.2021

(72) Кондратов Владислав Тимофійович (UA)

(73) КОНДРАТОВ ВЛАДИСЛАВ ТИМОФІЙОВИЧ

вул. Підлісна, 6, кв. 103, м. Київ-164, 03164 (UA)

(54) ПРИСТРІЙ ДЛЯ ФУНДАМЕНТАЛЬНИХ ДОСЛІДЖЕНЬ ЯВИЩА ПЕРЕНОСУ ЕНЕРГІЇ ТА ІНФОРМАЦІЇ КРИЗЬ МАТЕРІАЛ

(57) Пристрій для фундаментальних досліджень явища переносу енергії та інформації крізь матеріал, що містить кероване джерело струму, джерело дискретних за значенням напруг, генератор пачок імпульсів високої частоти, цифровий вимірювач струму, цифровий вольтметр, двоканальний цифровий осцилограф з пам'яттю, RC-навантаження, перший та другий діоди, двоконтурний хвилевод, перший та другий магнітні екрани, першу і другу котушки індуктивності першої та другої пар високочастотних коливальних контурів, що розміщені, як й перший і другий контури хвилеводу, у першому та другому магнітних екранах відповідно, нижні виводи перших котушок індуктивності першої та другої пари коливальних контурів, клема "земля" двоканального цифрового осцилографа з пам'яттю, другі виводи цифрового вольтметра та RC-навантаження з'єднані з земляною шиною, верхні виводи других котушок індуктивності підключені до виходу керованого джерела струму, який **відрізняється** тим, що у пристрій додатково введені перша та друга лампочки розжарювання, конденсатор постійної ємності і конденсатор змінної ємності, чотири перемикачі з ручним управлінням і два високочастотні ключі, виходи останніх двох, як й клема "земля" джерела дискретних за значенням напруг, підключені до земляної шини, входи з'єднані з другими виводами других котушок індуктивності першої та другої пар високочастотних коливальних контурів, входи управління підключені до прямого і інверсного виходів генератора пачок імпульсів високої частоти, перші входи першого і другого перемикачів з ручним управлінням з'єднані між собою через послідовно включені цифровий вимірювач струму, першу лампочку розжарювання і перший діод, виходи підключені, відповідно, до першого

виводу котушки індуктивності першої пари високочастотних контурів та до проміжного виводу першої котушки індуктивності другої пари коливальних контурів, другі входи першого та другого перемикачів з ручним управлінням з'єднані, відповідно, з виходом третього перемикача з ручним управлінням та з виходом другого діода, вихід якого підключений до RC-навантаження, з яким з'єднаний й вхід четвертого перемикача з ручним управлінням, перший та другий входи якого підключені, відповідно, до входу першого каналу двоканального цифрового осцилографа з пам'яттю, у якого вхід другого каналу використовується при необхідності, та до входу цифрового вольтметра, клема "земля" яких та другий вивід RC-навантаження з'єднані з земляною шиною, вхід "зовнішня синхронізація" двоканального цифрового осцилографа з пам'яттю підключений до виходу синхроімпульсів низької частоти генератора пачок високочастотних імпульсів, при цьому верхній вивід першої котушки індуктивності другої пари коливальних контурів з'єднаний з антеною, перший вихід третього перемикача з ручним управлінням підключений до вхідної клеми пристрою, а другий - до виходу джерела дискретних за значенням напруг, друга лампочка розжарювання та паралельно з'єднані з нею обидва конденсатори включені в розріз елемента зв'язки між першим та другим контурами двоконтурного хвилеводу.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що паразитологічне дослідження суміші фекалій виконують методом нативного мазка в розчині Люголя або методом постійних препаратів, фарбованих за Циль-Нільсеном, або методом збагачення флотацією, або методом симентації центрифугуванням.

- (11) **123805** (51) МПК (2021.01)
G01N 33/487 (2006.01)
A61B 5/00
- (21) а 2019 05183 (22) 16.05.2019
(24) 03.06.2021
- (72) Шагінян Валерія Робертівна (UA), Данько Олег Павлович (UA), Сопіль Ганна Володимирівна (UA), Дяченко Ольга Панасівна (UA)
- (73) **ДЕРЖАВНА УСТАНОВА "ІНСТИТУТ ЕПІДЕМІОЛОГІЇ ТА ІНФЕКЦІЙНИХ ХВОРОБ ІМ. Л.В. ГРОМАШЕВСЬКОГО НАЦІОНАЛЬНОЇ АКАДЕМІЇ МЕДИЧНИХ НАУК УКРАЇНИ"**
вул. М. Амосова, 5, м. Київ, 03680 (UA)
- (54) **СПОСІБ ПАРАЗИТОЛОГІЧНОГО ДОСЛІДЖЕННЯ**
- (57) 1. Спосіб паразитологічного дослідження, який включає забір фекалій пацієнтом у ємність та передачу фекалій у лабораторію, який **відрізняється** тим, що у ємність з кришкою, об'ємом не менше 15 мл, наливають консервант, ємність передають пацієнту, який далі, протягом 3-10 днів, збирає фекалії з 3-5 різних місць верхнього шару фекалій, у кількості 1-1,5 г, в одну і ту ж ємність, досягаючи загальної кількості матеріалу 3-5 г, а консервант застосовують у кількості, що забезпечує покриття поверхні фекалій, але не менше співвідношення консерванту та фекалій 2:1 та, після завершення терміну збирання, передає зібрану ним суміш фекалій у лабораторію, після чого ємність із сумішшю фекалій щільно закривають та збовтують, зберігають суміш при температурі в межах від +15 до +25 °C, далі суміш досліджують на наявність кишкових гельмінтів та найпростіших під малим (ок.х10, об.х10) і середнім (ок.х10, об.х40) збільшенням світлового мікроскопа.

- (11) **123808** (51) МПК
G01N 33/493 (2006.01)
- (21) а 2019 07324 (22) 02.07.2019
(24) 03.06.2021
- (72) Нікуліна Галина Григорівна (UA), Петербургський Володимир Федорович (UA), Мигаль Людмила Якимівна (UA), Сербіна Ірина Євгенівна (UA), Каліщук Олесь Аркадійович (UA)
- (73) **ДЕРЖАВНА УСТАНОВА "ІНСТИТУТ УРОЛОГІЇ НАМН УКРАЇНИ"**
вул. В. Винниченка, 9-а, м. Київ, 04053 (UA)
- (54) **СПОСІБ ПРОГНОЗУВАННЯ ЕФЕКТИВНОСТІ РЕКОНСТРУКТИВНОГО ЛІКУВАННЯ ДІТЕЙ З ВРОДЖЕНИМ МІХУРОВО-СЕЧОВІДНИМ РЕФЛЮКСОМ**
- (57) Спосіб прогнозування ефективності реконструктивного лікування дітей з вродженим міхурово-сечовідним рефлюксом, що включає визначення активності канальцевого лізосомного ферменту N-ацетил-β-D-глюкозамінідази у сечі дітей після фізіологічного сечовипускання, який **відрізняється** тим, що додатково визначають активність канальцевого лізосомного термостабільного ізоферменту N-ацетил-β-D-глюкозамінідази В у сечі дітей з вродженим міхурово-сечовідним рефлюксом до початку та через 6 місяців після реконструктивного лікування, і якщо вихідні рівні активності обох ферментів реєструють у межах показників контрольної групи, прогнозують позитивну ефективність реконструктивного лікування через 6 місяців після втручання, якщо вихідні рівні активності N-ацетил-β-D-глюкозамінідази реєструють у межах показників контрольної групи, а рівні активності ізоферменту N-ацетил-β-D-глюкозамінідази В реєструють суттєво вищими за верхню межу контролю, прогнозують часткову ефективність реконструктивного лікування через 6 місяців після втручання, а якщо вихідні рівні активності обох ферментів реєструють значно вищими показників контрольної групи, прогнозують неефективність реконструктивного лікування через 6 місяців після втручання.

- (11) **123795** (51) МПК
G01S 13/58 (2006.01)
G01S 7/41 (2006.01)
- (21) а 2019 00960 (22) 30.01.2019
(24) 03.06.2021
- (72) Бударецький Юрій Іванович (UA), Зубков Анатолій Миколайович (UA), Бахмат Максим Вікторович (UA)
- (73) **НАЦІОНАЛЬНА АКАДЕМІЯ СУХОПУТНИХ ВІЙСЬК ІМЕНІ ГЕТЬМАНА ПЕТРА САГАЙДАЧНОГО**
вул. Героїв Майдану, 32, м. Львів-12, 79029 (UA)

(54) СПОСІБ РАДІОЛОКАЦІЙНОГО ВИМІРЮВАННЯ ШВИДКОСТІ РУХУ ТА ПРОЙДЕНОГО ШЛЯХУ І ПРИСТРІЙ ДЛЯ ЙОГО РЕАЛІЗАЦІЇ

- (57)** 1. Спосіб радіолокаційного вимірювання швидкості руху та пройденого шляху, що полягає у формуванні імпульсного сигналу доплерівської частоти та підрахунку кількості імпульсів, що відповідає кількості періодів доплерівської частоти, який **відрізняється** тим, що фіксують значення дискретності вимірювання шляху, за допомогою лічильника перераховують поточне значення кількості імпульсів, що відповідає кількості періодів доплерівської частоти, перемножують його на зазначене значення дискретності вимірювання шляху, визначають відрізок шляху, на якому відбувається усереднення, та вимірюють відповідний час заповнення лічильника, на основі чого визначають усереднене значення радіальної швидкості.
2. Пристрій, що реалізує спосіб радіолокаційного вимірювання швидкості руху та пройденого шляху, який містить послідовно з'єднані формувач імпульсного сигналу, перший лічильник, тригер, схему "I", другий лічильник, схему знімання, вихід якої є виходом пристрою, вхід формувача сигналу є входом пристрою, а також генератор лічильних імпульсів, вихід якого під'єднаний до другого входу схеми "I", схему встановлення, вихід якої підключений до другого входу першого лічильника, при цьому вихід формувача імпульсного сигналу з'єднаний з другим входом тригера, вихід першого лічильника з'єднаний зі входом схеми встановлення та другим входом схеми знімання, який **відрізняється** тим, що додатково введені послідовно з'єднані третій лічильник і друга схема знімання, вихід якої є другим виходом пристрою, при цьому вихід формувача імпульсного сигналу з'єднаний зі входом третього лічильника.

G 06

(11) 123792 (51) МПК (2021.01)
G06K 9/00
G06F 3/02 (2006.01)

(21) а 2018 12161 (22) 16.05.2017

(24) 03.06.2021

(31) 16173961.0

(32) 10.06.2016

(33) EP

(86) PCT/EP2017/061684, 16.05.2017

(72) Деку Ерік (CH)

(73) СІКПА ХОЛДІНГ СА

Avenue de Florissant 41, 1008 Prilly, Switzerland (CH)

(54) СПОСІБ, ПРИСТРІЙ ДЛЯ ФОРМУВАННЯ ЗОБРАЖЕННЯ ТА СИСТЕМА ДЛЯ ГЕНЕРУВАННЯ ПОКАЗНИКА СПРАВЖНОСТІ ОБ'ЄКТА

- (57)** 1. Спосіб, який здійснюється за допомогою пристрою (10) для формування зображення, для генерування показника справжності об'єкта (20) або для сприяння генеруванню показника справжності об'єкта (20), який **відрізняється** тим, що об'єкт (20) містить поверхню (30), яка щонайменше частково містить шар або покрита основним шаром (40);

при цьому основний шар (40) має щонайменше одну з наступних оптичних властивостей: відбивну здатність, спектр відбиття, відбиття та емісію, яка має просторову мінливість уздовж поверхні, покритої основним шаром (40);

або об'єкт з поверхнею (30) має текстуру та/або основний шар (40) має текстуру;

маркування (50) надруковане на області поверхні (30), покритої основним шаром (40), таким чином, що одна з вищезгаданих оптичних властивостей основного шару (40) є виявлюваною пристроєм (10) для формування зображення через щонайменше частину маркування (50); та

маркування (50) являє собою машинозчитуваний код, при цьому код включає щонайменше один з лінійного штрих-коду та двомірного штрих-коду;

при цьому спосіб включає:

формування зображення (s100) маркування (50);

зчитування (s200) коду, представленого сформованим зображенням маркування;

генерування (s300) підпису на основі однієї з вищезгаданих оптичних властивостей основного шару (40), виявлюваної пристроєм (10) для формування зображення через щонайменше частину сформованого зображення маркування, при цьому генерування (s300) підпису включає вимірювання просторових змін в одній з вищезгаданих оптичних властивостей основного шару (40), виявлюваної пристроєм (10) для формування зображення через щонайменше частину сформованого зображення маркування;

передачу (s400) на пристрій для обробки зчитаного коду та згенерованого підпису для забезпечення генерування показника справжності об'єкта (20); та генерування (s500) показника справжності об'єкта (20) на основі зчитаного коду та згенерованого підпису.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що код являє собою двомірний штрих-код.

3. Спосіб за п. 1 або п. 2, який **відрізняється** тим, що спосіб включає передачу (s400) за допомогою пристрою (10) для формування зображення на пристрій для обробки зчитаного коду та згенерованого підпису; та

спосіб додатково здійснюють за допомогою пристрою для обробки, та він додатково включає:

вилучення (s600) у блоці зберігання даних за допомогою пристрою для обробки підпису, який зберігається у зв'язку зі зчитаним кодом;

порівняння (s700) за допомогою пристрою для обробки згенерованого підпису зі збереженим підписом; та генерування (s800) показника справжності об'єкта (20) на основі щонайменше результату порівняння між згенерованим підписом та збереженим підписом.

4. Пристрій (10) для формування зображення, призначений для генерування показника справжності об'єкта (20) або для сприяння генеруванню показника справжності об'єкта (20), який **відрізняється** тим, що об'єкт (20) містить поверхню (30), яка щонайменше частково містить шар або покрита основним шаром (40);

при цьому основний шар (40) має щонайменше одну з наступних оптичних властивостей: відбивну здатність, спектр відбиття, відбиття та емісію, яка має просторову мінливість уздовж поверхні, покритої основним шаром (40);

або об'єкт з поверхнею (30) має текстуру, та/або основний шар (40) має текстуру;

маркування (50) надруковане на області поверхні (30), покритої основним шаром (40), таким чином, що одна з вищезгаданих оптичних властивостей основного шару (40) є виявлюваною пристроєм (10) для формування зображення через щонайменше частину маркування (50); та

маркування (50) являє собою машинозчитуваний код, при цьому код включає щонайменше один з лінійного штрих-коду та двовимірного штрих-коду; при цьому пристрій (10) для формування зображення виконаний з можливістю:

формування зображення маркування (50);

зчитування коду, представленого сформованим зображенням маркування;

генерування підпису на основі однієї з вищезгаданих оптичних властивостей основного шару (40), виявлюваної пристроєм (10) для формування зображення через щонайменше частину сформованого зображення маркування, при цьому генерування (s300) підпису включає вимірювання просторових змін в одній з вищезгаданих оптичних властивостей основного шару (40), виявлюваної пристроєм (10) для формування зображення через щонайменше частину сформованого зображення маркування;

передачі на пристрій для обробки зчитаного коду та згенерованого підпису для забезпечення генерування показника справжності об'єкта (20); та

генерування показника справжності об'єкта (20) на основі зчитаного коду та згенерованого підпису.

5. Пристрій (10) для формування зображення за п. 4, який **відрізняється** тим, що пристрій (10) для формування зображення являє собою портативний пристрій.

6. Пристрій (10) для формування зображення за п. 5, який **відрізняється** тим, що пристрій (10) для формування зображення являє собою стільниковий телефон.

7. Система, яка містить пристрій (10) для формування зображення за будь-яким з пп. 4-6 та пристрій для обробки, яка **відрізняється** тим, що пристрій (10) для формування зображення виконаний з можливістю передачі на пристрій для обробки зчитаного коду та згенерованого підпису; та пристрій для обробки виконаний з можливістю:

вилучення у блоці зберігання даних підпису, який зберігається у зв'язку зі зчитаним кодом;

порівняння згенерованого підпису зі збереженим підписом; та

генерування показника справжності об'єкта (20) на основі результату порівняння між згенерованим підписом та збереженим підписом.

(11) 123762

(51) МПК
G06Q 10/04 (2012.01)
G06Q 50/02 (2012.01)
G06Q 10/06 (2012.01)

(21) а 2017 03547

(22) 10.09.2015

(24) 03.06.2021

(31) 62/049,898

(32) 12.09.2014

(33) US

(31) 14/846,422

(32) 04.09.2015

(33) US

(86) PCT/US2015/049486, 10.09.2015

(72) Есінгтон Джеймс (US), Поллак Елі (US), Д'Оргевал Трістан (US), Крумме Коко (US), Левей Евін (US), Вімбуш Алекс (US), Андрейко Ерік (US), Брега Муреа (US), Алдор-Нойман Сіван (US)

(73) ЗЕ КЛАЙМЕТ КОРПОРЕЙШН

201 3rd Street, #1100, San Francisco, California 94103, United States of America (US)

(54) СИСТЕМИ ТА СПОСОБИ ДЛЯ УПРАВЛІННЯ СІЛЬСЬКОГОСПОДАРСЬКОЮ ДІЯЛЬНІСТЮ

(57) 1. Спосіб, який реалізується комп'ютером для отримання даних з рекомендаціями щодо сільськогосподарської діяльності, який реалізовано з використанням сільськогосподарської інтелектуальної обчислювальної системи, що обмінюється даними із пам'яттю, спосіб включає етапи, у яких: отримують множину даних з описом поля; виймають множину вхідних даних у формі потоку даних із множини обчислювальних мереж; вилучають множину вхідних даних з потоку даних та перетворюють вилучену множину вхідних даних у структурований набір даних; визначають ділянку поля на основі даних з описом поля; ідентифікують підмножину набору даних із цієї множини даних, пов'язаних із ділянкою поля; визначають множину даних про польові умови на основі підмножини набору даних із множини вхідних даних та надають множину даних про польові умови на пристрій користувача; отримують запит від пристрою користувача на введення даних, що враховують особливості поля, коли пристрій користувача фізично знаходиться на ділянці поля та, у відповідь, автоматично відображають та передають дані з описом поля, що пов'язані з даними, які стосуються ділянки поля, до пристрою користувача; отримують дані, що враховують особливості поля, від пристрою користувача та пов'язують дані, що враховують особливості поля, з ділянкою поля; причому визначення множини даних про польові умови включає етапи, у яких: ідентифікують сітку, що пов'язана з ділянкою поля; ідентифікують множину погодних станцій, пов'язану з сіткою, при цьому кожна з множини погодних станцій пов'язана з місцезнаходженням погодної станції; ідентифікують пов'язану вагу для кожної з множини погодних станцій на основі місцезнаходження кожної пов'язаної погодної станції; отримують температуру, що зчитується від кожної з множини погодних станцій, та ідентифікують значення температури для ділянки поля на основі множини температур, що зчитуються, та кожної пов'язаної ваги.

2. Спосіб за п. 1, який додатково включає етапи, у яких: визначають період аналізу опадів; вилучають набір останніх даних про опади, набір прогнозованих даних про опади та дані про температуру, що пов'язані з періодом аналізу опадів із підмножини набору даних із множини вхідних даних; визначають індекс придатності для обробки на основі набору останніх даних про опади, набору прогнозованих даних про опади та набору даних про температуру; надають значення придатності для обробки на пристрій користувача на основі індексу придатності для обробки.

3. Спосіб за п. 2, який додатково включає етапи, у яких: отримують прогнозовану сільськогосподарську діяльність та визначають індекс придатності для

обробки на основі множини прогнозованих видів сільськогосподарської діяльності.

4. Спосіб за п. 1, який додатково включає етапи, у яких: визначають початковий рівень вологості посівів; отримують множини щоденних максимальних та мінімальних показників температури; отримують множини даних про використання води для посівів та визначають рівень вологості ґрунту.

5. Спосіб за п. 1, який додатково включає етапи, у яких: отримують множини бажаних попереджень від пристрою користувача; ідентифікують множини порогових значень попереджень, пов'язаних з множиною бажаних попереджень; контролюють підмножину набору даних з множини вхідних даних та надають попередження на пристрій користувача, коли досягнуто щонайменше одне з порогових значень для попереджень.

6. Спосіб за п. 1, який додатково містить отримання множини даних з описом поля від щонайменше одного з пристроїв користувача та пристрою сільськогосподарської машини.

7. Мережева система отримання даних з рекомендаціями щодо сільськогосподарської діяльності згідно зі способом за п. 1, яка містить: множини обчислювальних систем обчислювальних мереж; сільськогосподарську інтелектуальну обчислювальну систему, яка містить процесор та пам'ять, що обмінюються даними з вищезгаданим процесором, при цьому вищезгаданий процесор виконаний із можливістю: отримання множини даних з описом поля від пристрою користувача; вилучення множини вхідних даних у формі потоку даних від вищезгаданої множини обчислювальних мереж; вилучення множини вхідних даних з потоку даних та перетворення вилученої множини вхідних даних у структурований набір даних; визначення ділянки поля на основі даних з описом поля; ідентифікацію підмножини набору даних з множини вхідних даних, пов'язаних з ділянкою поля; визначення множини даних про польові умови на основі підмножини набору даних з множини вхідних даних; надання множини даних про польові умови на пристрої користувача; отримання запиту від пристрою користувача на введення даних, що враховують особливості поля, коли пристрій користувача фізично знаходиться на ділянці поля та, у відповідь, автоматичне відображення та передача даних з описом поля, що пов'язані з даними, які стосуються ділянки поля, до пристрою користувача; отримання даних, що враховують особливості поля, від пристрою користувача та асоціація даних, що враховують особливості поля, з ділянкою поля; при цьому для визначення множини даних про польові умови, вищезгаданий процесор додатково виконаний із можливістю: ідентифікувати сітку, що пов'язана з ділянкою поля; ідентифікувати множини погодних станцій, пов'язану з сіткою, причому кожна з множини погодних станцій пов'язана з місцезнаходженням погодної станції; ідентифікувати пов'язану вагу для кожної з множини погодних станцій, на основі місцезнаходження кожної пов'язаної погодної станції; отримувати температуру, що зчитується від кожної з множини погодних станцій; ідентифікувати значення температури для ділянки поля на основі множини температури, що зчитуються, та кожної пов'язаної ваги.

8. Мережева система за п. 7, яка **відрізняється** тим, що процесор додатково виконаний із можливістю: встановлювати період аналізу опадів; вилучати набір останніх даних про опади, набір прогнозованих даних про опади та даних про температуру, що пов'язані з періодом аналізу опадів із підмножини набору даних із множини вхідних даних; визначати індекс придатності для обробки на основі набору останніх даних про опади, набір прогнозованих даних про опади та набір даних про температуру; надавати значення придатності для обробки на пристрій користувача на основі індексу придатності для обробки.

9. Мережева система за п. 8, яка **відрізняється** тим, що процесор додатково виконаний із можливістю отримувати прогнозований вид сільськогосподарської діяльності та визначати індекс придатності для обробки на основі множини прогнозованих видів сільськогосподарської діяльності.

10. Мережева система за п. 7, яка **відрізняється** тим, що процесор додатково виконаний із можливістю: визначати початковий рівень вологості посівів; отримувати множини щоденних максимальних та мінімальних температур; отримувати множини даних про використання води для посівів та визначати рівень вологості ґрунту.

11. Мережева система за п. 7, яка **відрізняється** тим, що процесор додатково виконаний із можливістю: отримувати множини бажаних повідомлень від пристрою користувача; ідентифікувати множини порогових значень для повідомлень, пов'язаних з множиною бажаних повідомлень; контролювати підмножину набору даних з множини вхідних даних та надавати попередження на пристрої користувача, коли досягнуто щонайменше одне з порогових значень для попереджень.

12. Мережева система за п. 7, яка **відрізняється** тим, що процесор додатково виконаний із можливістю отримувати множини даних з описом поля від щонайменше одного з пристроїв користувача та пристрою сільськогосподарської машини.

13. Машинозчитуваний носій даних для керування мережевою системою за п. 7, що містить реалізовані на ньому інструкції, які виконуються комп'ютером, при цьому, коли інструкції виконуються щонайменше одним процесором, то інструкції, які виконуються на комп'ютері, спонукають процесор до: отримання множини даних з описом поля від пристрою користувача; виїмання множини вхідних даних у формі потоку даних із множини обчислювальних мереж; вилучення множини вхідних даних з потоку даних та перетворення вилученої множини вхідних даних у структурований набір даних; визначення ділянки поля на основі даних з описом поля; ідентифікації підмножини набору даних із цієї множини даних, пов'язаних із ділянкою поля; визначення множини даних про польові умови на основі підмножини набору даних із множини вхідних даних; надання множини даних про польові умови на пристрій користувача; отримання запиту від пристрою користувача на введення даних, що враховують особливості поля, коли пристрій користувача фізично знаходиться на ділянці поля, та, у відповідь, автоматичне відображення та передача даних з описом поля, що пов'язані з даними, які стосуються ділянки поля, до пристрою

користувача; отримання даних, що враховують особливості поля, від пристрою користувача та асоціація даних, що враховують особливості поля, з ділянкою поля; при цьому для визначення множини даних про польові умови, вищезгаданий процесор додатково виконаний із можливістю: ідентифікувати сітку, що пов'язана з ділянкою поля; ідентифікувати множину погодних станцій, пов'язану з сіткою, причому кожна з множини погодних станцій пов'язана з місцезнаходженням погодної станції; ідентифікувати пов'язану вагу для кожної з множини погодних станцій на основі місцезнаходження кожної пов'язаної погодної станції; отримувати температуру, що зчитується від кожної з множини погодних станцій та ідентифікувати значення температури для ділянки поля на основі множини температур, що зчитуються, та кожної пов'язаної ваги.

14. Машинозчитуваний носій даних за п. 13, який **відрізняється** тим, що інструкції, які виконуються комп'ютером, спонукають процесор до: встановлення періоду аналізу опадів; вилучення набору останніх даних про опади, набору прогнозованих даних про опади та даних про температуру, що пов'язані з періодом аналізу опадів із підмножини набору даних із множини вхідних даних; визначення індексу придатності для обробки на основі набору останніх даних про опади, набору прогнозованих даних про опади, та набору даних про температуру та надання значення придатності для обробки на пристрій користувача на основі індексу придатності для обробки.

15. Машинозчитуваний носій даних за п. 14, який **відрізняється** тим, що інструкції, які виконуються комп'ютером, спонукають процесор до отримання прогнозованого виду сільськогосподарської діяльності та визначення індексу придатності для обробки на основі множини прогнозованих видів сільськогосподарської діяльності.

16. Машинозчитуваний носій даних відповідно до п. 13, який **відрізняється** тим, що інструкції, які виконуються комп'ютером, спонукають процесор до: визначення початкового рівня вологості посівів; отримання множини щоденних максимальних та мінімальних показників температури; отримання множини даних про використання води для посівів та визначення рівня вологості ґрунту.

17. Машинозчитуваний носій даних за п. 13, який **відрізняється** тим, що інструкції, що виконуються комп'ютером, спонукають процесор до: отримання множини бажаних попереджень від пристрою користувача; ідентифікації множини порогових значень для попереджень, пов'язаних з множиною бажаних попереджень; контролю підмножини набору даних з множини вхідних даних та надання попереджень на пристрої користувача, коли буде досягнуте щонайменше одне порогове значення для попереджень.

18. Машинозчитуваний носій даних за п. 13, який **відрізняється** тим, що інструкції, що виконуються комп'ютером, спонукають процесор до вилучення множини даних з описом поля від щонайменше одного з пристроїв користувача та пристрою сільськогосподарської машини.

19. Обчислювальна система, що входить до мережевої системи отримання даних з рекомендаціями щодо сільськогосподарської діяльності згідно зі способом за п. 1, яка містить процесор та пам'ять, що об-

мінюються даними з вищезгаданим процесором, при цьому вищезгаданий процесор виконаний з можливістю: отримання множини даних з описом поля від пристрою користувача; виймання множини вхідних даних у формі потоку даних із множини обчислювальних мереж; вилучення множини вхідних даних з потоку даних та перетворення вилученої множини вхідних даних у структурований набір даних; визначення ділянки поля на основі даних з описом поля; ідентифікації підмножини набору даних, із цієї множини даних, пов'язаних з ділянкою поля; визначення множини даних про польові умови на основі підмножини набору даних із множини вхідних даних; надання множини даних про польові умови на пристрій користувача; отримання запиту від пристрою користувача на введення даних, що враховують особливості поля, коли пристрій користувача фізично знаходиться на ділянці поля, та, у відповідь, автоматичне відображення та передача даних з описом поля, що пов'язані з даними, які стосуються ділянки поля, до пристрою користувача; отримання даних, що враховують особливості поля, від пристрою користувача та асоціація даних, що враховують особливості поля, з ділянкою поля; при цьому для визначення множини даних про польові умови, вищезгаданий процесор додатково виконаний із можливістю: ідентифікувати сітку, що пов'язана з ділянкою поля; ідентифікувати множину погодних станцій, пов'язану з сіткою, причому кожна з множини погодних станцій пов'язана з місцезнаходженням погодної станції; ідентифікувати пов'язану вагу для кожної з множини погодних станцій, на основі місцезнаходження кожної пов'язаної погодної станції; отримувати температуру, що зчитується від кожної з множини погодних станцій; ідентифікувати значення температури для ділянки поля на основі множини температур, що зчитуються, та кожної пов'язаної ваги.

(11) 123818

(51) МПК

G06Q 30/02 (2012.01)

H04W 28/02 (2009.01)

H04W 28/16 (2009.01)

H04W 28/20 (2009.01)

(21) а 2020 02059

(22) 31.08.2018

(24) 03.06.2021

(31) 2017130975

(32) 01.09.2017

(33) RU

(86) PCT/RU2018/000574, 31.08.2018

(72) Гілеб Светлана Івановна (RU)

(73) К'ЮАЙТІ СОЛЮШНЗ ЛТД

Office 301, Chrysanthou Mylona, 1, 3030, Limassol, Cyprus (CY)

(54) СИСТЕМА МОБІЛЬНОЇ РЕКЛАМИ

(57) 1. Система мобільної реклами, що складається із взаємодіючих принаймні одного центру комутації, принаймні одного білінгового центру, принаймні одного вузла підтримки білінгу, принаймні одного шлюзового вузла, принаймні одного вузла зберігання абонентських даних, принаймні одного мобільного пристрою, а також принаймні одного додаткового вузла керування послугами, яка **відрізняється** тим, що до-

датковий вузол керування послугами виконаний з можливістю блокування сторонньої реклами, виконання логіки розподілу рекламних оголошень SSP (Supply-Side Platform) та логіки розміщення рекламних повідомлень DSP (Demand Side Platform), виконання логіки обробки аудиторних даних DMP (Data Management Platform) і взаємодії її з базою даних абонентів оператора стільникового зв'язку, збереження (кешування) рекламного контенту й завантаження його у веб-оглядач користувача без виконання логіки звертання до декількох зовнішніх DSP (Demand Side Platform).

2. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що складається із взаємодіючих принаймні одного центру комутації, принаймні одного білінгового центру, принаймні одного вузла підтримки білінгу, принаймні одного шлюзового вузла, принаймні одного вузла зберігання абонентських даних, принаймні одного мобільного пристрою, а також принаймні одного додаткового вузла керування послугами, яка **відрізняється** тим, що додатковий вузол керування послугами виконаний з можливістю реалізації логіки інтеграції каналів комутації з абонентом OCP (Omni-Channel Platform) за вибором оптимального каналу доведення реклами, причому логіка вибору каналу доведення реклами абонентів виконується з урахуванням доступної смуги пропускання базової мережі стільникового зв'язку.

3. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що додатковий вузол керування послугами розташований всередині базової мережі стільникового зв'язку й підключений безпосередньо до шлюзового вузла.

4. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що додатковий вузол керування послугами розташований всередині базової мережі стільникового зв'язку й підключений безпосередньо до вузла підтримки білінгу базової мережі стільникового зв'язку.

5. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що додатковий вузол керування послугами виконаний у віртуальному виконанні.

6. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що додатковий вузол керування послугами виконаний з можливістю збереження (кешування) рекламного контенту.

7. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що точка присутності технічних засобів обробки даних, що виконують логіку розподілу рекламних оголошень SSP (Supply-Side Platform) і логіку розміщення рекламних повідомлень DSP (Demand Side Platform), розташована на одному устаткуванні всередині базової мережі стільникового зв'язку.

8. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що точка присутності технічних засобів обробки даних, які виконують логіку розподілу рекламних оголошень SSP (Supply-Side Platform) і логіку розміщення рекламних повідомлень DSP (Demand Side Platform), розташована зовні базової мережі стільникового зв'язку, відповідно до логіки мережної інфраструктури доставки контенту CDN (Content Delivery Network).

9. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що точка присутності технічних засобів обробки даних, що виконують логіку обробки аудиторних даних DMP (Data Management Platform) і взаємодії її з базою даних абонентів оператора стільникового зв'язку, розташована всередині базової мережі стільникового зв'язку.

10. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що точка присутності технічних засобів обробки даних, що виконують логіку обробки аудиторних даних DMP (Data Management Platform) і взаємодії її з базою даних абонентів оператора стільникового зв'язку, розташована зовні базової мережі стільникового зв'язку, відповідно до логіки мережної інфраструктури доставки контенту CDN (Content Delivery Network).

11. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що точка присутності технічних засобів обробки даних, що виконують логіку збереження (кешування) рекламного контенту, розташована всередині базової мережі стільникового зв'язку.

12. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що точка присутності технічних засобів збереження обробки даних, що виконують логіку збереження (кешування) рекламного контенту, розташована зовні базової мережі стільникового зв'язку, відповідно до логіки мережної інфраструктури доставки контенту CDN (Content Delivery Network).

13. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що точка присутності технічних засобів обробки даних, що виконують логіку завантаження веб-оглядачеві користувача рекламного контенту без виконання логіки звертання до декількох зовнішніх DSP (Demand Side Platform), розташована всередині базової мережі стільникового зв'язку.

14. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що точка присутності технічних засобів обробки даних, що виконують логіку завантаження веб-оглядачеві користувача рекламного контенту без виконання логіки звертання до декількох зовнішніх DSP (Demand Side Platform), розташована зовні базової мережі стільникового зв'язку, відповідно до логіки мережної інфраструктури доставки контенту CDN (Content Delivery Network).

15. Система мобільної реклами за п. 2, яка **відрізняється** тим, що точка присутності технічних засобів обробки даних, що реалізують логіку інтеграції каналів комутації з абонентом OCP (Omni-Channel Platform) по вибору оптимального каналу доведення реклами, розташована усередині базової мережі стільникового зв'язку.

16. Система мобільної реклами за п. 2, яка **відрізняється** тим, що точка присутності технічних засобів обробки даних, що реалізують логіку інтеграції каналів комутації з абонентом OCP (Omni-Channel Platform) по вибору оптимального каналу доведення реклами, розташована зовні базової мережі стільникового зв'язку відповідно до логіки мережної інфраструктури доставки контенту CDN (Content Delivery Network).

17. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що рекламні повідомлення виконані у візуальній формі.

18. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що рекламні повідомлення виконані в аудіовізуальній формі.

19. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що рекламні повідомлення виконані в текстовій формі.

20. Система мобільної реклами за п. 1, яка **відрізняється** тим, що рекламні повідомлення виконані в комбінованій формі.

Розділ Н:

Електрика

Н 02

- (11) **123796** (51) МПК (2021.01)
H02J 13/00
G08C 19/00
- (21) а 2019 01078 (22) 04.02.2019
(24) 03.06.2021
- (72) Загірняк Михайло Васильович (UA), Дзюбан Віталій Серафимович (UA), Артьомов Павло Володимирович (UA)
- (73) **КРЕМЕНЧУЦЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ ІМЕНІ МИХАЙЛА ОСТРОГРАДСЬКОГО**
вул. Першотравнева, 20, м. Кременчук, Полтавська обл., 39600 (UA)
- (54) **ІСКРОБЕЗПЕЧНИЙ ПРИСТРІЙ**
- (57) Іскробезпечний пристрій дистанційного керування електроприймачами, який містить джерело живлення змінного струму, пост керування з послідовно увімкненими контактами кнопок "Пуск", "Стоп" і першим діодом, який приєднаний до джерела живлення змінного струму за допомогою лінії зв'язку та першого резистора, компаратор, до першого входу якого приєднаний блок формування опорного сигналу, виконаний на базі генератора підвищеної частоти у вигляді подільника напруги, а до другого - блок формування вхідного сигналу, підсилювач, вхід якого з'єднаний з виходом компаратора, а вихід - з обмоткою першого виконавчого реле, а послідовно з обмоткою другого виконавчого реле увімкнений вхід оптрона, вихід якого за допомогою другого резистора приєднаний до подільника напруги, який відрізняється тим, що додатково введено джерело живлення постійного струму, виконане у вигляді помножувача напруги на першому і другому конденсаторах та другому і третьому діодах, причому між першим конденсатором джерела постійного струму та підсилювачем увімкнений стабілізатор напруги, виконаний на стабілітроні, першому транзисторі та третьому резисторі.

Н 04

- (11) **123779** (51) МПК
H04M 3/22 (2006.01)
H04W 12/128 (2021.01)
- (21) а 2018 08189 (22) 23.12.2016
(24) 03.06.2021
(31) 2015/16919
(32) 25.12.2015
(33) TR
(86) PCT/TR2016/000203, 23.12.2016
- (72) Деліоглу Мехмет Ялчін (TR), Дева Мерт (TR)

(73) **ТУРКДЖЕЛЛ ТЕКНОЛОЖИ АРАСТІРМА ВЕ ГЕЛІСТІРМЕ АНОНІМ ШІРКЕТІ**
Yeni Mahalle Pamukkale Sokak No:11, Soganlik, Kartal/Istanbul, Turkey (TR)

(54) **СИСТЕМА ТА СПОСІБ ЗАПОБІГАННЯ ФРОДУ РОЗПОДІЛУ ПРИБУТКУ МІЖ ОПЕРАТОРАМИ РІЗНИХ КРАЇН**

- (57) 1. Система для запобігання фроду розподілу прибутку між операторами різних країн, яка містить: щонайменше одну базу (2) даних, в яку записані номери з міжнародною послугою "сплата виклику за підвищеним тарифом" (IPRN), визначені раніше та використані у фроді розподілу прибутку між операторами різних країн, яка відрізняється тим, що містить: щонайменше один блок (3) запобігання фроду, який перебуває на зв'язку з базою (2) даних та станцією (S), яка належить оператору мобільного зв'язку, причому коли абоненту оператора мобільного зв'язку потрібно здійснити виклик за кордон, блок підключається до бази (2) даних за рахунок приймання вказаного виклику від станції (S) та перевіряє, чи записані номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, та номер, з яким буде встановлено виклик, який потрібно здійснити за кордон, у базу (2) даних або ні; якщо на нього надходить інформація в результаті перевіркої транзакції про те, що номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, та номер, з яким буде встановлено виклик, що потрібно здійснити за кордон, записані в базі (2) даних, він відправляє команду на станцію (S) із заборотою встановлення виклику; якщо на нього надходить інформація в результаті перевіркої транзакції про те, що номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, та номер, з яким буде встановлено виклик, що потрібно здійснити за кордон, не записані в базі (2) даних, він перевіряє, чи має номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, поточний виклик або ні, шляхом входження в контакт зі станцією (S); якщо він визначає в результаті перевіркої транзакції, що номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, не має поточного виклику, він не діє; якщо він визначає в результаті перевіркої транзакції, що номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, має поточний виклик, він перевіряє, чи здійснюється визначений поточний виклик та виклик, який потрібно здійснити за кордон, на той самий номер або ні; якщо він визначає у результаті перевіркої транзакції, що визначений поточний виклик та виклик, який потрібно здійснити за кордон, потрібно здійснити на різні номери, він не діє; якщо він визначає у результаті перевіркої транзакції, що визначений поточний виклик та виклик, який потрібно здійснити за кордон, потрібно здійснити на ті самі номери, він відправляє команду на станцію (S) з припиненням поточного виклику та заборотою встановлення виклику, який потрібно здійснити за кордон; та записує вказаний номер у базу (2) даних за рахунок підключення до бази (2) даних.
2. Система за п. 1, яка відрізняється тим, що в базі (2) даних, яка перебуває на зв'язку з блоком (3) запобігання фроду, записані номери з міжнародною послугою "сплата виклику за підвищеним тарифом", визначені раніше та використані у фроді розподілу прибутку між операторами різних країн.
3. Система за п. 1 або п. 2, яка відрізняється тим, що блок (3) запобігання фроду перебуває на зв'язку

з базою (2) даних та станцією (S), яка належить оператору мобільного зв'язку, та забезпечує можливість установлення викликів, затребуваних абонентами, за рахунок приймання запитів на встановлення виклику від абонентів оператора мобільного зв'язку.

4. Система за будь-яким із попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що блок (3) запобігання фроду приймає вказаний виклик від станції (S), коли абоненту оператора мобільного зв'язку потрібно здійснити виклик за кордон.

5. Система за п. 4, яка **відрізняється** тим, що блок (3) запобігання фроду приймає виклик, який потрібно здійснити за кордон, від станції (S) за протоколом передачі SS7 CAMEL.

6. Система за п. 4 або п. 5, яка **відрізняється** тим, що блок (3) запобігання фроду підключається до бази (2) даних після приймання виклику від станції (S).

7. Система за п. 6, яка **відрізняється** тим, що блок (3) запобігання фроду перевіряє, чи записані номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, та номер, з яким буде встановлено виклик, який потрібно здійснити за кордон, у базі (2) даних або ні.

8. Система за п. 7, яка **відрізняється** тим, що блок (3) запобігання фроду відправляє команду на станцію (S) із заборотою встановлення виклику, якщо на нього надходить інформація у результаті перевіркої транзакції про те, що номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, та номер, з яким буде встановлено виклик, який потрібно здійснити за кордон, записані в базі (2) даних.

9. Система за п. 7, яка **відрізняється** тим, що блок (3) запобігання фроду перевіряє, чи має номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, поточний виклик або ні, шляхом входження в контакт із станцією (S), якщо на нього надходить інформація у результаті перевіркої транзакції про те, що номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, та номер, з яким буде встановлено виклик, який потрібно здійснити за кордон, не записані в базі (2) даних.

10. Система за п. 9, яка **відрізняється** тим, що блок (3) запобігання фроду не діє, якщо він визначає у результаті перевіркої транзакції, що номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, не має поточного виклику.

11. Система за п. 9, яка **відрізняється** тим, що блок (3) запобігання фроду перевіряє, чи здійснюється визначений поточний виклик та виклик, який потрібно здійснити за кордон, на той самий номер або ні, якщо він визначає у результаті перевіркої транзакції, що номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, має поточний виклик.

12. Система за п. 11, яка **відрізняється** тим, що блок (3) запобігання фроду не діє, якщо він визначає у результаті перевіркої транзакції, що визначений поточний виклик та виклик, який потрібно здійснити за кордон, потрібно здійснити на різні номери.

13. Система за п. 11, яка **відрізняється** тим, що блок (3) запобігання фроду відправляє команду на стан-

цію (S) із припиненням поточного виклику та заборотою встановлення виклику, який потрібно здійснити за кордон, якщо він визначає у результаті перевіркої транзакції, що визначений поточний виклик та виклик, який потрібно здійснити за кордон, потрібно здійснити на ті самі номери.

14. Система за п. 13, яка **відрізняється** тим, що блок (3) запобігання фроду записує номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, у базу (2) даних за рахунок підключення до бази (2) даних.

15. Спосіб запобігання фроду розподілу прибутку між операторами різних країн, який **відрізняється** тим, що включає наступні етапи:

приймання виклику, який потрібно здійснити за кордон, від станції (S) (101); перевірку того, чи записані номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, та номер, з яким буде встановлено виклик, який потрібно здійснити за кордон, у базі (2) даних або ні (102);

відправлення команди на станцію (S) із заборотою встановлення виклику (103), якщо у результаті перевіркої транзакції (102) визначають, що номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, та номер, з яким буде встановлено виклик, який потрібно здійснити за кордон, записані в базі (2) даних;

перевірку того, чи має номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, поточний виклик або ні (104), якщо у результаті перевіркої транзакції (102) визначають, що номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, та номер, з яким буде встановлено виклик, який потрібно здійснити за кордон, не записані в базі (2) даних;

бездіяльність (108), якщо у результаті перевіркої транзакції (104) визначають, що номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, не має поточного виклику; перевірку того, чи здійснюється визначений поточний виклик та виклик, який потрібно здійснити за кордон, на той самий номер або ні (105), якщо у результаті перевіркої транзакції (104) визначають, що номер, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, має поточний виклик;

бездіяльність (108), якщо у результаті перевіркої транзакції (105) визначають, що визначений поточний виклик та виклик, який потрібно здійснити за кордон, потрібно здійснити на різні номери;

відправлення команди на станцію (S) з припиненням поточного виклику та заборотою встановлення виклику, який потрібно здійснити за кордон (106), якщо у результаті перевіркої транзакції (105) визначають, що визначений поточний виклик та виклик, який потрібно здійснити за кордон, потрібно здійснити на ті самі номери; та

записування номера, з якого потрібно здійснити виклик за кордон, у базу (2) даних за рахунок підключення до бази (2) даних.

ВІДОМОСТІ ПРО ДЕРЖАВНУ РЕЄСТРАЦІЮ КОРИСНИХ МОДЕЛЕЙ

Розділ А:

Життєві потреби людини

А 01

- (11) **147648** (51) МПК
A01B 19/02 (2006.01)
A01B 21/02 (2006.01)
- (21) и 2020 06525 (22) 09.10.2020
(24) 03.06.2021
- (72) Козаченко Олексій Васильович (UA), Бакум Микола Васильович (UA), Сєдих Костянтин Вячеславович (UA), Кириченко Роман Васильович (UA), Крєкот Микола Миколайович (UA), Михайлов Анатолій Дмитрович (UA), Козій Олександр Борисович (UA), Абдуєв Магомед Меджидович (UA)
- (73) **КОЗАЧЕНКО ОЛЕКСІЙ ВАСИЛЬОВИЧ**
вул. Луї Пастера, 322, кв. 76, м. Харків, 61172 (UA)
- БАКУМ МИКОЛА ВАСИЛЬОВИЧ**
вул. Героїв Праці, 46, кв. 64, м. Харків, 61135 (UA)
- СЄДИХ КОСТЯНТИН ВЯЧЕСЛАВОВИЧ**
вул. Волонтерська, 60-а, кв. 96, м. Харків, 61098 (UA)
- КИРИЧЕНКО РОМАН ВАСИЛЬОВИЧ**
вул. Амосова, 50, кв. 67, м. Харків, 61176 (UA)
- КРЕКОТ МИКОЛА МИКОЛАЙОВИЧ**
вул. Ленінградська, 99-а, м. Південне, Харківський р-н, 62462 (UA)
- МИХАЙЛОВ АНАТОЛІЙ ДМИТРОВИЧ**
пр. Перемоги, 65-а, кв. 130, м. Харків, 61113 (UA)
- КОЗІЙ ОЛЕКСАНДР БОРИСОВИЧ**
пр. Московський, 89, кв. 191, м. Харків, 61050 (UA)
- АБДУЄВ МАГОМЕД МЕДЖИДОВИЧ**
вул. Молодіжна, 5, с. Першотравневе, м. Південне, Харківський р-н, 62465 (UA)
- (54) **ДИСКОВА БОРОНА**
- (57) Дискова борона, яка включає раму, до якої кріпляться сферичні диски, на окремих стояках фронтально у два ряди на однаковій висоті з поперечним зміщенням заднього ряду відносно переднього, і прутковий каток з механізмом регулювання глибини їх ходу, яка **відрізняється** тим, що диски першого ряду прикріплюють до рами борони на стояках більшої жорсткості, ніж стояки кріплення дисків другого ряду, на величину, пропорційну різниці опору ґрунту дискам першого і другого рядів.

(11) **147671**

(51) МПК (2021.01)
A01D 41/00
A01D 45/00

(21) и 2020 08396

(22) 28.12.2020

(24) 03.06.2021

- (11) **147701** (51) МПК (2021.01)
A01K 1/00
- (21) **u 2021 00830** (22) **22.02.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Дидикина Аліна Ігорівна (UA), Прудніков Василь Григорович (UA)
- (73) **ДИДИКІНА АЛІНА ІГОРІВНА**
вул. Академічна, 1, смт Мала Данилівка, Дергачівський р-н, Харківська обл., 62341 (UA)
- ПРУДНІКОВ ВАСИЛЬ ГРИГОРОВИЧ**
вул. Академічна, 1, смт Мала Данилівка, Дергачівський р-н, Харківська обл., 62341 (UA)
- (54) **КОРЕКЦІЙНА СЕКЦІЯ ДЛЯ УТРИМАННЯ КОРІВ І ТЕЛЯТ**
- (57) Корекційна секція для утримання корів і телят, що містить задні стінки розміром 3000×2000 мм, дві бокові стінки (3000×2000 мм), двері (2880×1880 мм), металевий засув на дверях, металеву сітку каніліровану (50×50×5 мм), вертикальні перемички з профільної труби (50×50×3 мм) та горизонтальні перемички з профільної труби (50×50×3 мм).

A 23

- (11) **147709** (51) МПК
A23G 1/56 (2006.01)
- (21) **u 2021 01801** (22) **06.04.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Кононенко Андрій Борисович (UA), Бойченко Олександр Сергійович (UA)
- (73) **КОНОНЕНКО АНДРІЙ БОРИСОВИЧ**
вул. Федора Максименка, буд. 20-Г, м. Київ, 04075 (UA)
- БОЙЧЕНКО ОЛЕКСАНДР СЕРГІЙОВИЧ**
вул. Дмитра Рябого, буд. 65, смт Добровеличківка, Добровеличківський р-н, Кіровоградська обл., 27000 (UA)
- (54) **СПОСІБ ВИГОТОВЛЕННЯ НАПОЮ З КАКАО**
- (57) 1. Спосіб виготовлення какао-напою, при якому виконують контакт какао-продукту у вигляді подрібнених обсмажених какао-бобів з рідиною, який **відрізняється** тим, що здійснюють контакт какао-продукту, який знаходиться у водонепроникному пакеті, а як рідину використовують воду
2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що до какао-продукту додатково додають сухий рослинний компонент.

A 43

- (11) **147687** (51) МПК (2021.01)
A43B 17/00
- (21) **u 2021 00491** (22) **08.02.2021**
(24) **03.06.2021**

- (72) Тимочко Богдан Михайлович (UA), Федів Володимир Іванович (UA), Божок Аркадій Михайлович (UA)
- (73) **ВИЩИЙ ДЕРЖАВНИЙ НАВЧАЛЬНИЙ ЗАКЛАД УКРАЇНИ "БУКОВИНСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ МЕДИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ" МОЗ УКРАЇНИ**
пл. Театральна, 2, м. Чернівці, 58002 (UA)
- (54) **УСТІЛКА ДЛЯ ВЗУТТЯ З ПІДІГРІВОМ-ОХОЛОДЖЕННЯМ НОГИ**
- (57) Устілка для взуття з підігрівом-охолодженням ноги, яка виконана правою та лівою, що містить плоску пошарову конструкцію, у якій наявні верхня і нижня зовнішні плоскі поверхні з полімерного теплопровідного матеріалу з можливістю їх плоскої деформації, та внутрішня частина, що нагріває чи охолоджує, яка **відрізняється** тим, що елемент підігріву між зовнішніми поверхнями являє собою чотири прошарки із щільним між собою контактом: перший верхній прошарок м'який товстий з можливістю пружної об'ємної деформації, який містить певне число наскрізних отворів; другий тонкий клапанний прошарок містить сукупність подвійних клапанів, у яких діаметр малого отвору в 25-30 разів менший за діаметр великого отвору, а діаметр рухомої частини та великого отвору дещо менші діаметра наскрізних отворів першого та четвертого прошарків, подвійні клапани співвісні з наскрізними отворами верхнього прошарку для забезпечення вільного переміщення газу в об'єм наскрізних отворів та утрудненого переміщення газу з об'єму наскрізних отворів верхнього прошарку; третій січастий прошарок з кроком сітки, меншим за розмір наскрізних отворів першого прошарку, для забезпечення роботи подвійних клапанів; четвертий товстий нижній прошарок з можливістю малої об'ємної деформації містить наскрізні отвори, співвісні з наскрізними отворами першого прошарку.

A 45

- (11) **147664** (51) МПК (2021.01)
A45F 3/04 (2006.01)
A45F 5/00
- (21) **u 2020 08253** (22) **22.12.2020**
(24) **03.06.2021**
- (72) Вербенський Михайло Георгійович (UA), Криволапчук Володимир Олексійович (UA), Смерницький Дем'ян Вікторович (UA), Гуляев Андрій Володимирович (UA), Филь Руслан Сергійович (UA), Филь Світлана Петрівна (UA), Мельник Володимир Євгенійович (UA)
- (73) **ДЕРЖАВНИЙ НАУКОВО-ДОСЛІДНИЙ ІНСТИТУТ МВС УКРАЇНИ**
пров. Євгена Гуцала, 4-а, м. Київ, 01011 (UA)
- (54) **СПОРЯДЖЕННЯ ДЛЯ ПЕРЕНЕСЕННЯ ІНСТРУМЕНТІВ ПРИМУСОВОГО ВІДЧИНЕННЯ ПРИМІЩЕНЬ**
- (57) Спорядження для перенесення інструментів примусового відчинення приміщень, що містить металеву конструкцію з фіксаторами для кріплення інструментів, до якої прикріплено дві плечові лямки, спинну панель, ручку для перенесення, поясний ремінь та знім-

ний чохол, яке **відрізняється** тим, що металева конструкція складається з основи, на лицьовій поверхні якої за допомогою перемичок з трьох боків закріплено раму та уздовж головної осі - принаймні одну напрямну; один із вертикальних елементів рами довший за інший та утворює із перемичкою паз для кріплення інструмента; на нижній частині рами встановлена горизонтальна пластина, яка разом із перемичками утворює пази для упору інструментів; на вертикальних елементах рами, напрямній та у верхній частині основи розташовано принаймні по одному фіксатору для кріплення інструмента; фіксатор для кріплення інструмента рухається по напрямній; знімний чохол безпосередньо прикріплено до основи; ззовні спинної панелі додатково закріплено демпфер.

A 47

(11) 147711

(51) МПК (2021.01)
A47G 7/02 (2006.01)
A47G 7/06 (2006.01)
B65D 5/00
B65D 5/40 (2006.01)

(21) у 2021 02066

(22) 19.04.2021

(24) 03.06.2021

(72) Стрельцов Владислав Олексійович (UA)

(73) СТРЕЛЬЦОВ ВЛАДИСЛАВ ОЛЕКСІЙОВИЧ

вул. Вербицького, 11, кв. 460, м. Київ, 02121, Україна (UA)

(54) СКЛАДАНА ВАЗА

(57) 1. Складана ваза, яка виготовлена з листового матеріалу та має дно й бічні стінки, яка **відрізняється** тим, що складається з виготовленої з комбінованого матеріалу плоскої заготовки, де комбінований матеріал є листовим матеріалом щільністю від 90 до 450 г/м² з нанесеним на нього за допомогою ламінування шаром полімерної плівки, а на заготовку нанесені лінії згину, які формують дно, основні та допоміжні бічні стінки вази, при цьому дно вази є правильним багатокутником, основні бічні стінки є рівнобічними трикутниками, основами яких є сторони дна вази, допоміжні бічні стінки, розташовані між кожною парою основних бічних стінок, мають одну спільну вершину, яка співпадає з вершиною багатокутника дна вази, та розширюються у напрямку від центра заготовки вази до її краю, а дві допоміжні бічні стінки, що мають спільне ребро із основною бічною стінкою, мають також спільне ребро, початок якого розташований в місці з'єднання бічних ребер основної бічної стінки, та яке закінчується на краю заготовки вази, при цьому ваза складається таким чином, що верхні ребра допоміжних бічних стінок, що формують периметр заготовки, утворюють зигзагоподібний контур, а допоміжні бічні стінки формують кути, що почергово направлені у напрямку до та від центральної осі вази, що проходить перпендикулярно її дну, при цьому в кожній допоміжній бічній стінці виконано отвір для фіксуючого регулюючого елемента.

2. Складана ваза за п. 1, яка **відрізняється** тим, що має щонайменше вісім допоміжних бічних стінок з отворами.

3. Складана ваза за п. 2, яка **відрізняється** тим, що отвори на допоміжних бічних стінках розташовуються рівновіддалено один від одного.

4. Складана ваза за п. 1, яка **відрізняється** тим, що фіксуючим регулюючим елементом є стрічка або шнур.

5. Складана ваза за п. 1, яка **відрізняється** тим, що листовий матеріал є кольоровим.

6. Складана ваза за п. 5, яка **відрізняється** тим, що на листовий матеріал за допомогою друку нанесені малюнки, орнаменти тощо.

7. Складана ваза за п. 6, яка **відрізняється** тим, що листовим матеріалом є папір.

8. Складана ваза за п. 6, яка **відрізняється** тим, що листовим матеріалом є картон.

(11) 147665

(51) МПК (2021.01)
A45F 3/04 (2006.01)
A45F 5/00

(21) у 2020 08254

(22) 22.12.2020

(24) 03.06.2021

(72) Вербенський Михайло Георгійович (UA), Криволапчук Володимир Олексійович (UA), Смерницький Дем'ян Вікторович (UA), Гуляев Андрій Володимирович (UA), Филь Руслан Сергійович (UA), Филь Светлана Петрівна (UA), Мельник Володимир Євгенійович (UA)

(73) ДЕРЖАВНИЙ НАУКОВО-ДОСЛІДНИЙ ІНСТИТУТ МВС УКРАЇНИ

пров. Євгена Гуцала, 4-а, м. Київ, 01011 (UA)

(54) МОДУЛЬНИЙ РЮКЗАК

(57) 1. Модульний рюкзак, що складається з основи із текстильними стрічками і застілками типу "фастек", до якої прикріплено дві плечові лямки та ручку для перенесення, який **відрізняється** тим, що до основи текстильними стрічками в нижній частині та застілками типу "фастек" з текстильними стрічками з боків та зверху приєднано передню панель, що утворює собою основний відсік, всередині якого розміщено сумку; сумка складається з основної, верхньої та нижньої (дно) панелей, з'єднаних між собою застілками-блискавками, двох ручок - верхньої і бокової, та двох застібок типу "фастек" з текстильними стрічками, розташованими на верхній панелі; в основному відсіку сумка встановлюється нижньою панеллю (дном) на текстильні стрічки, які поєднують у нижніх частинах передню панель та основу, а зверху закріплюється до основи та передньої панелі власними застілками типу "фастек" з текстильними стрічками; при цьому до тильної сторони основи приєднано спинну панель з демпфером та поясний ремінь, а на лицьовій стороні - виконано систему кріплення типу MOLLE.

2. Рюкзак за п. 1, який **відрізняється** тим, що всередині сумки виконано систему кріплення типу MOLLE з фіксаторами для закріплення інструментів та приладдя.

A 61

- (11) **147662** (51) МПК
A61B 17/56 (2006.01)
A61F 2/44 (2006.01)
- (21) **у 2020 08190** (22) **21.12.2020**
(24) **03.06.2021**
- (72) Радченко Володимир Олександрович (UA), Корж Микола Олексійович (UA), Сіренко Олександр Анатолійович (UA), Тимченко Ірина Борисівна (UA), Попсуйшапка Костянтин Олексійович (UA), Чернишов Олександр Геннадійович (UA), Барков Олександр Олександрович (UA), Диннік Олексій Артемович (UA)
- (73) **ДЕРЖАВНА УСТАНОВА "ІНСТИТУТ ПАТОЛОГІЇ ХРЕБТА ТА СУГЛОБІВ ІМ. ПРОФ. М.І. СИТЕНКА НАЦІОНАЛЬНОЇ АКАДЕМІЇ МЕДИЧНИХ НАУК УКРАЇНИ"**
вул. Пушкінська, 80, м. Харків-24, 61024 (UA)
- (54) **ЕНДОПРОТЕЗ МІЖХРЕБЦЕВОГО ДИСКА ШИЙНОГО ВІДДІЛУ ХРЕБТА**
- (57) Ендопротез міжхребцевого диска шийного відділу хребта, що містить шарнірно з'єднані між собою і виконані із біоінертного матеріалу, наприклад штучного сапфіра, дві, розташовані одна над одною, верхню і нижню, несучі пластини з елементами фіксації їх із замикальними пластинами верхньо- і нижньорозташованих хребців реконструйованого сегмента хребта, а також сформовані на суміжних поверхнях несучих пластин відповідно напівсферичну кулю і напівсферичну западину, встановлені одна в одну з можливістю кутового нахилу і ротаційних рухів несучих пластин навколо їх загальної вертикальної осі, який **відрізняється** тим, що він оснащений додатковим елементом фіксації його з елементами реконструйованого сегмента хребта у вигляді вставки із силіконової гуми або каучуку, з пружністю її від 50 % до 500 %, розташованої в просторі між передніми поверхнями несучих пластин і внутрішніми поверхнями обох суміжних хребців в зоні виконання доступу для ендопротеза.

- (57) Спосіб надання фунгіцидних властивостей базисам знімних зубних протезів, який полягає у створенні біоінертного матеріалу базису знімних зубних протезів, який **відрізняється** тим, що фунгіцидний препарат - бензоїлгідрозон бензойного естеру 1,4-бензохінонмонооксиду вводиться в матеріал базису знімних зубних протезів на етапі їх виготовлення.

- (11) **147677** (51) МПК (2021.01)
A61C 19/04 (2006.01)
G01B 5/00
- (21) **у 2021 00154** (22) **16.01.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Палійчук Іван Васильович (UA), Локота Юрій Євгенович (UA), Палійчук Володимир Іванович (UA), Локота Євген Юрійович (UA), Палійчук Микола Іванович (UA), Грицак Маріанна Євгенівна (UA), Вовчок Руслан Васильович (UA)
- (73) **ПАЛІЙЧУК ВОЛОДИМИР ІВАНОВИЧ**
вул. Галицька, 2, м. Івано-Франківськ, 76018 (UA)
- (54) **ПРИСТРІЙ ДЛЯ ВИЗНАЧЕННЯ ГЕОМЕТРИЧНИХ ПАРАМЕТРІВ ФРАГМЕНТІВ РОТОВОЇ ПОРОЖНИНИ**
- (57) 1. Пристрій для визначення геометричних параметрів фрагментів ротової порожнини, який містить два шарнірно сполучені стержні із загнутими кінцями, який **відрізняється** тим, що шарнірний вузол містить вал циліндричної форми, на який насаджено стержні, по обидва боки шарнірного вузла ділянки стержнів однакові по довжині, частина валу виступає за межі тіл стержнів і має ділянку з поперечним каналом, в який введено штангу, встановлену з можливістю поздовжнього переміщення, на обох кінцях штанги виконані виступи, аналогічні зігнутих кінцям стержнів і направлені перпендикулярно площині, в якій розташовані стержні.
2. Пристрій для визначення геометричних параметрів фрагментів ротової порожнини за п. 1, який **відрізняється** тим, що стержні та штанга виконані однакової довжини.

- (11) **147686** (51) МПК
A61C 13/23 (2006.01)
- (21) **у 2021 00445** (22) **05.02.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Авдєєнко Анатолій Петрович (UA), Коновалова Світлана Олексіївна (UA), Комаровська-Порохнявець Олена Зорянівна (UA), Ярова Світлана Павлівна (UA), Турчененко Сергій Олегович (UA), Яров Юрій Юрійович (UA)
- (73) **ДОНБАСЬКА ДЕРЖАВНА МАШИНОБУДІВНА АКАДЕМІЯ**
вул. Академічна, 72, м. Краматорськ, 84313 (UA)
ДОНЕЦЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ МЕДИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ
б-р Машинобудівників, 39, м. Краматорськ, 84313 (UA)
- (54) **СПОСІБ НАДАННЯ ФУНГІЦИДНИХ ВЛАСТИВОСТЕЙ БАЗИСАМ ЗНІМНИХ ЗУБНИХ ПРОТЕЗІВ**

- (11) **147668** (51) МПК
A61G 7/10 (2006.01)
- (21) **у 2020 08332** (22) **28.12.2020**
(24) **03.06.2021**
- (72) Житарюк Ігор Тарасович (UA)
- (73) **ЖИТАРЮК ІГОР ТАРАСОВИЧ**
вул. Щусьєва, 30/6, кв. 6, м. Київ, 04060 (UA)
- (54) **КОМПЛЕКС ДЛЯ ЕВАКУАЦІЇ**
- (57) 1. Комплекс для евакуації, який забезпечений транспортувальним контейнером для потерпілого, який **відрізняється** тим, що містить самохідний апарат керований за допомогою провідної лінії, а транспортувальний контейнер для потерпілого виконано у вигляді складаного кокона.
2. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що оснащений операторським пультом керування пристроями та функціями евакуатора.

3. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що оснащений переносною лебідкою з автономним блоком живлення, а провідна лінія являє собою багато-жильний ізольований трос, прикріплений одним кінцем до задньої частини самохідного апарата, а другим кінцем закріплений у переносній лебідці, та підключена до операторського пульта керування.
4. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що самохідний апарат оснащений електронним блоком керування, обладнанням та механізмами.
5. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що самохідний апарат оснащений електродвигунами приводу.
6. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що самохідний апарат оснащений відеокамерою з пристроєм нічного бачення.
7. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що самохідний апарат оснащений маніпулятором для захоплення потерпілого та затягування його у транспортувальний контейнер.
8. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що транспортувальний контейнер оснащений пристроєм для фіксації потерпілого у вигляді надувного контуру, вмонтованого з внутрішньої сторони.
9. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що самохідний апарат оснащений прожектором.
10. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що самохідний апарат оснащений тепловізором.
11. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що самохідний апарат оснащений пристроєм аудіоконтакту з мікрофоном та динаміком.
12. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що самохідний апарат оснащений автономним блоком керування з GPS-модулем і акумулятором, для самостійного повернення в задану координатну точку, у випадку пошкодження лінії провідного керування.
13. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що самохідний апарат оснащений далекоміром.
14. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що самохідний апарат оснащений системою самоліквідації.
15. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що транспортувальний контейнер оснащений пристроєм моніторингу життєвоважливих показників поранених, таких як артеріальний тиск, насичення киснем, частота серцевих скорочень і температура тіла.
16. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що транспортувальний контейнер оснащений автоматичним ін'єктором для введення лікарських препаратів.
17. Комплекс за п. 1, який **відрізняється** тим, що транспортувальний контейнер оснащений кисневими ємностями високого тиску для наповнення фіксуючого надувного контуру та забезпечення дихання постраждалого при евакуації.

(73) ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ "МЕДИЧНИЙ ЦЕНТР "М.Т.К."

вул. М. Амосова, буд. 10, м. Київ, 03680 (UA)

(54) СПОСІБ ЛІКУВАННЯ ХРОНІЧНОЇ ІШЕМІЧНОЇ ХВОРОБИ СЕРЦЯ АБО СТАБІЛЬНОЇ СТЕНОКАРДІЇ НАПРУГИ, АБО АТЕРОСКЛЕРОЗУ ПЕРИФЕРИЧНИХ СУДИН У ЛЮДИНИ

- (57)** 1. Спосіб лікування хронічної ішемічної хвороби серця або стабільної стенокардії напруги, або атеросклерозу периферичних судин у людини, яка страждає хронічною ішемічною хворобою серця або стабільною стенокардією напруги, або атеросклерозом периферичних судин, при якому згаданій людині вводять фармацевтичну композицію, яка містить як активний компонент сіль аргініну та воду, який **відрізняється** тим, що вводять фармацевтичну композицію, яка має таку лікарську форму як оральний розчин, як сіль аргініну містить аргініну аспартат, додатково містить як активний компонент левокарнітин, додатково містить такі допоміжні компоненти, як коригент рН, який є підкислювачем, підсолоджувач і консервант, при наступному співвідношенні компонентів, мг/мл:

аргініну аспартат	180-320
левокарнітин	50-150
коригент рН, який є підкислювачем	1,5-6,0
підсолоджувач	0,4-1,2
консервант	0,5-2,0
вода	до 1 мл,

причому фармацевтичну композицію вводять у кількості, що є ефективною для лікування хронічної ішемічної хвороби серця, стабільної стенокардії напруження, атеросклерозу периферичних судин.

2. Спосіб за п. 2, який **відрізняється** тим, що вводять фармацевтичну композицію, яка містить аргініну аспартат, левокарнітин, коригент рН, який є підкислювачем, підсолоджувач, консервант, воду, при наступному співвідношенні компонентів, мг/мл:

аргініну аспартат	240-300
левокарнітин	80-120
коригент рН, який є підкислювачем	2,5-4,5
підсолоджувач	0,6-1,0
консервант	1,0-1,5
вода	до 1 мл.

3. Спосіб за п. 3, який **відрізняється** тим, що вводять фармацевтичну композицію, яка містить аргініну аспартат, левокарнітин, коригент рН, який є підкислювачем, підсолоджувач, консервант, воду, при наступному співвідношенні компонентів, мг/мл:

аргініну аспартат	264
левокарнітин	100
коригент рН, який є підкислювачем	3
підсолоджувач	0,8
консервант	1
вода	до 1 мл.

4. Спосіб за будь-яким із пп. 1-3, який **відрізняється** тим, що вводять фармацевтичну композицію, яка містить як коригент рН, який є підкислювачем, яблучну кислоту.

5. Спосіб за будь-яким із пп. 1-4, який **відрізняється** тим, що вводять фармацевтичну композицію, яка містить як підсолоджувач сахаринат натрію.

6. Спосіб за будь-яким із пп. 1-5, який **відрізняється** тим, що вводять фармацевтичну композицію, яка містить як консервант метилпарагідроксибензоат або

(11) 147644 (51) МПК (2021.01)
A61K 31/00
A61P 9/00

(21) у 2020 04794 (22) 27.07.2020
(24) 03.06.2021

(72) Гуменюк Микола Іванович (UA)

пропілпарагідроксибензоат або суміш метилпарагідроксибензоату та пропілпарагідроксибензоату.

7. Спосіб за будь-яким із пп. 1-6, який **відрізняється** тим, що вводять фармацевтичну композицію, яка містить як воду - воду для ін'єкцій.

8. Спосіб за будь-яким із пп. 1-7, який **відрізняється** тим, що вводять фармацевтичну композицію, яка має щільність 1,1 г/мл, рН розчину 5-6,5, динамічну в'язкість при 20 °С 2,5 сП.

9. Спосіб за будь-яким із пп. 1-8, який **відрізняється** тим, що фармацевтичну композицію вводять у складі комплексної терапії хронічної ішемічної хвороби серця, стабільної стенокардії напруження, атеросклерозу периферичних судин.

10. Спосіб за будь-яким із пп. 1-9, який **відрізняється** тим, що фармацевтичну композицію вводять у кількості, що є добовою дозою, 20-40 мл.

- (11) **147694** (51) МПК
A61L 9/20 (2006.01)
- (21) **u 2021 00646** (22) **15.02.2021**
(24) **03.06.2021**
(72) Гавдун Ігор Григорович (UA)
(73) **ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ "ЗАВОД СВІТЛОТЕХНІКА"**
Південне шосе, 74-Б, м. Запоріжжя, 69008 (UA)
(54) **РЕЦИРКУЛЯТОР БАКТЕРИЦИДНИЙ "МАХАОН"**
(57) Рециркулятор бактерицидний, який містить раму, вентилятор забору зараженого повітря, вентилятор викиду обробленого повітря, систему кріплення бактерицидних ламп, бактерицидні лампи, кришку із внутрішньою світловідбиваючою поверхнею, електронний баласт, кабель живлення з штепсель-вилкою, який **відрізняється** тим, що додатково забезпечений фільтрами із сітчастого матеріалу, які встановлені на торцях вентилятора забору зараженого повітря і вентилятора викиду обробленого повітря, блоком керування, який по засобам електричних проводів приєднано до електронного баласту, вентилятора забору зараженого повітря, вентилятора викиду обробленого повітря і кабелю живлення з штепсель-вилкою, датчиком вимірювання інтенсивності ультрафіолетового випромінювання і датчиком швидкості повітря, які розміщені у внутрішньому об'ємі рами і по засобам електричних проводів приєднані до блока керування.

A 62

- (11) **147652** (51) МПК (2021.01)
A62B 18/00
A62B 23/02 (2006.01)

- (21) **u 2020 07187** (22) **09.11.2020**
(24) **03.06.2021**
(72) Климашенко Костянтин Генріхович (UA)
(73) **КЛИМАШЕНКО КОСТЯНТИН ГЕНРІХОВИЧ**
просп. Тичини, 6, кв. 54, м. Київ, 02098 (UA)
(54) **СПОСІБ ЗНЕЗАРАЖЕННЯ МАСКИ МЕДИЧНОЇ**
(57) Спосіб знезараження маски медичної, що включає використання знезаражувального розчину, який **відрізняється** тим, що для приготування знезаражувального розчину до 6 л спирту медичного 96 % додають по 3 г олії ефірної чайного дерева, олії ефірної лимона, олії ефірної орегано, олії ефірної ялівцю, олії ефірної ялиці, олії ефірної евкалипта, олії ефірної лемонграсу, олії ефірної сосни, олії ефірної шавлії, олії ефірної кипариса, олії ефірної туї, що разом становить 33 г або 0,55 % складової олій ефірних у спиртовому розчині, і цим антибактеріальним та антивірусним розчином у кількості 1 мл кожного вечора обприскують маску медичну і кладуть її на ніч у поліетиленовий пакет, який закривають, а зранку маску медичну, що повністю знезаражена, використовують для дієвого захисту органів дихання від проникнення вірусів, мікробів та бактерій.

A 63

- (11) **147642** (51) МПК (2021.01)
A63B 23/00
A61H 1/02 (2006.01)
- (21) **u 2020 02017** (22) **24.03.2020**
(24) **03.06.2021**
(72) Топчій Сергій Миколайович (UA)
(73) **ТОПЧІЙ СЕРГІЙ МИКОЛАЙОВИЧ**
вул. Пушкіна, 6. 7, кв. 3, м. Вінниця, 21050 (UA)
(54) **ТРЕНАЖЕРНИЙ КОМПЛЕКС**
(57) Тренажерний комплекс, що містить засоби для здійснення реабілітаційних і діагностичних процедур у вигляді пристосувань для силових навантажень опорно-рухової системи людини, який **відрізняється** тим, що складається із почергово розміщених пристосувань ділянки для гімнастичних процедур, що включає гімнастичні снаряди та зони індивідуального розміщення, та з'єднаних між собою ділянки блочних тренажерів зі спареними стійками, ділянки для процедур з еластичними стрічками, розміщеними на підвісних пристроях з канатами, та ділянки для підвісної ходьби з рухомою рейкою, зв'язаною з перекладиною, яка з'єднує блочні тренажери.

Розділ В:**Виконання операцій.
Транспортування****В 01**

- (11) **147651** (51) МПК
B01D 3/20 (2006.01)
- (21) **и 2020 06986** (22) **30.10.2020**
(24) **03.06.2021**
- (72) Іванов Максим Олександрович (UA), Двойнос Ярослав Григорович (UA)
- (73) **ІВАНОВ МАКСИМ ОЛЕКСАНДРОВИЧ**
вул. Металістів, 5, к. 6-14, м. Київ, 02034 (UA)
- ДВОЙНОС ЯРОСЛАВ ГРИГОРОВИЧ**
вул. М. Амосова, 14, кв. 7, м. Київ, 03038 (UA)
- (54) **КОНТАКТНИЙ ЕЛЕМЕНТ КОВПАЧКОВОЇ ТАРІЛКИ МАСООБМІННОГО АПАРАТА**
- (57) Контактний елемент ковпачкової тарілки масообмінного апарата, що містить паровий патрубок, ковпачок, розрізне кільце, затискач, який **відрізняється** тим, що паровий патрубок має нижній і верхній зовнішній та внутрішній бурти, зверху на патрубок виконано паз шириною 2/3 (0,66) від зовнішнього діаметра нижнього бурта затискача і глибиною на 2...3 мм менше ніж відстань між верхньою кромкою прорізи у ковпачку та його дном, а затискач виконано у вигляді циліндра з буртами по краях, причому нижній борт зрізаний з двох сторін до діаметра циліндричної частини, а паровий патрубок фіксується на тарілці розрізним кільцем.

В 03

- (11) **147691** (51) МПК
B03D 1/14 (2006.01)
C12M 1/09 (2006.01)
- (21) **и 2021 00597** (22) **12.02.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Іванченко Анна Володимирівна (UA), Хавікова Каріна Євгенівна (UA)
- (73) **ДНІПРОВСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ**
вул. Дніпробудівська, 2, м. Кам'янське, Дніпропетровська обл., 51918 (UA)
- (54) **ФЛОТАТОР**
- (57) Флотатор, що містить циліндричний корпус з днищем, центральною флотаційною камерою, впускною і зливною трубами, встановленим з можливістю обертання скребком із щонайменше однією лопаттю, приймальним карманом, який виконано кільцевим ззовні циліндричного корпусу і трубою для відведення пінної маси, який **відрізняється** тим, що в центральній флотаційній камері розміщена розділова пере-

городка, яка відокремлює від неї камеру сепарації, в якій на виході із центральної флотаційної камери встановлений розподільник потоку, примикаючий до верхньої частини розділової перегородки і виконаний в вигляді блока прямокутних каналів, закритого зверху обмежувальною пластиною, при цьому флотаційна камера має вхідний патрубок, оснащений дозатором для подачі адсорбента, і вихідний трубопровід з регулюючим клапаном для відведення осаду, в днищі флотаційної камери встановлений нагнітач повітря, а днище камери сепарації має зливний карман, в якому встановлена гребінчаста перегородка з утворенням вільного простору між нею і стінкою камери сепарації.

В 04

- (11) **147710** (51) МПК
B04C 5/085 (2006.01)
- (21) **и 2021 01989** (22) **15.04.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Кущенко Сергій Миколайович (UA), Липицький Станіслав Григорович (UA)
- (73) **КУЩЕНКО СЕРГІЙ МИКОЛАЙОВИЧ**
вул. Бригадна, 11, кв. 55, м. Дніпро, 49005 (UA)
- ЛИПИЦЬКИЙ СТАНІСЛАВ ГРИГОРОВИЧ**
просп. Гагаріна, 7, кв. 11, м. Дніпро, 49005 (UA)
- (54) **ГІДРОЦИКЛОН**
- (57) 1. Гідроциклон, що містить секційний корпус (1), який складається з циліндричної (2) і конічної (3) частин (2, 3), циліндрична частина (2) якого має вхідний (4) і зливний (5) патрубки (4, 5), конічна частина (3) має піскову насадку (6), при цьому всередині кожної секції секційного корпусу (1) розміщена зносостійка футерівка (7), який **відрізняється** тим, що висота Нзп зливного патрубка (5) і висота Нцч циліндричної частини (2) виконані у наступному співвідношенні:

$$Нзп = Нцч \cdot K1, (1)$$
де: Нзп - висота зливного патрубка (5);
Нцч - висота циліндричної частини (2);
K1 - коефіцієнт пропорційності; $K1 = 1,10 - 0,52$.
2. Гідроциклон за п. 1, який **відрізняється** тим, що висота Нкч конічної частини (3) і висота Нцч циліндричної частини (2) виконані у наступному співвідношенні:

$$Нкч = Нцч \cdot K2, (2)$$
де: Нкч - висота конічної частини (3);
Нцч - висота циліндричної частини (2);
K2 - коефіцієнт пропорційності; $K2 = 1,10 - 3,60$.
3. Гідроциклон за будь-яким з пп. 1, 2, який **відрізняється** тим, що діаметр Дцч циліндричної частини (2) і діаметр Дпн верхньої частини піскової насадки (6) виконані у наступному співвідношенні:

$$Дцч = Дпн \cdot K3, (3)$$
де: Дцч - діаметр циліндричної частини (2);
Дпн - діаметр верхньої частини піскової насадки (6);
K3 - коефіцієнт пропорційності; $K3 = 3,15 - 5,95$.

B 21

- (11) **147658** (51) МПК
B21D 26/12 (2006.01)
B21D 26/021 (2011.01)
- (21) **и 2020 07962** (22) **14.12.2020**
(24) **03.06.2021**
- (72) Косенков Віктор Михайлович (UA), Тищенко Федір Миколайович (UA), Коломійцева Любов Павлівна (UA)
- (73) **ІНСТИТУТ ІМПУЛЬСНИХ ПРОЦЕСІВ І ТЕХНОЛОГІЙ НАН УКРАЇНИ**
пр. Богоявленський, 43-а, м. Миколаїв, 54018 (UA)
- (54) **СПОСІБ ЕЛЕКТРОГІДРАВЛІЧНОГО ШТАМПУВАННЯ ДЕТАЛЕЙ ПОДОВЖЕНОЇ КОРОБЧАСТОЇ ФОРМИ**
- (57) Спосіб електрогідравлічного штампування деталей подовженої коробчастої форми, який включає первинне деформування листової заготовки та її остаточне формоутворення імпульсними хвилями тиску, що генерують електричні розряди в розрядній камері з заданими напругою та індуктивністю розрядного контуру генератора імпульсних струмів, та здійснюють - первинне деформування заготовки при попередньому розміщенні в матриці гумового вкладиша, а остаточне формоутворення - при видаленні гумового вкладиша з матриці, який **відрізняється** тим, що електричні розряди здійснюють при введенні до розрядного контуру генератора імпульсних струмів котушки індуктивності, індуктивність якої складає величину від 70 до 100 мкГн.

$f(\sigma_{\text{пик}})$ - закон падіння пікових напруг $\sigma_{\text{пик}}$ на довжині $6 \div 7$ мм від поверхні вглиб ролика з подальшим їх зниженням,

при цьому ширина западини B визначена виразом:

$$B \geq (2,0 - 2,7) \cdot P,$$

а відстань між западинами $S -$:

$$S \geq (0,10 - 0,20) \cdot D_n.$$

B 23

- (11) **147675** (51) МПК
B23K 9/04 (2006.01)
B23K 101/00 (2006.01)
- (21) **и 2021 00010** (22) **04.01.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Перемітько Валерій Вікторович (UA), Коломоєць Ігор Вадимович (UA)
- (73) **ДНІПРОВСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ**
вул. Дніпробудівська, 2, м. Кам'янське, Дніпропетровська обл., 51918 (UA)
- (54) **СПОСІБ ЕЛЕКТРОДУГОВОГО НАПЛАВЛЕННЯ**
- (57) Спосіб електродугового наплавлення, що включає попереднє нанесення на контактну поверхню деталі валиків із суміші карбіду титану та ґрунтової, ширину та відстань між валиками вибирають за умови розташування електрода зі зміщенням відносно краю валиків, при цьому ширина A валиків покриття становить $0,6-0,8$ відстані B між ними, а ширина C комбінованих шарів, що наплавляють, знаходиться у межах $1,1 \cdot (A+B) - 1,3 \cdot (A+B)$, який **відрізняється** тим, що валики наносять перпендикулярно до напрямку руху деталі в процесі її експлуатації.

B 22

- (11) **147643** (51) МПК
B22D 11/08 (2006.01)
- (21) **и 2020 03801** (22) **24.06.2020**
(24) **03.06.2021**
- (72) Лещинський Леонід Кимович (UA), Іванов Віталій Петрович (UA)
- (73) **ДЕРЖАВНИЙ ВИЩИЙ НАВЧАЛЬНИЙ ЗАКЛАД "ПРИАЗОВСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ"**
вул. Університетська, 7, м. Маріуполь, Донецька обл., 87555 (UA)
- (54) **РОЛИК МАШИНИ БЕЗПЕРЕРВНОГО ЛИТТЯ ЗАГОТОВОК**
- (57) Ролик машини безперервного лиття заготовок, що містить бочку з наплавленим робочим шаром, утвореним виступами, що чергуються з западинами, який **відрізняється** тим, що висота виступів, ширина западин і відстань між ними і визначені з виразу:

$$P \geq f(\sigma_{\text{пик}}) \cdot D_n,$$

де P - різниця рівнів виступів і западин;

D_n - діаметр ролика;

B 24

- (11) **147685** (51) МПК
B24B 31/02 (2006.01)
B24B 31/027 (2006.01)
- (21) **и 2021 00422** (22) **04.02.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Фролов Володимир Костянтинович (UA), Юренко Сергій Юрійович (UA), Лапковський Сергій Вікторович (UA), Ткач Ігор Ігорович (UA), Лашина Юлія Вікторівна (UA), Гладський Максим Миколайович (UA), Яновський Валерій Анатолійович (UA), Барандич Катерина Сергіївна (UA)
- (73) **ФРОЛОВ ВОЛОДИМИР КОСТЯНТИНОВИЧ**
Оболонський пр., 12-А, кв. 204, м. Київ, 04205 (UA)
- ЮРЕНКО СЕРГІЙ ЮРІЙОВИЧ**
вул. Воїнів-Інтернаціоналістів, 5, кв. 7, м. Кременчук, Полтавська обл., 39600 (UA)

ЛАПКОВСЬКИЙ СЕРГІЙ ВІКТОРОВИЧ
вул. Шовковична, 13/2, кв. 81, м. Київ, 01021 (UA)

ТКАЧ ІГОР ІГОРОВИЧ
вул. Борщагівська, 144, м. Київ, 03056 (UA)

ЛАШИНА ЮЛІЯ ВІКТОРІВНА
вул. Автозаводська, 89-а, кв. 60, м. Київ, 04114 (UA)

ГЛАДСЬКИЙ МАКСИМ МИКОЛАЙОВИЧ
вул. Чехова, 7Б, кв. 9, м. Ірпінь, Київська обл., 08201 (UA)

ЯНОВСЬКИЙ ВАЛЕРІЙ АНАТОЛІЙОВИЧ
вул. Вітрука, 33, кв. 63, м. Житомир, 10009 (UA)

БАРАНДИЧ КАТЕРИНА СЕРГІЇВНА
вул. Братчикова, 66, м. Корюківка, Чернігівська обл., 15300 (UA)

(54) УСТАНОВКА ДЛЯ ГАЛТУВАННЯ

(57) Установа для галтування, що містить барабан з цапфами та привод, яка **відрізняється** тим, що привод складається з пасової передачі та кривошипно-повзунного механізму, а барабан підпружинений в осьовому напрямку і зв'язаний цапфою з повзуном кривошипно-повзунного механізму та, через рухоме шліцьове з'єднання, з веденим шківом пасової передачі.

(57) Галтувальна машина, що містить барабан з цапфами та привод, яка **відрізняється** тим, що привод складається з двох паралельно розташованих пасових передач, ведені шківів яких зв'язані з цапфами барабана шарнірами Гука, причому ведений шків першої пасової передачі зв'язаний з однією із цапф барабана безпосередньо, а ведений шків другої пасової передачі зв'язаний з іншою цапфою барабана через кривошип.

B 27

(11) 147704 **(51)** МПК (2021.01)
B27L 1/00

(21) u 2021 00907 **(22) 25.02.2021**
(24) 03.06.2021

(72) Лихочвор Павло Володимирович (UA)
(73) ЛИХОЧВОР ПАВЛО ВОЛОДИМИРОВИЧ

вул. Генерала Тупикова, буд. 4, кв. 2, м. Київ, 03067, Україна (UA)

(54) СТІНОВА ПАНЕЛЬ (МОДУЛЬНА)

(57) 1. Стінова панель (модульна), будь-якого призначення, що містить багат шарову структуру, переважно три і більше шарів, яка **відрізняється** тим, що утворена щонайменше шаром з деревини, яку клеять під тиском та кутом 90 градусів до наступного шару, також із деревини, але спрямованої волокнами до наступного шару, та де розмір та модульність панелей підбирають під конкретний проект або завдання.
2. Стінова панель за п. 1, яка **відрізняється** тим, що кінцеві частини кожного з елементів панелі містять систему паз-шип для надійного з'єднання між собою самих стінових панелей.
3. Стінова панель за п. 1, яка **відрізняється** тим, що елементи панелі з можливістю товщини від 60 до 240 мм, переважно до 200 мм.
4. Стінова панель за п. 1, яка **відрізняється** тим, що модульні зони мають симетричне розташування відносно середньої осі панелі.
5. Стінова панель за п. 1, яка **відрізняється** тим, що внутрішній шар виконано з деревини, волокна якої розташовані під кутом до волокон деревини зовнішніх шарів.
6. Стінова панель за п. 1, яка **відрізняється** тим, що середній шар, для створення якого використовують деревину відповідної ширини, набирають з декількох шарів, чергуючи направлення волокон деревини між собою.
7. Стінова панель за п. 1, яка **відрізняється** тим, що виготовлення стінової панелі включає наступні послідовні стадії:
підготовка та обрізання деревини для отримання бруса необхідного розміру;
стругання дошки для досягнення технічних параметрів виробу;
склеювання зовнішніх шарів за принципом меблевого щита для досягнення необхідної ширини виробу;
склеювання внутрішнього шару для забезпечення необхідної товщини виробу;
склеювання зовнішніх шарів з внутрішнім шаром;

(11) 147699 **(51)** МПК
B24B 31/02 (2006.01)
B24B 31/023 (2006.01)

(21) u 2021 00732 **(22) 18.02.2021**
(24) 03.06.2021

(72) Фролов Володимир Костянтинович (UA), Юренко Сергій Юрійович (UA), Лапковський Сергій Вікторович (UA), Яновський Валерій Анатолійович (UA), Гладський Максим Миколайович (UA), Лашина Юлія Вікторівна (UA), Ткач Ігор Ігорович (UA), Барандич Катерина Сергіївна (UA)

(73) ФРОЛОВ ВОЛОДИМИР КОСТЯНТИНОВИЧ
Оболонський пр., 12-А, кв. 204, м. Київ, 04205 (UA)

ЮРЕНКО СЕРГІЙ ЮРІЙОВИЧ
вул. Воїнів-Інтернаціоналістів, 5, кв. 7, м. Кременчук, Полтавська обл., 39600 (UA)

ЛАПКОВСЬКИЙ СЕРГІЙ ВІКТОРОВИЧ
вул. Шовковична, 13/2, кв. 81, м. Київ, 01021 (UA)

ЯНОВСЬКИЙ ВАЛЕРІЙ АНАТОЛІЙОВИЧ
вул. Вітрука, 33, кв. 63, м. Житомир, 10009 (UA)

ГЛАДСЬКИЙ МАКСИМ МИКОЛАЙОВИЧ
вул. Чехова, 7-б, кв. 9, м. Ірпінь, Київська обл., 08201 (UA)

ЛАШИНА ЮЛІЯ ВІКТОРІВНА
вул. Автозаводська, 89-а, кв. 60, м. Київ, 04114 (UA)

ТКАЧ ІГОР ІГОРОВИЧ
вул. Борщагівська, 144, м. Київ, 03056 (UA)

БАРАНДИЧ КАТЕРИНА СЕРГІЇВНА
вул. Братчикова, 66, м. Корюківка, Чернігівська обл., 15300 (UA)

(54) ГАЛТУВАЛЬНА МАШИНА

формування елементів шип-паз для досягнення модульності у виробі;
пакування продукції у відповідності до вимог споживача.

В 29

- (11) **147700** (51) МПК (2021.01)
B29C 64/10 (2017.01)
B33Y 10/00
- (21) **и 2021 00800** (22) **22.02.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Мікульонюк Ігор Олегович (UA), Карвацький Антон Янович (UA), Лелека Сергій Володимирович (UA), Соловей Владислав Володимирович (UA)
- (73) **МІКУЛЬОНЮК ІГОР ОЛЕГОВИЧ**
вул. Райдужна, 10, кв. 137, м. Київ-223, 02223 (UA)
КАРВАЦЬКИЙ АНТОН ЯНОВИЧ
вул. Грибоєдова, 20, м. Ірпінь, Київська обл., 08200 (UA)
ЛЕЛЕКА СЕРГІЙ ВОЛОДИМИРОВИЧ
бул. Б. Хмельницького, 6, кв. 140, м. Буча, Київська обл., 08292 (UA)
СОЛОВЕЙ ВЛАДИСЛАВ ВОЛОДИМИРОВИЧ
вул. Гетьмана Сагайдачного, 56, смт Доманівка, Миколаївська обл., 56401 (UA)
- (54) **СПОСІБ ТРИВИМІРНОГО ДРУКУ ВИРОБІВ**
- (57) Спосіб тривимірного друку виробів, виготовлених з матеріалу на основі зв'язуючого й наповнювача, за якого зв'язуюче переводять у в'язкотекучий стан, змішують з наповнювачем, після чого одержану суміш друкують за допомогою 3D-принтера, який **відрізняється** тим, що під час друку суміші зв'язуючого й наповнювача їхнє співвідношення в суміші та/або параметри частинок наповнювача, та/або параметри зв'язуючого змінюють, залежно від друкованого елемента одержуваного виробу, для надання йому потрібних властивостей.

В 60

- (11) **147682** (51) МПК (2021.01)
B60B 9/00
B60B 9/24 (2006.01)
- (21) **и 2021 00323** (22) **28.01.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Чернета Олег Георгійович (UA), Авер'янов Володимир Сергійович (UA), Сасов Олександр Олександрович (UA), Кубіч Вадим Іванович (UA), Стасевич Олег Олегович (UA)
- (73) **ДНІПРОВСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ**
вул. Дніпробудівська, 2, м. Кам'янське, Дніпропетровська обл., 51918 (UA)
- (54) **КОЛЕСО ТРАНСПОРТНОГО ЗАСОБУ**

- (57) Колесо транспортного засобу, що містить маточину, ресивер, утворений циліндричною маточиною, внутрішня порожнина якої з одного торця закрита диском, та встановлений на порожнистому валу, диск, закріплений на ньому обід із шиною у вигляді розміщених рівномірно по колу гумових елементів, встановлених з зазором, повітроводи з впускними та випускними клапанами, у просторі між ободом та шиною рівномірно розміщені штовхачі у вигляді притискних п'ятаків Т-подібного поперечного перерізу і встановлені з можливістю зворотно-поступального руху в циліндрах, які розташовані усередині по колу обода колеса, яке **відрізняється** тим, що на диску жорстко закріплений вивідний патрубок, на якому шарнірно закріплені два пневматичні циліндри, з'єднані між собою гнучкими повітроводами, а гумові елементи виконані у вигляді об'ємних порожнистих тіл, розділених поперечною перегородкою на дві частини, усередині яких розміщені штовхачі, які виконані роз'ємними, при цьому циліндричні стрижні штовхачів мають різьбу для з'єднання з притискними п'ятаками, які розташовані у зовнішніх частинах об'ємних порожнистих тіл, а циліндричні стрижні через отвори в поперечній перегородці розміщені у їх внутрішніх частинах.

В 61

- (11) **147666** (51) МПК (2021.01)
B61B 7/00
- (21) **и 2020 08280** (22) **24.12.2020**
(24) **03.06.2021**
- (72) Філіппенко Андрій Борисович (UA)
- (73) **ФІЛІППЕНКО АНДРІЙ БОРИСОВИЧ**
вул. Патона, 4, кв. 1, м. Дніпро, 49006 (UA)
- (54) **СПОСІБ ПОВЕРНЕННЯ КОРИСТУВАЧА ЗІПЛАЙН У ТОЧКУ СТАРТУ**
- (57) Спосіб повернення користувача Зіплайн у точку старту, при якому повернення здійснюють по єдиному тросу, який **відрізняється** тим, що розгін та гальмування користувача Зіплайн під час руху та керування швидкістю руху користувача здійснюють шляхом регулювання натягу та провису троса з подальшим поверненням його назад від точки фінішу у точку старту.

В 64

- (11) **147647** (51) МПК
B64C 27/08 (2006.01)
F41H 11/12 (2011.01)
- (21) **и 2020 06033** (22) **21.09.2020**
(24) **03.06.2021**
- (72) Боровий Ярослав Анатолійович (UA), Андреев Олександр Анатолійович (UA), Борова Валентина Євгенівна (UA), Віднічук Микола Антонович (UA), Кректун Іван Андрійович (UA)

(73) ОБЛАСНИЙ КОМУНАЛЬНИЙ ПОЗАШКІЛЬНИЙ НАВЧАЛЬНИЙ ЗАКЛАД "РІВНЕНСЬКА МАЛА АКАДЕМІЯ НАУК УЧНІВСЬКОЇ МОЛОДІ" РІВНЕНСЬКОЇ ОБЛАСНОЇ РАДИ РМАНУМ

вул. С. Петлюри, 17, м. Рівне, 33028 (UA)

(54) САПЕРНИЙ АЕРОКОПТЕР ДЛЯ ЛІКВІДАЦІЇ РОЗТЯЖОК ПІХОТНИХ МІН ТА ЇХ ЗНЕШКОДЖЕННЯ

(57) Саперний аерокopter для ліквідації розтяжок піхотних мін та їх знешкодження, що містить раму, електромотори з гвинтами, виконавчий блок управління, апаратуру управління польотом, відеокамеру, закріплений на ньому транспортний відсік, в якому розташований і зафіксований вантаж з можливістю керованого виходу з нього, який **відрізняється** тим, що вантаж виконаний у вигляді грузила, яке з'єднане з шнуром, на якому по довжині закріплені кішки, їхня робоча поверхня виконана пілоподібною, окрім того, шнур у районі кріплення його до грузила оснащений пружною вставкою, довжина якої менша довжини відрізка шнура, до якого вона прикріплена.

(11) 147673

(51) МПК (2021.01)
B64G 1/56 (2006.01)
B64G 1/54 (2006.01)
G01J 4/00

(21) u 2020 08524
(24) 03.06.2021

(22) 31.12.2020

(72) Шевчук Анатолій Іванович (UA)

(73) ШЕВЧУК АНАТОЛІЙ ІВАНОВИЧ

вул. Вербник, 152, кв. 12, м. Рахів, Закарпатська обл., 90600 (UA)

(54) СПОСІБ ЕКРАНІЗУВАННЯ ПЛАНЕТИ ЗЕМЛЯ І/АБО ПЛАНЕТИ ЗЕМНОЇ ГРУПИ

(57) 1. Спосіб екранізування планети Земля і/або планети земної групи космічним екраном, що утримують на орбіті двигунами, який **відрізняється** тим, що використовують такі екрани: магнітно-плазмовий щит, яким відхиляють потоки радіації ("сонячного вітру") і який утворюють магнітним полем за допомогою генератора і/або надпровідної магнітної котушки, та електронний екран, яким відбивають (розсіюють) падаюче видиме світло і утворюють у формі сектора чи іншої форми шляхом переміщення променя магнітною відхиляючою системою електронної гармати та який прискорюють електричним полем з високою різницею потенціалів між катодом і анодом, одночасно збільшують щільність енергії в промені після виходу з анода шляхом фокусування електронів магнітним полем у магнітній лінзі і/або нейтронним екраном, яким відбивають (розсіюють) падаюче видиме світло та утворюють швидкими нейтронами з активної зони ядерного реактора, одночасно напрям руху, яким задають через отвори в радіально направлених трубах, що вмонтовують в берилієвий торцевий відбивач, при цьому забезпечують регуляцію прозорості екрана для видимого світла, відповідно до величини температури поверхні Землі і/або планети земної групи, шляхом здійснення періодичної чи синхронної генерації електронної гармати і/або застосування блока сповільнювача реактора, при цьому утвореним екраном керують за допомогою комп'ютерних програм і/або штучного інтелекту та утримують на похилій і/або полярній орбіті двигунами і/або сонячними парусами, при цьому екран встановлюють під відповідним кутом до напрямку видимого світла і сонячного вітру та відносно помірного чи іншого кліматичного поясу нічного і/або денного боку Землі і/або планети земної групи, живлення екрана здійснюють за допомогою сонячних чи інших джерел.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що додатково розміщують екрани секторної чи іншої форми для забезпечення можливості освітленості всієї чи частини помірного чи іншого кліматичного поясу нічного і/або денного боку Землі і/або планети земної групи.

3. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що додатково розміщують екрани секторні чи іншої форми для забезпечення можливості екранізування всієї чи частини освітленої поверхні Землі і/або планети земної групи, і/або всієї чи частини екваторіальної і/або тропічної зони.

4. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що додатково розміщують створювані екрани у шаховому чи іншому порядку.

5. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що екран розміщують на гало-орбіті чи орбіті Ліссажу, навколо точок Лагранжа L4 чи L5 системи Земля-Місяць.

6. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що екран розміщують на гало-орбіті чи орбіті Ліссажу, чи навколо точок Лагранжа L1 чи L2 системи Земля-Місяць, і/або орбіті Ліссажу чи близько точки Лагранжа L2 системи Земля - Сонце.

9. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що екран розміщують на гало-орбіті чи орбіті Ліссажу, навколо точки Лагранжа L1 чи в точці L1 системи Земля - Сонце і/або планети земної групи - Сонце.

11. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що екран розміщують на висячій і/або еліптичній орбіті Землі, і/або планети земної групи.

12. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що екран встановлюють перпендикулярно до напрямку видимого світла над екваторіальною і/або тропічною зоною Землі і/або планети земної групи.

13. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що екран встановлюють під кутом 45 градусів до напрямку видимого світла відносно помірного чи іншого кліматичного поясу нічного і/або денного боку Землі і/або планети земної групи для додаткового забезпечення її удвічі більшою кількістю сонячного випромінювання для потреб Землі і/або планети земної групи і її сонячної енергетики.

14. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що екран утворюють у формі круга чи іншої форми.

B 65

(11) 147672

(51) МПК (2021.01)
B65G 23/00
F16H 57/04 (2010.01)

(21) u 2020 08450
(24) 03.06.2021

(22) 29.12.2020

(72) Лавинський Андрій Володимирович (UA), Ограпіш-
вілі Георгій Вахтангович (UA)

(73) **ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІ-
СТЮ "КОРУМ ГРУП"**

вул. Магнітогорська, 1 А, м. Київ, 02122 (UA)

(54) **ПРИВОДНИЙ БЛОК КОНВЕЄРА**

(57) Приводний блок конвеєра, в якому редуктор (1) кі-
нематично пов'язаний з редукторною приставкою
(3), корпус (4) якої закріплено на корпусі (2) редук-
тора (1) і виконаний, з боку горизонтального вхідно-
го вала (5) редукторної приставки (3), з торцевим
фланцем (6), на якому жорстко закріплений труб-
частий захисний кожух (7) муфти (9), співвісно пов'я-
заної з одного боку з горизонтальним вхідним валом
(5) редукторної приставки (3), а з іншого боку - з ва-
лом (11) електродвигуна (10), який консольно закрі-
плений на трубчастому захисному кожусі (7) муфти
(9), порожнина якого пов'язана з зовнішнім середо-
вищем через його бічні вентиляційні вікна (8), а так
само через виконане з торця в корпусі (4) редуктор-
ної приставки (3) щонайменше одне вертикальне вен-

тиляційне вікно (12), габарити якого обмежені стін-
ками (17) корпусу (4) редукторної приставки (3) і ча-
стиною торцевого фланця (6), на якому жорстко за-
кріплений трубчастий захисний кожух (7) муфти (9),
який **відрізняється** тим, що в приводний блок до-
датково введено вентиляторне колесо (14), яке вста-
новлено на горизонтальному вхідному валу (5) редук-
торної приставки (3) і розміщено в порожнині труб-
частого захисного кожуха (7) муфти (9), при цьому
лопаті (15) вентиляторного колеса (14) розміщені
перед вертикальним вентиляційним вікном (12), ви-
конаним з торця в корпусі (4) редукторної приставки
(3), а так само перед повітряною камерою (16) що-
найменше одного вентиляційного каналу (13), вико-
наного в тілі корпусу (4) редукторної приставки (3), з
можливістю виведення повітряного потоку назовні
корпусу (4) редукторної приставки (3) з порожнини
трубчастого захисного кожуха (7) муфти (9).

Розділ С:**Хімія. Металургія****С 02**

- (11) **147656** (51) МПК
C02F 1/28 (2006.01)
C02F 1/42 (2006.01)
C02F 1/66 (2006.01)
C02F 1/70 (2006.01)
- (21) **и 2020 07846** (22) **08.12.2020**
(24) **03.06.2021**
(72) **Покотило Олег Степанович (UA)**
(73) **ПОКОТИЛО ОЛЕГ СТЕПАНОВИЧ**
провулок Лесі Українки, буд. 5, с. Староміщина,
Підволочиський р-н, Тернопільська обл., 47834
(UA)
- (54) **ПРИСТРІЙ ДЛЯ ОТРИМАННЯ КАТОЛІТНОЇ ВОДИ**
З ВІД'ЄМНИМ ОКИСНО-ВІДНОВНИМ ПОТЕН-
ЦІАЛОМ ЧЕРЕЗ НАСИЧЕННЯ ЇЇ ВОДНЕМ
- (57) 1. Пристрій для отримання католітної води з від'ємним окисно-відновним потенціалом через насичення її воднем, що містить посудину з воднегенеруючим елементом, який **відрізняється** тим, що як воднегенеруючий елемент використовується суцільний стрижень із магнієвого сплаву.
2. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що суцільний стрижень із магнієвого сплаву вмонтовується в корок, яким закорковується посудина, яка містить воду, призначену для підготовки.
3. Пристрій за п. 1 або п. 2, який **відрізняється** тим, що посудина, яка містить воду, призначену для підготовки, має подвійні стінки, між якими знаходиться герметична порожнина з низьким коефіцієнтом теплопровідності.

С 05

- (11) **147667** (51) МПК (2021.01)
C05F 11/00
A01K 67/033 (2006.01)
- (21) **и 2020 08310** (22) **24.12.2020**
(24) **03.06.2021**
(72) **Мухач Сергій Вікторович (UA)**
(73) **МУХАЧ СЕРГІЙ ВІКТОРОВИЧ**
вул. Буденного, 1, кв. 57, м. Кривий Ріг, Дніпро-
петровська обл., 50065 (UA)
- (54) **СПОСІБ ОТРИМАННЯ ОРГАНІЧНОГО ДОБРИВА**
- (57) Спосіб отримання органічного добрива шляхом виділення відходів життєдіяльності комах в процесі циклічного вирощування їх виплоду, що включає операції підготовки та розміщення відібраного виду комах і субстрату на піддоні в контейнері, створення оптимальних умов для їх проживання та розвитку, виділення яєць в процесі яйцекладки відібраним ви-

дом комах, з подальшим вирощуванням личинок, лялечок і дорослих особин комах для введення в процес циклічного вирощування їх виплоду із відділенням відходів в процесі їх життєдіяльності, які використовують як добриво, який **відрізняється** тим, що як відібраних комах для отримання органічного добрива використовують фертильних особин борошняних хрущів, при цьому субстрат і фертильних особин борошняних хрущів розміщують в контейнері на окремих один під іншим піддонах, а фертильних особин борошняних хрущів розміщують на окремий піддон для кладки яєць, виконаний у вигляді сита з можливістю просіювання відкладених ними яєць на нижній піддон з субстратом.

С 12

- (11) **147693** (51) МПК (2021.01)
C12H 1/00
- (21) **и 2021 00638** (22) **15.02.2021**
(24) **03.06.2021**
(72) **Волков Ігор Сергійович (UA), Воїнова Світлана Олександрівна (UA), Світій Іван Миколайович (UA)**
(73) **ВОЛКОВ ІГОР СЕРГІЙОВИЧ**
вул. Мала Арнаутська, 25, кв. 9, м. Одеса, 65012
(UA)
ВОІНОВА СВІТЛАНА ОЛЕКСАНДРІВНА
вул. Транспортна, 8, кв. 17, м. Одеса, 65039 (UA)
СВІТІЙ ІВАН МИКОЛАЙОВИЧ
вул. Центральний Аеропорт, 15, кв. 88, м. О-
деса, 65036 (UA)
- (54) **СПОСІБ АВТОМАТИЧНОГО КЕРУВАННЯ ПАСТЕ-**
РИЗАЦІЄЮ ШАМΠΑНСЬКОГО В ТУНЕЛЬНОМУ
ПАСТЕРИЗАТОРІ
- (57) Спосіб автоматичного керування пастеризацією шампанського в тунельному пастеризаторі, який включає регулювання температури холодної води зміною подачі холодоагенту, регулювання температури гарячої води зміною подачі пари, який **відрізняється** тим, що додатково вихідний сигнал регулятора температури гарячої води перетворюють та, підсумовуючи з поточним та заданим значеннями температури холодної води, подають на вхід регулятора температури холодної води, причому перетворення здійснюють таким чином, щоб зміни витрат пари не впливали на температуру холодної води.

С 21

- (11) **147653** (51) МПК (2021.01)
C21C 5/00
C21C 5/28 (2006.01)
- (21) **и 2020 07568** (22) **27.11.2020**
(24) **03.06.2021**

- (73) **БРОДСЬКИЙ ОЛЕКСАНДР СЕРГІЙОВИЧ**
просп. Свободи, 49, пом. 64, м. Кам'янське,
Дніпропетровська обл., 51900 (UA)
ЛЯЩЕНКО ВІТАЛІЙ ФЕДОРОВИЧ
пров. Молодіжний, 1, смт Завалля, Гайворонсь-
кий р-н, Кіровоградська обл., 26334 (UA)
ХЕЙСОН ОЛЕГ ЮРІЙОВИЧ
вул. Благівісна, 174, кв. 12, м. Черкаси, 18002
(UA)
- (54) **СПОСІБ ВИГОТОВЛЕННЯ ФЛЮСУ ДЛЯ ВИПЛАВ-
КИ СТАЛІ**
- (57) Спосіб виготовлення флюсу для виплавки сталі,
при якому здійснюють подрібнення, сортування,
класифікацію (за крупністю гранул) та обволікання у
водному середовищі складових флюсу, що містять
оксид кальцію, оксид магнію, оксид кремнію, оксид
заліза, оксид алюмінію, та їх прожарювання, який
відрізняється тим, що додатково включає викори-
стання оксиду марганцю, при наступному співвідно-
шенні компонентів готового флюсу, мас. %: оксид
кальцію 28-32, оксид магнію 16-19, оксид кремнію 8-
16, оксид заліза 1-5, оксид алюмінію 1-3, оксид мар-
ганцю 0,5-1,5, волога 2-5, при цьому прожарювання
здійснюють з втратами 22,5-40,5 мас. %.

C 23

- (11) **147660** (51) МПК
C23C 4/131 (2016.01)
- (21) **u 2020 08115** (22) **18.12.2020**
(24) **03.06.2021**
- (72) Скобло Тамара Семенівна (UA), Нанка Олександр
Володимирович (UA), Рибалко Іван Миколайович
(UA), Сайчук Олександр Васильович (UA), Тіхонов
Олександр Всеволодович (UA), Сатановський Єв-
ген Абрамович (UA), Олейник Олександр Куприя-
нович (UA), Захаров Андрій Вадимович (UA)
- (73) **СКОБЛО ТАМАРА СЕМЕНІВНА**
вул. Кооперативна, 13/2, кв. 52, м. Харків-3, 61003
(UA)
- (54) **СПОСІБ ПІДВИЩЕННЯ ЯКОСТІ ТА ЕКСПЛУАТА-
ЦІЙНОЇ СТІЙКОСТІ ВІДНОВЛЮЮЧИХ ПОКРИТ-
ТІВ ЇХ МОДИФІКУВАННЯМ МАЛОВИТРАТНОЮ
ДОМІШКОЮ**
- (57) 1. Спосіб підвищення якості та експлуатаційної стій-
кості відновлюючих покриттів, що включає модифі-
кування покриттів зношених деталей методом елек-
тродугового наплавлення, який **відрізняється** тим,
що як зміцнюючу модифікуючу домішку використо-
вують природну речовину - бентонітову глину.
2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що вико-
ристовують бентонітову глину, яка складається пе-
реважно з компонентів, мас. %: до 1,8 Fe; 0,3 K; 0,2
Ca; 0,08 S; 0,4 Mn; 55,0 Si; 33,0 Al; 0,4 Na; 0,3 Mg, та
вводять таку домішку шляхом нанесення її на елек-
трод в кількості 5-7 % від його частки.

- (11) **147703** (51) МПК
C23G 1/02 (2006.01)

- (21) **u 2021 00891** (22) **25.02.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Чумаченко Петро Володимирович (UA), Подзолкова
Зінаїда Григорівна (UA), Коціло Валентина Олек-
сандрівна (UA), Жупінова Світлана Іванівна (UA)
- (73) **ПУБЛІЧНЕ АКЦІОНЕРНЕ ТОВАРИСТВО "МОТОР
СІЧ"**
проспект Моторобудівників, 15, м. Запоріжжя,
69068 (UA)
- (54) **СПОСІБ ВИДАЛЕННЯ ПРОДУКТІВ АНОДНОЇ ОБ-
РОБКИ (ОСВІТЛЕННЯ) ПІСЛЯ ОПЕРАЦІЇ ЕЛЕК-
ТРОПОЛІРУВАННЯ**
- (57) Спосіб видалення продуктів анодної обробки (освіт-
лення) шляхом обробки деталі у розчині, що вклю-
чає азотну кислоту та фтористоводневу кислоту, який
відрізняється тим, що деталі витримують в розчині
протягом 30-60 секунд, а розчин має наступне спів-
відношення інгредієнтів, на 1 літр:
HF (щільність ρ - 1,12 кг/л, концентрація 40 %) 15-20
мл/л,
HNO₃ (щільність ρ - 1,34 кг/л, концентрація 56 %) 15-20
мл/л,
решта.

C 25

- (11) **147669** (51) МПК
C25D 11/02 (2006.01)
- (21) **u 2020 08374** (22) **28.12.2020**
(24) **03.06.2021**
- (72) Пилипенко Олексій Іванович (UA)
- (73) **НАЦІОНАЛЬНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ "ХАР-
КІВСЬКИЙ ПОЛІТЕХНІЧНИЙ ІНСТИТУТ"**
вул. Кирпичова, 2, м. Харків, 61002 (UA)
- (54) **СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ОКСИДНОГО ПОКРИТТЯ
НА ТИТАНОВИХ СПЛАВАХ**
- (57) Спосіб одержання оксидного покриття на титанових
сплавах, який полягає у проведенні хімічного трав-
лення поверхні сплаву у суміші нітратної і фторидної
кислот за об'ємного співвідношення HNO₃:HF = 3:1 з
наступним оксидуванням у електроліті, що містить
100 г/дм³ сульфатної кислоти і 1,5 г/дм³ фторидної
кислоти, який **відрізняється** тим, що проводять ком-
біноване хімічно-електрохімічне травлення сплаву у
розчині, що містить 200-230 г/л сульфатної кислоти,
20-40 г/л фториду амонію, використовуючи наклад-
дання анодної поляризації у гальваностатичному
режимі струмом густиною 1-5 А/дм² з наступним ок-
сидуванням у органічно-водному електроліті за об'єм-
ного співвідношення C₂H₆O₂:H₂O в межах від 50:50
до 95:5 і концентрації фториду амонію 1-50 г/л.

C 30

- (11) **147678** (51) МПК (2021.01)
C30B 9/00
C30B 9/04 (2006.01)

- (21) **u 2021 00201** (22) **20.01.2021**
 (24) **03.06.2021**
 (72) Панченко Сергій Володимирович (UA), Вовк Руслан Володимирович (UA), Камчатна Світлана Миколаївна (UA), Хаджай Георгій Ярославович (UA)
 (73) **УКРАЇНСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ УНІВЕРСИТЕТ ЗАЛІЗНИЧНОГО ТРАНСПОРТУ**
 площа Фейєрбаха, 7, м. Харків-50, 61050 (UA)
 (54) **СПОСІБ ВИРОЩУВАННЯ КРИСТАЛІВ $\text{YBa}_2\text{Cu}_3\text{O}_{7-\delta}$ З РІЗНИМ СТУПЕНЕМ ВІДХИЛЕННЯ ВІД КИСНЕВОЇ СТЕХІОМЕТРІЇ**
 (57) Спосіб вирощування кристалів $\text{YBa}_2\text{Cu}_3\text{O}_{7-\delta}$ з різним ступенем відхилення від кисневої стехіометрії, що включає отримання суміші початкових компонентів (Y_2O_3 , BaCO_3 і CuO , всі марки ОСЧ взяті в атомному співвідношенні $\text{Y}:\text{Ba}:\text{Cu}=2:25:73$), декарбонізацію

шляхом відпалу при 850°C , причому для процесу гомогенізації і наступного вирощування шляхом зниження температури поміщають в золотий тигель і нагрівають в печі до температури 965°C , при цьому розплав витримують при цій температурі протягом двох годин, а потім знижують температуру із швидкістю $2^\circ\text{C}/\text{год.}$ до температури 870°C , при цьому градієнт температур уздовж тигля складає біля $3^\circ\text{C}/\text{см}$, а піч вимикають і розплав з вирощеними кристалами охолоджують до кімнатної температури, який **відрізняється** тим, що проводять додатковий відпал кристалів в атмосфері кисню або на повітрі при температурах $420\text{-}650^\circ\text{C}$ протягом від двох до трьох діб.

Розділ D:**Текстиль та папір****D 21**

3. Циліндр холодильний за п. 1 або п. 2, який **відрізняється** тим, що на отворах у стінці труби встановлені форсунки.

- (11) **147661** (51) МПК
D21F 1/60 (2006.01)
F01P 1/02 (2006.01)
- (21) **и 2020 08174** (22) **21.12.2020**
(24) **03.06.2021**
(72) Семінський Олександр Олегович (UA), Кошурніков Максим Юрійович (UA)
(73) **СЕМІНСЬКИЙ ОЛЕКСАНДР ОЛЕГОВИЧ**
вул. Чорнобильська, 9-а, кв. 114, м. Київ, 03179 (UA)
КОШУРНИКОВ МАКСИМ ЮРІЙОВИЧ
вул. Військове містечко № 11, буд. 16, кв. 58, м. Васильків, Київська обл., 08606 (UA)
(54) **ЦИЛІНДР ХОЛОДИЛЬНИЙ**
(57) 1. Циліндр холодильний, який складається з циліндричної оболонки з кільцевими діафрагмами на торцях, за які заведені патрубки, який **відрізняється** тим, оболонка закріплена на кришках, оснащених рівномірно розташованими по їх зовнішнім діаметрам прорізами, а кришки встановлені на валах, які мають канали уздовж своїх осей із заведеною у ці канали трубою з отворами у стінці.
2. Циліндр холодильний за п. 1, який **відрізняється** тим, що кришки виконані суцільними з валами.

- (11) **147659** (51) МПК (2021.01)
D21F 5/00
- (21) **и 2020 08095** (22) **17.12.2020**
(24) **03.06.2021**
(72) Семінський Олександр Олегович (UA), Кошурніков Максим Юрійович (UA), Коваленко Сергій Павлович (UA)
(73) **СЕМІНСЬКИЙ ОЛЕКСАНДР ОЛЕГОВИЧ**
вул. Чорнобильська, 9-а, кв. 114, м. Київ, 03179 (UA)
КОШУРНИКОВ МАКСИМ ЮРІЙОВИЧ
Військове містечко № 11, буд. 16, кв. 58, м. Васильків, Київська обл., 08606 (UA)
КОВАЛЕНКО СЕРГІЙ ПАВЛОВИЧ
вул. Михайла Брайчевського (Металістів), 5, кв. 913, м. Київ, 03056 (UA)
(54) **ЦИЛІНДР ХОЛОДИЛЬНИЙ**
(57) Циліндр холодильний, який складається з циліндричної оболонки з кільцевими діафрагмами на торцях, за які заведені патрубки для підведення холодної і відведення теплої води, який **відрізняється** тим, що оболонка приєднана до кришок з рівномірно розташованими по їх зовнішніх діаметрах прорізами, а кришки з'єднані з валами, які мають цапфи.

Розділ Е:

Будівництво

Е 01

- (11) **147705** (51) МПК (2021.01)
E01F 8/00
- (21) u 2021 00971 (22) 01.03.2021
(24) 03.06.2021
(72) Івановський Анатолій Олексійович (UA)
(73) **ІВАНОВСЬКИЙ АНАТОЛІЙ ОЛЕКСІЙОВИЧ**
вул. Щербакова, буд. 42, кв. 12, м. Київ, 04111 (UA)
- (54) **ШУМОЗАХИСНИЙ ЕКРАН**
- (57) 1. Шумозахисний екран, що містить стійки, в яких закріплені вертикально або з нахилом панелі з шумовідбивних і шумопоглинаючих матеріалів, який **відрізняється** тим, що щонайменше одна з шумовідбивних панелей виконана прозорою з полікарбонату.
2. Шумозахисний екран за п. 1, який **відрізняється** тим, що щонайменше одна з шумовідбивних панелей виконана з металевго листа.

Е 03

- (11) **147681** (51) МПК
E03D 9/05 (2006.01)
- (21) u 2021 00292 (22) 27.01.2021
(24) 03.06.2021
(72) Клімович Микола Богданович (UA)
(73) **КЛІМОВИЧ МИКОЛА БОГДАНОВИЧ**
вул. Малий бік, 87, с. Голгоча, Підгаєцький р-н, Тернопільська обл., 48024 (UA)
- (54) **СИСТЕМА ВИДАЛЕННЯ ЗАПАХІВ ДЛЯ ПІДВІСНОГО УНІТАЗА**
- (57) Система видалення запахів для підвісного унітаза, що включає канал подачі води в порожнину унітаза, з'єднаний з вентиляційним каналом, яка **відрізняється** тим, що канал подачі води, що складається з вертикальної труби, коліна і горизонтальної частини, виконаної з можливістю під'єднання до чаші унітаза, на ділянці вертикальної труби має отвір, виконаний з можливістю з'єднання за допомогою розташованого під кутом 45° відносно вертикальної труби повітропроводу з вентиляційною шахтою будівлі.

Е 05

- (11) **147654** (51) МПК (2021.01)
E05B 1/00

- (21) u 2020 07575 (22) 27.11.2020
(24) 03.06.2021
(72) Кіпніс Дмитро Михайлович (UA)
(73) **КІПНІС ДМИТРО МИХАЙЛОВИЧ**
вул. Олега Григор'єва, 10, кв. 21, м. Миколаїв, Миколаївська обл., 54029 (UA)
- (54) **РУЧКА ПОВОРОТНА ДЛЯ ЗАМКА ДВЕРЕЙ АБО ВІКНА**
- (57) 1. Ручка поворотна для замка дверей або вікна, що має захватну рукоятку з маточиною, що розташована, приблизно, під прямим кутом, а також еластичну частину, з можливістю обмеження передавального зусилля від руки людини на замок, яка **відрізняється** тим, що захватну рукоятку з маточиною виконано єдиною деталлю з пружного полімерного матеріалу із заданим модулем пружності і заданими поперечними перерізами, та своєю нормованою жорсткістю забезпечує можливість обмеження, за рахунок пружної деформації, навантаження від руки людини на замок, і ручка поворотна сполучається з валом впливу на замок, за допомогою квадратного глухого отвору в частині маточини, що примикає до замка.
2. Ручка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що пружний матеріал захватної рукоятки вибраний з ряду полімерних матеріалів з модулем пружності від 40 до 2400 МПа, а вибраними розмірами поперечних перерізів забезпечена можливість пружної деформації від 20 до 80 градусів при досягненні заданого гранично допустимого навантаження від руки людини на замок.
3. Ручка за п. 1 і п. 2, яка **відрізняється** тим, що як пружні полімерні матеріали застосовуються гума, поліуретан, фторопласт, ФЛЕКС (FLEX) для 3D-принтерів, поліацеталь.
4. Ручка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що поперечний переріз захватної рукоятки, перед вузлом переходу між маточиною і захватною рукояткою, має ширину в 1,2-4 рази менше, ніж висота, що знаходиться в напрямку площини захватної рукоятки і поздовжньої осі отвору для вала впливу на замок.
5. Ручка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що площа поперечного перерізу маточини від 1,2 до 4 разів перевищує переріз захватної рукоятки і виконаний плавний перехід зміни перерізу.
6. Ручка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що на торці маточини виконаний концентрично циліндричний вузол зменшеного діаметра із зовнішнім буртиком на торці, з можливістю сполучення зі стопорною деталлю замка від осьового зміщення.

Е 21

- (11) **147674** (51) МПК (2021.01)
E21B 37/00
E21B 21/00
- (21) u 2021 00008 (22) 04.01.2021
(24) 03.06.2021
(72) Шендрик Олексій Михайлович (UA), Коцаба Василь Іванович (UA), Дьомін Андрій Вікторович (UA), Гнітко

Андрій Володимирович (UA), Мельник Анатолій Павлович (UA), Росляков В'ячеслав Олексійович (UA)

(73) АКЦІОНЕРНЕ ТОВАРИСТВО "УКРГАЗВИДОБУВАННЯ"

вул. Кудрявська, 26/28, м. Київ, 04053 (UA)

(54) СПОСІБ БОРОТЬБИ З СОЛЬОВИМИ ВІДКЛАДЕННЯМИ У НАСОСНО-КОМПРЕСОРНИХ ТРУБАХ ГАЗОВИДОБУВНИХ СВЕРДЛОВИН

(57) Спосіб боротьби з сольовими відкладеннями у насосно-компресорних трубах газовидобувних сверд-

ловин, що включає нанесення на внутрішню поверхню труб захисного шару, який **відрізняється** тим, що спочатку внутрішню поверхню насосно-компресорних труб промивають та просушують продувкою азотом, здійснюють антикорозійну обробку, після чого наносять захисний гідрофобний шар полімерного покриття, яке має низьку адгезією на контакті "газ-захисне покриття".

Розділ F:**Машинобудування.
Освітлювання. Опалювання.
Зброя. Підривні роботи****F 02**

- (11) **147680** (51) МПК (2021.01)
F02M 37/00
- (21) **и 2021 00265** (22) **25.01.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Уминський Сергій Михайлович (UA), Дударев Ігор Іванович (UA), Лебедев Борис Володимирович (UA), Королькова Марія Василівна (UA), Дмитрієва Світлана Юрійовна (UA)
- (73) **УМИНСЬКИЙ СЕРГІЙ МИХАЙЛОВИЧ**
вул. Малиновського, 35/2, кв. 87, м. Одеса, 65063 (UA)
- ДУДАРЕВ ІГОР ІВАНОВИЧ**
вул. Люстдорфська дорога, 55/2, кв. 37, м. Одеса, 65073 (UA)
- ЛЕБЕДЕВ БОРИС ВОЛОДИМИРОВИЧ**
вул. Малиновського, 47, кв. 5, м. Одеса, 65043 (UA)
- КОРОЛЬКОВА МАРІЯ ВАСИЛІВНА**
вул. Фонтанська дорога, 12/10, кв. 36, м. Одеса, 65058 (UA)
- ДМИТРИЄВА СВИТЛАНА ЮРІЙОВНА**
пр. Шевченка, 6/11, кв. 11, м. Одеса, 65009 (UA)
- (54) **КОНДЕНСАТОВІДВІДНИК ДЛЯ ПНЕВМОСИСТЕМ ТРАКТОРІВ**
- (57) Конденсатовідвідник пневмосистем тракторів, який містить корпус з кришками, пружину, діафрагму, скидний клапан, який **відрізняється** тим, що на діафрагмі закріплено трубку з отворами по бічній поверхні, верхня частина якої, твірна золотникового скидного клапана, вкручена в отвір балона.

F 04

- (11) **147690** (51) МПК (2021.01)
F04D 3/00
F04D 29/66 (2006.01)
- (21) **и 2021 00563** (22) **11.02.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Гасій Григорій Михайлович (UA), Артеменко Дмитро Юрійович (UA), Дарієнко Віктор Вікторович (UA), Портнов Геннадій Давидович (UA), Лізунков Олександр Вікторович (UA), Скриннік Іван Олександрович (UA)
- (73) **ЦЕНТРАЛЬНОУКРАЇНСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ**
пр. Університетський, 8, м. Кропивницький, 25006 (UA)

(54) ОСЬОВИЙ НАСОС

- (57) Осьовий насос, що містить робоче колесо з циліндричними лопатями і напрямлячами потоку, напрямлячі виконані у вигляді тонкостінних дугоподібних концентричних пластин, закріплених на вихідних краях та розташованих в площинах, перпендикулярних площині лопаті, який **відрізняється** тим, що робоче колесо виконане комбінованим та складається з двох конічних гвинтових крильчаток різного діаметра, в передній частині - більшого діаметра, в задній частині - меншого, причому лопаті задньої крильчатки зміщені відносно попередніх, створюючи перекриття, і мають клинові вирізи на лопатях різної довжини.

F 16

- (11) **147698** (51) МПК
F16D 41/06 (2006.01)
- (21) **и 2021 00662** (22) **15.02.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Малащенко Володимир Олександрович (UA), Сологуб Богдан Володимирович (UA), Суков Максим Геннадійович (UA), Борис Андрій Орестович (UA)
- (73) **НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ "ЛЬВІВСЬКА ПОЛІТЕХНІКА"**
вул. Ст. Бандери, 12, м. Львів, 79013 (UA)
- (54) **ОБГІННО-ЗАПОБІЖНА МУФТА**
- (57) Обгінно-запобіжна муфта, що складається із двох півмуфт, кожна з яких виконана з пазами, пази ведучої півмуфти розташовані дзеркально відносно веденої і виконані на взаємно обернених циліндричних поверхнях півмуфт, елементи веденої півмуфти з'єднані, а в пазах півмуфт встановлено кульки, яка **відрізняється** тим, що ведена півмуфта виконана із двох концентрично розміщених один в одному елементів, що зв'язані між собою кульками, на які спираються пружини, які підтискаються регулювальними гвинтами.

F 24

- (11) **147684** (51) МПК (2021.01)
F24H 1/00
- (21) **и 2021 00415** (22) **03.02.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Артазей Андрій Іванович (UA)
- (73) **АРТАЗЕЙ АНДРІЙ ІВАНОВИЧ**
вул. Івана Франка, 22/24, кв. 19, м. Київ, 01030 (UA)
- (54) **КОТЕЛ ОПАЛЮВАЛЬНИЙ ГАЗОВИЙ ПОБУТОВИЙ**
- (57) Котел опалювальний газовий побутовий, який містить корпус котла з панеллю приладів та знімною передньою кришкою, теплообмінник з камерою згорання, енергонезалежний газовий клапан з термостатичним управлінням, пілотний палик, газовий колектор, іскровий електрод, термовідскач, датчик тем-

ператури теплоносія, розміщений на панелі приладів, який **відрізняється** тим, що в конструкцію введено додатковий газовий клапан нормально відкритого типу з автоматичним спрацюванням, встановлений після енергонезалежного клапана на газовому колекторі котла, та терморегулятор, розміщений на панелі приладів, з виносним датчиком для вимірювання температури в приміщенні.

F 41

- (11) **147679** (51) МПК
F41A 21/36 (2006.01)
- (21) **у 2021 00233** (22) **22.01.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Ковальський Вячеслав Морисович (UA)
(73) **КОВАЛЬСЬКИЙ ВЯЧЕСЛАВ МОРИСОВИЧ**
вул. Верхарна, буд. 70, кв. 25, м. Вінниця, Вінницька обл., 21001 (UA)
- (54) **ПРИСТРІЙ ДЛЯ СТРІЛЬБИ "ХІТСЛАЙДЕР"**
- (57) 1. Пристрій для стрільби з ковзаючою системою кріплення сошки, що містить основу, який **відрізняється** тим, що додатково введено каретку, щонайменше одну напрямну, щонайменше одну пружину, щонайменше чотири втулки та щонайменше один затискний елемент; в основі розміщені напрямні, на яких розташовані втулки та каретка, пружина та затискний елемент; напрямні з'єднані з основою, кареткою та втулками; пружина розміщена в основі та з'єднана з затискним елементом.
2. Пристрій для стрільби за п. 1, який **відрізняється** тим, що основа містить нижню та щонайменше дві бічні сторони.
3. Пристрій для стрільби за п. 1, який **відрізняється** тим, що затискним елементом може бути гвинт, болт, шпилька.
4. Пристрій для стрільби за п. 1, який **відрізняється** тим, що з'єднання забезпечується гвинтами, болтами.

- (11) **147646** (51) МПК (2021.01)
F41A 31/00
F41A 23/16 (2006.01)
- (21) **у 2020 05947** (22) **18.12.2020**
(24) **03.06.2021**
- (72) Звягін Олег Васильович (UA)
(73) **ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ "УКРОП."**
вул. Димитрова, 2-В, с. Димитрово, Київська обл., 07402 (UA)
- (54) **СТЕНД ДЛЯ РЕСУРСНИХ ВИПРОБУВАНЬ УДАРНО-СПУСКОВИХ МЕХАНІЗМІВ ГВИНТІВОК**
- (57) 1. Стенд для проведення ресурсних випробувань ударно-спускових механізмів гвинтівок, що містить силову станину із закріпленими на ній кронштейнами, які мають на вільній частині затискачі, та досліджуваний зразок ударно-спускового механізму, до складу якого входять курок, спусковий гачок, закритий за-

побіжною скобою, та проміжні деталі, які з'єднано із зазначеними курком та спусковим гачком, при цьому зазначені складові частини ударно-спускового механізму розміщено у рамі нижній гвинтівки, а зазначену раму нижню гвинтівки закріплено у затискачах, який **відрізняється** тим, що додатково введено пристрій імітації роботи ударно-спускового механізму, до складу якого входять триланковий кулачковий механізм, одноланковий кривошипний механізм і черв'ячний мотор-редуктор з валом, при цьому триланковий кулачковий механізм містить послідовно зв'язані між собою: кулачок, коромисло і шток, причому вал черв'ячного мотор-редуктора кінематично зв'язаний з одноланковим кривошипним механізмом, що в свою чергу кінематично зв'язаний з кулачком триланкового кулачкового механізму і з курком ударно-спускового механізму, згаданий кулачок триланкового кулачкового механізму кінематично зв'язаний з коромислом, що у свою чергу кінематично зв'язане зі штоком, а згаданий шток триланкового кулачкового механізму кінематично зв'язаний зі спусковим гачком ударно-спускового механізму.
2. Стенд за п. 1, який **відрізняється** тим, що триланковий кулачковий механізм та одноланковий кривошипний механізм складають виконавчу частину пристрою імітації роботи ударно-спускового механізму.
3. Стенд за п. 1, який **відрізняється** тим, що пристрій імітації роботи ударно-спускового механізму змонтовано на силовій станині.

- (11) **147663** (51) МПК (2021.01)
F41J 1/08 (2006.01)
F41J 1/10 (2006.01)
F41J 7/00
F41J 7/04 (2006.01)
- (21) **у 2020 08231** (22) **22.12.2020**
(24) **03.06.2021**
- (72) Міняйлук Сергій Миколайович (UA)
(73) **МІНЯЙЛУК СЕРГІЙ МИКОЛАЙОВИЧ**
вул. Шкільна, 20, с. Струга, Новоушицький р-н, Хмельницька обл., 32632 (UA)
- (54) **СИЛУЕТНА ТРЕНУВАЛЬНА МІШЕНЬ**
- (57) 1. Силуетна тренувальна мішень, що містить силуетну ціль (1), що опирається на підпору (2) з основою (3), та тримач (4), при цьому силуетна ціль (1) виконана з передньою (5) та задньою (6) сторонами, підпора (2) виконана з двома кінцями (7), (8), і підпора (2) одним своїм кінцем (7) з'єднана з основою (3), а іншим своїм кінцем (8) підпора (2) з'єднана з силуетною ціллю (1) за допомогою тримача (4), яка **відрізняється** тим, що силуетна ціль (1) виконана площинною, а форма та розмір, при вигляді спереду на силуетну ціль (1), виконані таким чином, що відповідають реалістичній формі та реалістичному розміру об'єкта ураження, при цьому підпора (2) з'єднана з основою (3) із забезпеченням можливості руху підпори (2), і додатково підпора (2) містить підсилюючий елемент (9) з двома загнутими кінцями (10), (11) різного розміру, що встановлений на кінці (8) підпори (2), при цьому підсилюючий елемент (9), одним зі своїх загнутих кінців (10) або (11), роз'ємно з'єднаний з тримачем (4), який закріплений на зад-

ній стороні (6) силуетної цілі (1), крім того, силуетна ціль (1) встановлена під кутом λ до горизонту, з можливістю зміни величини цього кута λ і з можливістю зміни нахилу силуетної цілі (1).

2. Силуетна тренувальна мішень за п. 1, яка **відрізняється** тим, що підпора (2) виконана змінної довжини, а величину кута λ змінюють шляхом зміни довжини підпори (2).

3. Силуетна тренувальна мішень за п. 1, яка **відрізняється** тим, що величину кута λ змінюють шляхом підбору висоти розміщення тримача (4) на задній стороні (6) силуетної цілі (1).

F 42

(11) 147655 (51) МПК
F42D 1/05 (2006.01)
F42C 13/04 (2006.01)

(21) u 2020 07663 (22) 02.12.2020
(24) 03.06.2021

(72) Вербенський Михайло Георгійович (UA), Криволапчук Володимир Олексійович (UA), Смерницький Дем'ян Вікторович (UA), Яковенко Олександр Васильович (UA), Мусієнко Дмитро Іванович (UA), Филь

Світлана Петрівна (UA), Ланевський Євген Валерійович (UA), Буран Вікторія Володимирівна (UA), Чередниченко Андрій Валерійович (UA)

(73) ДЕРЖАВНИЙ НАУКОВО-ДОСЛІДНИЙ ІНСТИТУТ МВС УКРАЇНИ

пров. Євгена Гуцала, 4-а, м. Київ-11, 01011 (UA)

(54) РАДІОСИСТЕМА ІНІЦІЮВАННЯ ВИБУХОВИХ ЗАРЯДІВ

(57) 1. Радіосистема ініціювання вибухових зарядів, що містить орган керування і відображення інформації та виконавчі прилади, яка **відрізняється** тим, що орган керування і відображення інформації додатково містить екран та клавіатуру, які приєднані до мікроконтролера, до якого підключено джерело живлення та приймально-передавальний вузол з антеною; кожний виконавчий прилад містить приймально-передавальний вузол з антеною, який приєднано до мікроконтролера, до якого підключено джерело живлення та вузол формування напруги для підриву електродетонаторів, до якого приєднано роз'єм для підключення електродетонаторів.

2. Радіосистема ініціювання вибухових зарядів за п. 1, яка **відрізняється** тим, що орган керування і відображення інформації та виконавчі прилади є автономними.

Розділ G:**Фізика****G 01**

мірювальних баз і за отриманими результатами судять про розміри зони сплавлення зварного з'єднання, який **відрізняється** тим, що визначають покази мікротвердості поверхні, за якими судять про область встановлення вимірювальних баз.

- (11) **147697** (51) МПК
G01B 5/30 (2006.01)
G01L 1/06 (2006.01)
- (21) **и 2021 00658** (22) **15.02.2021**
(24) **03.06.2021**
(72) Дзюбик Андрій Романович (UA), Максимович Олеся Володимирівна (UA), Хомич Іван Богданович (UA)
(73) **НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ "ЛЬВІВСЬКА ПОЛІТЕХНІКА"**
вул. Ст. Бандери, 12, м. Львів, 79013 (UA)
(54) **СПОСІБ ВИЗНАЧЕННЯ РОЗМІРІВ ЗОНИ ЗВАРЮВАЛЬНИХ ПЛАСТИЧНИХ ДЕФОРМАЦІЙ У ЗВАРНУМУ З'ЄДНАННІ**
(57) Спосіб визначення розмірів зони зварювальних пластичних деформацій у зварному з'єднанні, згідно з яким встановлюють вимірювальні бази на досліджуваній поверхні зварного з'єднання, вимірюють рельєф поверхні у незбуреному стані, висвердлюють отвори сталого діаметра в центрах вимірювальних баз, вимірюють деформований залишковими напруженнями рельєф поверхні і за отриманими результатами судять про розміри зони пластичних деформацій в зварному з'єднанні, який **відрізняється** тим, що перед встановленням вимірювальних баз вимірюють відстані від центру вимірювальних баз до осі зварного шва, діаметр кожного отвору встановлюють залежно від відстані від центру вимірювальної бази до осі зварного шва.

- (11) **147696** (51) МПК
G01B 7/004 (2006.01)
G01N 25/32 (2006.01)
- (21) **и 2021 00657** (22) **15.02.2021**
(24) **03.06.2021**
(72) Дзюбик Андрій Романович (UA), Хомич Іван Богданович (UA), Палаш Роман Володимирович (UA), Дзюбик Людмила Володимирівна (UA)
(73) **НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ "ЛЬВІВСЬКА ПОЛІТЕХНІКА"**
вул. Степана Бандери, 12, м. Львів, 79013 (UA)
(54) **СПОСІБ ВИЗНАЧЕННЯ РОЗМІРІВ ЗОНИ СПЛАВЛЕННЯ У ЗВАРНУМУ З'ЄДНАННІ ТРУБОПРОВОДУ**
(57) Спосіб визначення розмірів зони сплавлення у зварному з'єднанні трубопроводу, згідно з яким досліджувану поверхню зварного з'єднання виконують як мікрошліф, визначають область встановлення вимірювальних баз, виконують вимірювальні бази перпендикулярно до осі зварного шва, за показами контактної локальної термоелектрорушійної сили визначають характеристики хімічного складу металу ви-

- (11) **147649** (51) МПК (2021.01)
G01N 33/00
G01N 33/50 (2006.01)
G01N 27/00
- (21) **и 2020 06748** (22) **20.10.2020**
(24) **03.06.2021**
(72) Солдаткін Олександр Олексійович (UA), Седюко Дар'я Віталіївна (UA), Кучеренко Іван Сергійович (UA), Мруга Дарина Олександрівна (UA), Дзядевич Сергій Вікторович (UA), Солдаткін Олексій Петрович (UA)
(73) **ІНСТИТУТ МОЛЕКУЛЯРНОЇ БІОЛОГІЇ І ГЕНЕТИКИ НАЦІОНАЛЬНОЇ АКАДЕМІЇ НАУК УКРАЇНИ**
вул. Заболотного, 150, м. Київ, 03680 (UA)
(54) **БІОСЕНСОР ДЛЯ ВИЗНАЧЕННЯ ДОФАМІНУ**
(57) Біосенсор для визначення дофаміну, що складається з двох пар золотих електродів, який **відрізняється** тим, що на першу пару золотих електродів нанесена робоча біоселективна мембрана на основі фермента лаккази, селективна до дофаміну, на другу пару золотих електродів нанесена референтна мембрана на основі бичачого сироваткового альбуміну, а вказаний біосенсор призначений для підключення до експериментальної установки для кондуктометричних вимірювань.

- (11) **147683** (51) МПК
G01S 5/02 (2010.01)
- (21) **и 2021 00334** (22) **29.01.2021**
(24) **03.06.2021**
(72) Торба Олександр Алексєєвич (UA), Коваленко Андрій Анатолійович (UA), Барковська Олеся Юріївна (UA), Іващенко Георгій Станіславович (UA), Торба Максим Олегович (UA), Торба Олександр Олегович (UA)
(73) **ХАРКІВСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ РАДІОЕЛЕКТРОНІКИ**
пр. Науки, 14, м. Харків, 61166 (UA)
(54) **КОМПЛЕКС МОНІТОРИНГУ РАДІОВИПРОМІНЮВАНЬ ПО ЧАСТОТІ І ПО НАПРЯМУ**
(57) Комплекс моніторингу радіовипромінювань по частоті і по напрямку, що містить n каналів напрямку, які працюють паралельно, і кожен канал включає з'єднані послідовно вузьконаправлену антену і радіоприймальний модуль з синтезатором частоти, а також мікроконтролер, перший вихід послідовного інтерфейсу якого з'єднаний з входом послідовного інтерфейсу синтезатора частоти першого каналу, аналоговий вихід радіоприймального модуля цього каналу підключений до аналогового входу мікроконтролера, другий вихід послідовного інтерфейсу мікроконтролера підключений до входу послідовного інтерфейсу мінікомп'ютера, який **відрізняється** тим, що перший вихід послідовного інтерфейсу мікроко-

нтролера з'єднаний зі входами послідовного інтерфейсу синтезаторів частоти усіх каналів напряму, аналогові виходи радіоприймальних модулів усіх каналів напряму підключені до окремих аналогових входів мікроконтролера.

- (11) **147670** (51) МПК
G01S 13/74 (2006.01)
- (21) **u 2020 08378** (22) **28.12.2020**
(24) **03.06.2021**
- (72) Свид Ірина Вікторівна (UA), Обод Іван Іванович (UA), Даденко Олександр Олександрович (UA), Козирев Сергій Романович (UA), Воргуль Олександр Васильович (UA)
- (73) **ХАРКІВСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ РАДІОЕЛЕКТРОНІКИ**
пр. Науки, 14, м. Харків, 61166 (UA)
- (54) **СПОСІБ ІДЕНТИФІКАЦІЇ ПОВІТРЯНИХ ОБ'ЄКТІВ ЗА ОЗНАКОЮ "СВІЙ-ЧУЖИЙ"**
- (57) Спосіб ідентифікації повітряних об'єктів за ознакою "свій-чужий", який полягає в тому, що запитувачем випромінюють сигнали запиту, які приймають відповідачем, аналізують та випромінюють сигнали відповіді, які приймають запитувачем, аналізують і за результатами аналізу видають сигнали ідентифікації за ознакою "свій-чужий", який відрізняється тим, що у відповідачі формують часовий строб прийому сигналів запиту, який за часом перевищує декілька періодів сигналу запиту системи ідентифікації, за закінченням якого формують, за умови виявлення хоча б одного декодованого сигналу запиту протягом діючого часового стробу, сигнал відповіді, а момент випромінювання сигналу відповіді суміщують з наперед відомим значенням єдиної шкали часу системи ідентифікації.

G 06

- (11) **147707** (51) МПК
G06F 1/28 (2006.01)
G06F 1/32 (2019.01)
G06F 1/3225 (2019.01)
- (21) **u 2021 01494** (22) **22.03.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Міщенко Олег Іванович (UA), Яциник Мар'ян Степанович (UA)
- (73) **МІЩЕНКО ОЛЕГ ІВАНОВИЧ**
вул. Джамбула, 50, кв. 508 м. Ужгород, 88000 (UA)
ЯЦИНИК МАР'ЯН СТЕПАНОВИЧ
вул. Грушевського, 55, кв. 14, м. Ужгород, 88015 (UA)
- (54) **КОНТРОЛЕР ЖИВЛЕННЯ З ФУНКЦІЮ РЕЗЕРВНОГО ЖИВЛЕННЯ ДЛЯ НАКОПИЧУВАЧА ІНФОРМАЦІЇ БУДЬ-ЯКОГО ТИПУ**
- (57) 1. Контролер живлення з функцією резервного живлення для накопичувача інформації будь-якого типу, що містить корпус (1) та встановлені у корпусі (1)

блок (2) зарядки та акумуляторну батарею (3), і встановлену у блоці (2) зарядки материнську плату (4) з контактними доріжками (7) та з розміщеними на ній платою управління (5) та платою зарядки (6), і акумуляторна батарея (3) з'єднана з платою управління (5) та з платою зарядки (6), при цьому корпус (1) містить вхідний порт (8), який виконаний з можливістю встановлення контакту з портом підключення зовнішнього джерела живлення (10), і також корпус (1) містить вихідний порт (9), який виконаний з можливістю встановлення контакту з портом підключення накопичувача інформації (11), і вхідний порт (8) та вихідний порт (9) з'єднані з материнською платою (4), а на вхідний порт (8) з зовнішнього джерела живлення (10) направлена вхідна напруга U₁, значення якої знаходиться в діапазоні +3,3 V++12V, при цьому напруга U_{1a} акумуляторної батареї (3) дорівнює вхідній напрузі U₁ з допустимим відхиленням до 5 %, і вихідна напруга U₂ на вихідному порту (9) дорівнює вхідній напрузі U₁ з допустимим відхиленням до 5 %.

2. Контролер живлення накопичувача інформації будь-якого типу з функцією резервного живлення за п. 1, який відрізняється тим, що вхідний порт (8) виконаний як USB-порт(и) або мікро-USB-порт(и), або USB-type-порт(и), або як SATA-порт(и).

3. Контролер живлення накопичувача інформації будь-якого типу з функцією резервного живлення за п. 1, який відрізняється тим, що вихідний порт (9) виконаний як USB-порт(и) або мікро-USB-порт(и), або USB-type-порт(и), або як SATA-порт(и).

4. Контролер живлення накопичувача інформації будь-якого типу з функцією резервного живлення за будь-яким з пп. 1-3, який відрізняється тим, що корпус (1) додатково містить додатковий вхідний порт (12) для підключення додаткових джерел живлення.

G 07

- (11) **147702** (51) МПК (2021.01)
G07C 5/00
G06F 17/00
G08G 1/00
- (21) **u 2021 00888** (22) **24.02.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Іванов Юрій Борисович (UA)
- (73) **ІВАНОВ ЮРІЙ БОРИСОВИЧ**
вул. Каштанова, 3, кв. 156, м. Київ, 02225 (UA)
- (54) **СПОСІБ МОНІТОРИНГУ ПЕРЕСУВАННЯ ТРАНСПОРТНОГО ЗАСОБУ**
- (57) 1. Спосіб моніторингу пересування транспортного засобу, згідно з яким на транспортному засобі встановлюють щонайменше один датчик або/та встановлюють щонайменше один електронний пристрій, де електронний пристрій виконаний з можливістю забезпечення трекінгу транспортного засобу, при цьому електронний пристрій містить корпус, акумулятор, датчик руху, GPS-приймач, антену, чип для обробки інформації, GSM-GPRS-трансвер, вбудовану пам'ять, не менш ніж одну сім-карту, не менш ніж один

вихід та не менш ніж один вхід, при цьому на GPS-приймач електронного пристрою отримують від супутника сигнали геопозиціонування транспортного засобу, передають за рахунок GSM-GPRS трансивера електронного пристрою по каналу дані щодо місцеположення транспортного засобу та показники щонайменше одного або більше датчиків на сервер, вносять кодовані дані у базу даних, при цьому користувачеві надають можливість надати запит до бази даних щодо моніторингу пересування транспортного засобу, на сервері обробляють запит програмним забезпеченням за допомогою обчислювальних технічних засобів, формують та відправляють відповідь на запит за допомогою веб-інтерфейсу моніторингу у вигляді візуалізації процесу моніторингу текстовими та/або графічними даними, при цьому сервер виконаний з можливістю передання даних на диспетчерський пульти та/або на комп'ютер, та/або мобільний пристрій, та/або планшет, та/або смартфон, який має вихід до інтернету.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що щонайменше один датчик є датчиком пального та містить корпус, чутливий елемент, вимірювальні трубки, стабілізатор живлення та виконаний з можливістю вимірювання рівня чутливого елемента датчика у пальне та формування на виході частотного або аналогового, або цифрового сигналу, який пропорційний рівню вимірюваного пального.

3. Спосіб за будь-яким з пп. 1-2, який **відрізняється** тим, що електронний пристрій виконаний як GPS-трекер.

4. Спосіб за за будь-яким з пп. 1-3, який **відрізняється** тим, що датчик руху виконаний на базі акселерометра.

5. Спосіб за будь-яким з пп. 1-4, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю отримання інформації щодо місцеположення транспортного засобу на карті.

6. Спосіб за будь-яким з пп. 1-5, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю отримання інформації щодо напрямку транспортного засобу на карті.

7. Спосіб за будь-яким з пп. 1-6, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю отримання інформації щодо швидкості руху транспортного засобу.

8. Спосіб за будь-яким з пп. 1-7, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю отримання інформації щодо пройденого шляху транспортного засобу.

9. Спосіб за будь-яким з пп. 1-8, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю відображення маршрутів транспортного засобу за будь-який період часу.

10. Спосіб за будь-яким з пп. 1-9, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю отримання інформації про включення/вимикання запалювання.

11. Спосіб за будь-яким з пп. 1-10, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю отримання звіту про пересування транспортного засобу за будь-який заданий проміжок часу з відображенням на карті всіх переміщень або у вигляді файлових архівів.

12. Спосіб за будь-яким з пп. 1-11, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю задання індивідуального режиму стеження за транспортним засобом.

13. Спосіб за будь-яким з пп. 1-12, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю задання ін-

дивідуального режиму стеження за транспортним засобом по частоті.

14. Спосіб за будь-яким з пп. 1-13, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю задання індивідуального режиму стеження за транспортним засобом по інтервалу фіксації місцеположення.

15. Спосіб за будь-яким з пп. 1-14, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю керування транспортним засобом з індивідуально обумовленими правами доступу.

16. Спосіб за будь-яким з пп. 1-15, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю здійснення запиту місцеположення одного транспортного засобу.

17. Спосіб за будь-яким з пп. 1-16, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю здійснення запиту місцеположення усіх транспортних засобів транспортного парку.

18. Спосіб за будь-яким з пп. 1-17, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю здійснення запиту місцеположення транспортних засобів, що знаходяться на певній території.

19. Спосіб за будь-яким з пп. 1-18, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю зберігання інформації в базах даних по кожному транспортному засобу.

20. Спосіб за будь-яким з пп. 1-19, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю зберігання інформації в базах даних по кожному транспортному засобу, включаючи маршрути, обмін повідомленнями.

21. Спосіб за будь-яким з пп. 1-20, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю накопичувати та зберігати інформацію в чорному ящику електронного пристрою при виході із зони дії мобільного оператора.

22. Спосіб за будь-яким з пп. 1-21, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю задання інтервалів отримання повідомлень щодо параметрів транспортного засобу, вибраних з групи: рух, технічний стан, швидкість, координати місцеположення, кількість палива в баках, маса.

23. Спосіб за будь-яким з пп. 1-22, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю підключення кнопки тривоги.

24. Спосіб за будь-яким з пп. 1-23, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю задання області на карті, при вході або виході транспортного засобу з якої диспетчеру відправляють відповідне повідомлення.

25. Спосіб за п. 24, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю відправлення диспетчеру відповідного повідомлення на мобільний телефон.

26. Спосіб за будь-яким з пп. 1-25, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю організування кількох робочих місць диспетчерів з різним місцезнаходженням.

27. Спосіб за будь-яким з пп. 1-26, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю здійснення зв'язку з водієм транспортного засобу без доступу до сім-карти.

28. Спосіб за будь-яким із пп. 1-27, який **відрізняється** тим, що виконаний з можливістю встановлення додаткових датчиків через аналогові та/або цифрові входи.

29. Спосіб за будь-яким із пп. 1-28, який **відрізняється** тим, що відповідь на запит користувача відображають у вигляді текстових або графічних даних, вибраних із групи: маршрут пересування транспортного засобу на картах; план пересування транспортного засобу із вказівкою початкової і кінцевої точки маршруту; ім'я водія, тимчасові рамки виконання завдання, яке покладене на транспортний засіб; звіт для порівняння планованого пробігу по завданнях з фактичним; звіт по знаходженню автомобіля в заданому статусі - порожній у шляху, завантажений в дорозі, в очікуванні накладної; звіт за моточасами; звіт за швидкісними режимами; звіт за рухом палива; звіт за манерою їзди - кількість гальмувань і прискорень, які перевищують критичне прискорення; звіт за кількістю зупинок з вказівкою адреси стоянок, початку, закінчення та тривалості зупинки; графічний звіт з підключенням зовнішніх датчиків; графічне відображення треку транспортних засобів за вибраний період на карті.

30. Спосіб за будь-яким із пп. 1-29, який **відрізняється** тим, що веб-інтерфейс моніторингу складається з двох частин: перша - клієнтська частина, реалізована з використанням PHP або/та HTML, або/та JavaScript, що надає безпосередньо візуальний інтерфейс користувача і формує HTTP post і get-запити на сервер; друга - серверна частина, реалізована на C# або/та MySQL, яка згідно з запитом від клієнтської частини формує і відправляє відповіді з даними на клієнтську частину.

31. Спосіб за будь-яким із пп. 1-30, який **відрізняється** тим, що трекер виконаний з можливістю підключення додаткового обладнання, у тому числі, датчиків, через ланцюг захисту трекера, підключення датчиків по RS485 або/та RS232, або/та 1-Wire, або/та аналогових входах.

G 09

(11) 147706

(51) МПК (2021.01)
G09B 23/00
F41J 1/01 (2006.01)
F42B 35/00

(21) u 2021 01101
(24) 03.06.2021

(22) 05.03.2021

(72) Кофанов Андрій Віталійович (UA), Арешонков Віталій Володимирович (UA), Голоботовський Василь Іванович (UA)

(73) КОФАНОВ АНДРІЙ ВІТАЛІЙОВИЧ

бул. Ігоря Шамо, 12, кв. 159, м. Київ, 02147 (UA)

АРЕШОНКОВ ВІТАЛІЙ ВОЛОДИМИРОВИЧ

вул. Грушевського, буд. 74, літ. А, кв. 16, м. Коростень, Коростенський р-н, Житомирська обл., 11508 (UA)

ГОЛОБОТОВСЬКИЙ ВАСИЛЬ ІВАНОВИЧ

вул. Декабристів, буд. 54, кв. 11, м. Ужгород, Закарпатська обл., 88005 (UA)

(54) СПОСІБ МОДЕЛЮВАННЯ ТРАЄКТОРІЇ СНАРЯДА, СТІЛЯНОГО З РУЧНОЇ СТІЛЕЦЬКОЇ ЗБРОЇ

(57) Спосіб моделювання траєкторії снаряда, стріляного з ручної стрілецької зброї, що полягає у проведенні експертного експерименту - експериментальної стрільби за умов, максимально наближених до стрільби на місці події, який **відрізняється** тим, що експериментальну стрільбу проводять у об'єкт, який спеціально виготовляють за характеристиками об'єкта-перепони зі слідами пострілу, встановленими на місці події або у ході самого дослідження та які впливають на механізм утворення пробоїни або механізм відбиття снаряду від його поверхні (твердість, волокнистість, форма тощо).

Розділ Н:**Електрика****Н 01**

- (11) **147657** (51) МПК (2021.01)
H01L 29/00
- (21) **и 2020 07906** (22) **10.12.2020**
(24) **03.06.2021**
- (72) Борисов Олександр Васильович (UA), Осінов Сергій Миколайович (UA), Заворотний Віктор Федорович (UA), Лупина Борис Іванович (UA)
- (73) **НАЦІОНАЛЬНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ УКРАЇНИ "КИЇВСЬКИЙ ПОЛІТЕХНІЧНИЙ ІНСТИТУТ ІМЕНІ ІГОРЯ СІКОРСЬКОГО"**
просп. Перемоги, 37, м. Київ, 03056 (UA)
- (54) **НАПІВПРОВІДНИКОВИЙ ДЕТЕКТОР**
- (57) Напівпровідниковий детектор, що містить перший металевий контакт, базову область з кремнію і другий металевий контакт, що утворюють два діода Шотткі, який **відрізняється** тим, що містить планарно розташовані пари діодів Шотткі з двома симетричними бар'єрами, першу та другу провідні доріжки, виготовлені з алюмінію, які об'єднують відповідно перший та другий контакти, діелектричний шар, виготовлений з нітриду кремнію, та ізолюючий шар, виготовлений з окису кремнію, що утворюють матрицю детектора, а навколо матриці розташовані генератор змінного струму, фазоінвертор та синхронний детектор, причому перша алюмінієва доріжка з'єднана з виходом генератора змінного струму та входом фазоінвертора та друга алюмінієва доріжка з'єднана з синхронним детектором та виходом фазоінвертора.

Н 02

- (11) **147708** (51) МПК (2021.01)
H02B 11/00
H02B 13/00
- (21) **и 2021 01590** (22) **26.03.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Штерн Юлія Олексіївна (UA)
- (73) **ШТЕРН ЮЛІЯ ОЛЕКСІЇВНА**
вул. Нижньоключова, 14, кв. 223, м. Київ, 03056 (UA)
- (54) **ШАФА ПОФАЗНО-ЕКРАНОВАНОГО СТРУМОПРОВОДУ ТИПУ ІРВ ПІД РОЗ'ЄДНУВАЧ**
- (57) 1. Шафа пофазно-екранованого струмопроводу типу ІРВ під роз'єднувач, яка містить корпус екранованого струмопроводу, полюси роз'єднувача, привід для оперування головними і заземлюючими ножами роз'єднувача, яка **відрізняється** тим, що має приварену до двох бічних панелей корпусу шафи екранованого струмопроводу скобу П-подібної форми з ря-

дом отворів для кріплення металевих корпусів ручного і електричного приводів.

2. Шафа за п. 1, яка **відрізняється** тим, що металеві корпуси ручного і електричного приводів прикріплені до бічних панелей корпусу екранованого струмопроводу через ізоляційні вузли.

3. Шафа за п. 1 або 2, яка **відрізняється** тим, що полюси роз'єднувача з'єднані в осьову систему через кулачкові механізми.

4. Шафа за п. 3, яка **відрізняється** тим, що на кулачкових механізмах осі вала головного і заземлюючого ножів роз'єднувача встановлена муфта.

5. Шафа за п. 3 або 4, яка **відрізняється** тим, що на виході з вала кулачкового механізму з боку електричного приводу встановлена зірочка з ланцюговою передачею від осі вала електричного приводу на вісь вала головних ножів роз'єднувача.

6. Шафа за п. 3 або 4, яка **відрізняється** тим, що на виході з вала кулачкового механізму з боку ручного приводу встановлена муфта з ланцюговою передачею від осі вала ручного приводу на вісь вала заземлюючих ножів роз'єднувача.

- (11) **147692** (51) МПК
H02J 50/05 (2016.01)
H02J 50/12 (2016.01)
H02J 50/40 (2016.01)
- (21) **и 2021 00605** (22) **12.02.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Вдовиченко Антон Валерійович (UA)
- (73) **ВДОВИЧЕНКО АНТОН ВАЛЕРІЙОВИЧ**
вул. Тетяни Яблонської, 2, кв. 16, м. Київ, 03058 (UA)
- (54) **ПРИСТРІЙ БЕЗДРОТОВОЇ ПЕРЕДАЧІ ЕЛЕКТРИЧНОЇ ЕНЕРГІЇ РЕЗОНАНСНОГО ТИПУ**
- (57) Пристрій бездротової передачі електричної енергії резонансного типу, що містить передавач електричної енергії з генератором електричної енергії та приймач електричної енергії з опором навантаження, де передавач та приймач виконані котушками-резонаторами високої добротності, що мають гвинтову одношарову намотку, при цьому передавач з'єднано послідовно із генератором електричної енергії, який послідовно підключено до заземлення, а приймач з'єднано послідовно з опором навантаження, який **відрізняється** тим, що до опору навантаження приймача послідовно підключено котушку-резонатор високої добротності, що має гвинтову одношарову намотку.

- (11) **147676** (51) МПК
H02S 20/23 (2014.01)
E04C 3/07 (2006.01)
H01R 4/38 (2006.01)

- (21) **и 2021 00098** (22) **12.01.2021**
(24) **03.06.2021**
- (72) Сулейманов Руслан Рамзанович (UA)

(73) СУЛЕЙМАНОВ РУСЛАН РАМЗАНОВИЧ
вул. Гагарінське Плато, 5-А, корпус 2, кв. 230,
м. Одеса, 65009 (UA)

(54) УНІВЕРСАЛЬНИЙ МОНТАЖНИЙ ПРОФІЛЬ З
КОМПОЗИТНОГО ПОЛІМЕРУ

(57) 1. Універсальний монтажний профіль з композитного полімеру, що включає центральну камеру на всю довжину профілю, яка обмежена боковинами і, виконаними плоскими та розташованими опозитно, основами, щонайменше до однієї з яких ззовні на всю довжину центральної камери приєднане ребро з фланцем з утворенням пазів, який **відрізняється** тим, що всередину центральної камери, на всю її довжину співвісно поздовжній осі введено внутрішню камеру, яка ділянками своєї зовнішньої поверхні з'єднана з ділянками внутрішньої поверхні кожної з боковин взаємним проникненням однієї поверхні в іншу, при цьому ділянки з'єднання розташовані вздовж щонайменше однієї поздовжньої лінії внутрішньої поверхні кожної з боковин.

2. Універсальний монтажний профіль з композитного полімеру за п. 1, який **відрізняється** тим, що внутрішню камеру виконано у вигляді труби круглого перетину.

3. Універсальний монтажний профіль з композитного полімеру за п. 1, який **відрізняється** тим, що до другої опозитної основи приєднане ребро з фланцем з утворенням пазів.

4. Універсальний монтажний профіль з композитного полімеру за п. 1, який **відрізняється** тим, що боковини центральної камери виконано у вигляді криволинійних поверхонь.

5. Універсальний монтажний профіль з композитного полімеру за п. 1, який **відрізняється** тим, що боковини центральної камери виконано у вигляді плоских поверхонь.

6. Універсальний монтажний профіль з композитного полімеру за будь-яким з п. 1, який **відрізняється** тим, що ребро приєднане до основи центральної камери симетрично щодо поздовжньої осі перетину центральної камери.

7. Універсальний монтажний профіль з композитного полімеру за будь-яким з п. 1, який **відрізняється** тим, що ребро приєднане до основи центральної камери асиметрично щодо поздовжньої осі перетину центральної камери.

(73) ДЕРЖАВНИЙ НАУКОВО-ДОСЛІДНИЙ ІНСТИТУТ
МВС УКРАЇНИ

пров. Євгена Гуцала, 4-а, м. Київ, 01011 (UA)

(54) ПРИСТРІЙ ДЛЯ БЛОКУВАННЯ СИГНАЛУ З ВИКОРИСТАННЯМ СПЕКТРАЛЬНИХ МАСОК

(57) Пристрій для блокування сигналу з використанням спектральних масок, що складається з приймача, який приєднано до мікроконтролера, що підключений до передавача, який **відрізняється** тим, що додатково до мікроконтролера приєднано підключені між собою базу даних спектральних масок і пристрій оброблення та розпізнавання ознак сигналів, який приєднано до приймача.

(11) 147689

(51) МПК
H03F 3/19 (2006.01)

(21) u 2021 00533

(22) 09.02.2021

(24) 03.06.2021

(72) Зав'ялов Станіслав Борисович (UA), Севергін Борис Миколайович (UA), Мизюк Андрій Анатолійович (UA)

(73) ЗАВ'ЯЛОВ СТАНІСЛАВ БОРИСОВИЧ
Харківське шосе, 152, кв. 399, м. Київ-091, 02091 (UA)

(54) ПІДСИЛЮВАЧ ПОТУЖНОСТІ БЕЗПЕРЕРВНИЙ Х-ДІАПАЗОНУ "R-2TN-UR"

(57) Підсилювач потужності безперервний Х-діапазону, що містить в корпусі модуль діагностики, модуль вхідний, вузол підсилення, який **відрізняється** тим, що як вузол підсилення використовується комбінований блок надвисокочастотного підсилювача, який складається з двох дільників-суматорів, двох блоків розподілення живлення та шістнадцяти модулів, що забезпечує достатньо високу потужність.

(11) 147688

(51) МПК
H03F 3/19 (2006.01)

(21) u 2021 00531

(22) 09.02.2021

(24) 03.06.2021

(72) Зав'ялов Станіслав Борисович (UA), Севергін Борис Миколайович (UA), Мизюк Андрій Анатолійович (UA)

(73) ЗАВ'ЯЛОВ СТАНІСЛАВ БОРИСОВИЧ
Харківське шосе, 152, кв. 399, м. Київ-091, 02091 (UA)

(54) ПІДСИЛЮВАЧ ПОТУЖНОСТІ ІМПУЛЬСНИЙ Х-ДІАПАЗОНУ "R-2TI-UR"

(57) Підсилювач потужності імпульсний Х-діапазону, що містить блок керування, який складається з модуля вхідного та модулятора і модуля діагностики, два корпуси, в кожному з яких міститься вузол підсилення, а також суматор, який **відрізняється** тим, що як вузли підсилення використовуються два комбіновані блоки надвисокочастотного підсилювача, в яких розміщено два дільника-суматора, два блоки розподілення живлення та шістнадцять модулів, що забезпечує достатньо високу потужність.

H 03

(11) 147650

(51) МПК (2021.01)
H03B 29/00
G06F 7/00

(21) u 2020 06809

(22) 23.10.2020

(24) 03.06.2021

(72) Вербенський Михайло Георгійович (UA), Криволапчук Володимир Олексійович (UA), Смерницький Дем'ян Вікторович (UA), Яковенко Олександр Васильович (UA), Заїчко Костянтин Вікторович (UA), Филь Світлана Петрівна (UA)

Н 04

- (11) **147695** (51) МПК
H04B 1/06 (2006.01)
G01S 13/06 (2006.01)
- (21) u 2021 00649 (22) 15.02.2021
(24) 03.06.2021
- (72) Зав'ялов Станіслав Борисович (UA), Чигрин Сергій Іванович (UA), Танигін Всеволод Юрійович (UA)
- (73) **ЗАВ'ЯЛОВ СТАНІСЛАВ БОРИСОВИЧ**
Харківське шосе, 152, кв. 399, м. Київ-91, 02091 (UA)
- (54) **ПРИЙМАЮЧИЙ МОДУЛЬ АКТИВНОЇ РАДІОЛОКАЦІЙНОЇ ГОЛОВКИ САМОНАВЕДЕННЯ "ГРАНАТ"**
- (57) Приймаючий модуль активної радіолокаційної головки самонаведення, що має аналогову частину, яка складається з трьох комутаторів, відгалужувача, детектора логарифмічного, трьох детекторів квадратних, дільника, радіоелементів і джерела вторинного живлення, та цифрову систему, до складу якої входять чотири аналого-цифрових перетворювачі і сигнальний процесор, який **відрізняється** тим, що радіоелементами аналогової частини є три комбінованих підсилювачі і три комбінованих фільтри низької частоти з керованою смугою пропускання, що дозволяє вести адаптивний прийом і отримати максимальну чутливість при різних режимах роботи даної системи.

- (11) **147645** (51) МПК
H04N 5/33 (2006.01)
- (21) u 2020 05661 (22) 02.09.2020
(24) 03.06.2021
- (72) Семенов Сергій Геннадійович (UA), Лимаренко Вячеслав Володимирович (UA), Кучук Георгій Анатолійович (UA), Кучук Ніна Георгіївна (UA), Можаяв

Олександр Олександрович (UA), Можаяв Михайло Олександрович (UA), Гнусов Юрій Валерійович (UA), Струков Володимир Михайлович (UA), Макаренко Павло Валентинович (UA), Рог Вікторія Євгеніївна (UA)

(73) **ХАРКІВСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ ВНУТРІШНІХ СПРАВ**

просп. Л. Ландау, 27, м. Харків, 61080 (UA)

(54) **ДВОСПЕКТРАЛЬНА ТЕПЛОВІЗІЙНА КАМЕРА**

- (57) Двоспектральна тепловізійна камера, що містить детектори інфрачервоного та видимого випромінювання, виходи яких з'єднані з генераторами відповідно піро- та відеосигналів, причому вихід генератора піросигналу з'єднаний із входом синтезатора кольору, RGB-виходи якого з'єднані з першим входом змішувача, другий вхід якого з'єднаний з виходом генератора відеосигналу, а вихід з входом кольорового відеомонітора, інфрачервоний та оптичний об'єктиви, причому на головній оптичній осі камери послідовно розміщені інфрачервоний об'єктив, детектор інфрачервоного випромінювання, оптичний об'єктив та детектор видимого випромінювання, причому інфрачервоний об'єктив оптично зв'язаний з детектором інфрачервоного випромінювання, а оптичний об'єктив - з детектором видимого випромінювання, який **відрізняється** тим, що додатково введено цифровий датчик для вимірювання кольору, який містить три світлофільтри, три світлочутливі елементи та три нормувальні підсилювачі, світловий потік, що проходить через світлофільтри, попадає на світлочутливі елементи, які з'єднані з входами нормувальних підсилювачів, як світлочутливі елементи використано фотодіоди, поляризаційний фільтр, який встановлено перед світлофільтрами, три аналого-цифрових перетворювачі, входи яких з'єднані з виходами нормувальних підсилювачів, а виходи з входами регістра даних, що виходом послідовно з'єднаний з входом мікроконтролера, який своїм виходом з'єднаний з входом рідкокристалічного дисплею.

СПОВІЩЕННЯ

ВИНАХОДИ

Зміна імені або повного найменування і/або адреси володільця патенту, чи зміна особи володільця патенту

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	(73) Ім'я або повне найменування та адреса володільця патенту
73207	Акціонерне товариство "Сумське машинобудівне науково-виробниче об'єднання", вул. Горького, 58, м. Суми, 40004
85917	Акціонерне товариство "Сумське машинобудівне науково-виробниче об'єднання", вул. Горького, 58, м. Суми, 40004
87004	Акціонерне товариство "Сумське машинобудівне науково-виробниче об'єднання", вул. Горького, 58, м. Суми, 40004
90176	Акціонерне товариство "Сумське машинобудівне науково-виробниче об'єднання", вул. Горького, 58, м. Суми, 40004
96500	АББ С.п.А., Via Vittor Pisani 16, IT-20124 Milano, Italy (IT)

Припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід у зв'язку із закінченням строку чинності

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід	(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід
40011	25.05.2021	79074	21.05.2021
47429	20.05.2021	87432	23.05.2021
73355	22.05.2021		

Припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід у разі несплати річного збору

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід	(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід
62040	14.03.2020	82873	12.03.2020
71570	13.03.2020	83061	16.03.2020
73315	13.03.2020	83215	12.03.2020
73889	18.03.2020	83587	15.03.2020
74697	12.03.2020	85224	17.03.2020
75191	15.03.2020	86763	12.03.2020
78091	14.03.2020	86906	11.03.2020
78092	14.03.2020	86907	11.03.2020
78093	14.03.2020	88478	15.03.2020
78360	11.03.2020	89018	15.03.2020
80063	15.03.2020	90138	17.03.2020
80293	18.03.2020	90535	11.03.2020
80916	17.03.2020	90816	12.03.2020

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід	(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід
91592	15.03.2020	111149	11.03.2020
92545	16.03.2020	111271	11.03.2020
92566	15.03.2020	111469	16.03.2020
92698	14.03.2020	111675	12.03.2020
93568	16.03.2020	112372	13.03.2020
94096	14.03.2020	112468	12.03.2020
94527	18.03.2020	112874	12.03.2020
95135	14.03.2020	113018	16.03.2020
95475	12.03.2020	113182	14.03.2020
95606	14.03.2020	113303	14.03.2020
96000	12.03.2020	113323	13.03.2020
96829	17.03.2020	113601	11.03.2020
96903	15.03.2020	113997	16.03.2020
97281	17.03.2020	114050	14.03.2020
97908	15.03.2020	114194	14.03.2020
98413	18.03.2020	114874	17.03.2020
98455	12.03.2020	115173	11.03.2020
98568	12.03.2020	115782	15.03.2020
98587	14.03.2020	115901	11.03.2020
98615	12.03.2020	116012	14.03.2020
98681	17.03.2020	116238	12.03.2020
98762	16.03.2020	116320	14.03.2020
99088	16.03.2020	116428	16.03.2020
99089	16.03.2020	116509	17.03.2020
99220	14.03.2020	117129	12.03.2020
99246	16.03.2020	117537	13.03.2020
99437	16.03.2020	117675	18.03.2020
100365	13.03.2020	117925	18.03.2020
100440	11.03.2020	118133	17.03.2020
102501	11.03.2020	118134	17.03.2020
103752	11.03.2020	118173	15.03.2020
104111	18.03.2020	118230	16.03.2020
104333	12.03.2020	118300	13.03.2020
104334	15.03.2020	118392	17.03.2020
105054	12.03.2020	118394	17.03.2020
105116	11.03.2020	118395	17.03.2020
106243	18.03.2020	118530	12.03.2020
106930	11.03.2020	118531	15.03.2020
106961	18.03.2020	118637	16.03.2020
107130	18.03.2020	118750	13.03.2020
107131	18.03.2020	118752	12.03.2020
107437	17.03.2020	118753	13.03.2020
107846	15.03.2020	118889	13.03.2020
107982	11.03.2020	118890	13.03.2020
110052	11.03.2020	118935	15.03.2020
110140	18.03.2020	118936	15.03.2020
110141	18.03.2020	119019	12.03.2020
110258	11.03.2020	119211	16.03.2020
110729	17.03.2020	119407	16.03.2020
110904	16.03.2020	119720	16.03.2020

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід	(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід
120010	12.03.2020	120318	11.11.2019
120275	11.11.2019	120319	11.11.2019
120307	11.11.2019	120326	11.11.2019
120317	26.02.2020	120338	11.11.2019

Передача виключних майнових прав інтелектуальної власності на винахід

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Ім'я або повне найменування та адреса володільця патенту	Ім'я або повне найменування та адреса правонаступника володільця патенту	Реєстраційний номер рішення
118280	ТАКЕДА ФАРМАСЬЮТИКАЛ КОМПАНІ ЛІМІТЕД, 1-1, Doshomachi 4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka, 5410045, Japan (JP)	СКОГІА ФАРМА, ІНК., 26-1, Muraoka-Higashi 2-chome, Fujisawa-shi, Kanagawa 251-8555, Japan (JP)	4737

Виправлення очевидних помилок у публікаціях відомостей щодо державної реєстрації

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата публікації та номер бюлетеня	Слід читати*
123430	07.04.2021, Бюл. № 14	(57) ... 10. Спосіб модифікації преса (1) для розділення жиромісної маси на рідкий жир і осад, що містить множину притискних елементів (6), розташованих в рамі (2), гідравлічний циліндр і поршень (3, 3а) для здійснення тиску на притискні елементи (6), притискні елементи (6), що містять резервуар (7), що має порожнину (8) для прийому маси, яка має бути спресована, віджимний пристрій (9), розташований щонайменше частково в порожнині (8), і фільтри (11), розташовані перед віджимним пристроєм (9) та на боці порожнини (8) навпроти віджимного пристрою (9), де, в положенні заповнення преса (1), відстань між фільтрами (11) складає від 10 до 80 мм, спосіб відрізняється операцією збільшення діаметра (Dp) порожнини або порожнин таким чином, що відношення (Dc/Dp) діаметра (Dc) гідравлічного циліндра (30) і діаметра (Dp) порожнин (3) стає в межах від 0,9 до 1,15. ...

Відновлення чинності майнових прав інтелектуальної власності

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	(11) Номер реєстрації, що є номером патенту
107977	107978

КОРИСНІ МОДЕЛІ

Зміна імені або повного найменування і/або адреси володільця патенту, чи зміна особи володільця патенту

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	(73) Ім'я або повне найменування та адреса володільця патенту
94235	Акціонерне товариство "Сумське машинобудівне науково-виробниче об'єднання", вул. Горького, 58, м. Суми, 40004
134141	Акціонерне товариство "Сумське машинобудівне науково-виробниче об'єднання", вул. Горького, 58, м. Суми, 40004
140317	Скрипка Олексій Павлович, вул. Магістральна, 27, кв. 68, м. Кривий Ріг, 50055

Припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель у зв'язку із закінченням строку чинності

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель	(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель
62197	24.05.2021	65656	25.05.2021
65165	20.05.2021	66096	20.05.2021
65166	20.05.2021	66377	20.05.2021
65651	23.05.2021	66493	23.05.2021

Припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель у разі несплати річного збору

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель	(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель
58599	11.03.2020	75041	12.03.2020
59043	14.03.2020	75046	13.03.2020
59836	17.03.2020	75048	13.03.2020
62483	14.03.2020	75495	16.03.2020
63107	18.03.2020	75926	16.03.2020
63452	12.03.2020	80185	12.03.2020
63464	14.03.2020	82388	11.03.2020
63490	17.03.2020	82647	14.03.2020
63493	18.03.2020	82655	12.03.2020
63868	15.03.2020	82659	11.03.2020
69561	15.03.2020	83104	11.03.2020
70556	13.03.2020	83120	14.03.2020
70557	13.03.2020	83122	14.03.2020
71516	12.03.2020	83665	11.03.2020
71943	13.03.2020	83876	16.03.2020
72826	12.03.2020	83956	12.03.2020
72840	15.03.2020	83958	14.03.2020
73488	12.03.2020	85862	11.03.2020
73495	13.03.2020	85863	11.03.2020
73502	15.03.2020	87024	15.03.2020
73503	15.03.2020	88821	11.03.2020

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель	(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель
92066	11.03.2020	109164	15.03.2020
92067	11.03.2020	109176	17.03.2020
92078	17.03.2020	109177	17.03.2020
92079	17.03.2020	109178	18.03.2020
92305	12.03.2020	109179	18.03.2020
92318	17.03.2020	109562	14.03.2020
92335	18.03.2020	109563	14.03.2020
92336	18.03.2020	109581	14.03.2020
92581	14.03.2020	109589	15.03.2020
92843	13.03.2020	109591	16.03.2020
92844	14.03.2020	109835	12.03.2020
93171	13.03.2020	109840	14.03.2020
93873	13.03.2020	109841	14.03.2020
93874	18.03.2020	109850	16.03.2020
93875	18.03.2020	110043	11.03.2020
95296	11.03.2020	110054	14.03.2020
99383	13.03.2020	110072	16.03.2020
100236	13.03.2020	110340	11.03.2020
100237	16.03.2020	110360	18.03.2020
100554	12.03.2020	111191	11.03.2020
100555	12.03.2020	111195	16.03.2020
100556	12.03.2020	111198	17.03.2020
100562	16.03.2020	111648	15.03.2020
100563	16.03.2020	115957	16.03.2020
100860	11.03.2020	117980	14.03.2020
100887	16.03.2020	118021	13.03.2020
100888	16.03.2020	118526	13.03.2020
101090	11.03.2020	118534	13.03.2020
101097	12.03.2020	118539	13.03.2020
101100	16.03.2020	118541	14.03.2020
101101	16.03.2020	118548	16.03.2020
101103	16.03.2020	118549	16.03.2020
101108	16.03.2020	118552	16.03.2020
101378	13.03.2020	118784	13.03.2020
101379	13.03.2020	118785	13.03.2020
101383	16.03.2020	118786	13.03.2020
101384	16.03.2020	118795	16.03.2020
101385	17.03.2020	118796	17.03.2020
101606	16.03.2020	119043	14.03.2020
101615	18.03.2020	119045	15.03.2020
102186	13.03.2020	119046	15.03.2020
102536	12.03.2020	119049	16.03.2020
102765	11.03.2020	119335	13.03.2020
103497	13.03.2020	119338	14.03.2020
107630	14.03.2020	119727	15.03.2020
108082	15.03.2020	120030	14.03.2020
109155	14.03.2020	120032	15.03.2020
109156	14.03.2020	120456	17.03.2020
109159	14.03.2020	120487	16.03.2020
109163	15.03.2020	120809	15.03.2020

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель	(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель
121870	13.03.2020	130971	12.03.2020
126382	12.03.2020	131846	14.03.2020
126703	12.03.2020	131855	12.03.2020
126705	14.03.2020	135447	15.03.2020
127063	12.03.2020	136311	11.03.2020
127070	12.03.2020	136313	11.03.2020
127073	12.03.2020	136319	13.03.2020
127078	14.03.2020	136331	14.03.2020
127079	14.03.2020	136589	11.03.2020
127084	14.03.2020	136601	11.03.2020
127085	14.03.2020	136609	12.03.2020
127086	15.03.2020	136625	15.03.2020
127090	16.03.2020	136626	15.03.2020
127091	16.03.2020	136842	12.03.2020
127092	16.03.2020	136850	18.03.2020
127265	15.03.2020	136853	18.03.2020
127389	15.03.2020	136854	18.03.2020
127394	16.03.2020	136988	11.03.2020
127395	16.03.2020	137147	11.03.2020
127463	12.03.2020	137155	18.03.2020
127578	12.03.2020	137156	18.03.2020
127581	15.03.2020	137160	18.03.2020
127582	15.03.2020	137677	11.11.2019
127584	16.03.2020	137678	11.11.2019
127878	12.03.2020	137684	11.11.2019
127883	12.03.2020	137685	11.11.2019
127884	12.03.2020	137686	11.11.2019
127885	12.03.2020	137687	11.11.2019
127898	15.03.2020	137688	11.11.2019
127900	15.03.2020	137689	11.11.2019
127902	15.03.2020	137691	11.11.2019
127904	15.03.2020	137695	11.11.2019
127908	15.03.2020	137698	11.11.2019
127910	15.03.2020	137699	11.11.2019
127918	16.03.2020	137701	11.11.2019
128212	14.03.2020	137703	11.11.2019
128216	14.03.2020	137705	11.11.2019
128529	15.03.2020	137706	11.11.2019
128530	15.03.2020	137707	11.11.2019
128533	16.03.2020	137708	11.11.2019
128534	16.03.2020	137709	11.11.2019
128737	12.03.2020	137710	11.11.2019
128739	12.03.2020	137711	11.11.2019
129073	14.03.2020	137712	11.11.2019
129582	12.03.2020	137713	11.11.2019
129899	12.03.2020	137718	11.11.2019
129900	12.03.2020	137721	11.11.2019
129921	15.03.2020	137722	11.11.2019
130447	17.03.2020	137723	11.11.2019
130649	14.03.2020	137725	11.11.2019

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель	(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель
137727	11.11.2019	137783	11.11.2019
137728	11.11.2019	137784	11.11.2019
137729	11.11.2019	137785	11.11.2019
137730	11.11.2019	137786	11.11.2019
137731	11.11.2019	137787	11.11.2019
137732	11.11.2019	137788	11.11.2019
137733	11.11.2019	137789	11.11.2019
137734	11.11.2019	137796	11.11.2019
137736	11.11.2019	137797	11.11.2019
137737	11.11.2019	137798	11.11.2019
137738	11.11.2019	137799	11.11.2019
137739	11.11.2019	137800	11.11.2019
137740	11.11.2019	137801	11.11.2019
137741	11.11.2019	137802	11.11.2019
137742	11.11.2019	137803	11.11.2019
137743	11.11.2019	137804	11.11.2019
137744	11.11.2019	137805	11.11.2019
137745	11.11.2019	137809	11.11.2019
137746	11.11.2019	137810	11.11.2019
137747	11.11.2019	137811	11.11.2019
137748	11.11.2019	137812	11.11.2019
137749	11.11.2019	137813	11.11.2019
137750	11.11.2019	137814	11.11.2019
137751	11.11.2019	137815	11.11.2019
137752	11.11.2019	137816	11.11.2019
137753	11.11.2019	137817	11.11.2019
137754	11.11.2019	137818	11.11.2019
137755	11.11.2019	137819	11.11.2019
137756	11.11.2019	137820	11.11.2019
137757	11.11.2019	137822	11.11.2019
137758	11.11.2019	137823	11.11.2019
137759	11.11.2019	137824	11.11.2019
137760	11.11.2019	137825	11.11.2019
137762	11.11.2019	137826	11.11.2019
137763	11.11.2019	137827	11.11.2019
137764	11.11.2019	137828	11.11.2019
137765	11.11.2019	137829	11.11.2019
137766	11.11.2019	137830	11.11.2019
137767	11.11.2019	137831	11.11.2019
137768	11.11.2019	137832	11.11.2019
137769	11.11.2019	137833	11.11.2019
137770	11.11.2019	137834	11.11.2019
137771	11.11.2019	137835	11.11.2019
137772	11.11.2019	137836	11.11.2019
137773	11.11.2019	137837	11.11.2019
137774	11.11.2019	137838	11.11.2019
137775	11.11.2019	137839	11.11.2019
137778	11.11.2019	137840	11.11.2019
137780	11.11.2019	137841	11.11.2019
137782	11.11.2019	137842	11.11.2019

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель	(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель
137843	11.11.2019	137906	11.11.2019
137844	11.11.2019	137907	11.11.2019
137845	11.11.2019	137908	11.11.2019
137846	11.11.2019	137910	11.11.2019
137847	11.11.2019	137911	11.11.2019
137848	11.11.2019	137914	11.11.2019
137851	11.11.2019	137915	11.11.2019
137852	11.11.2019	137921	11.11.2019
137853	11.11.2019	137927	11.11.2019
137854	11.11.2019	137933	11.11.2019
137855	11.11.2019	137935	11.11.2019
137858	11.11.2019	137936	11.11.2019
137859	11.11.2019	137939	11.11.2019
137860	11.11.2019	137940	11.11.2019
137861	11.11.2019	137941	11.11.2019
137862	11.11.2019	137942	11.11.2019
137863	11.11.2019	137943	11.11.2019
137864	11.11.2019	137944	11.11.2019
137866	11.11.2019	137945	11.11.2019
137867	11.11.2019	137946	11.11.2019
137869	11.11.2019	137948	11.11.2019
137870	11.11.2019	137953	11.11.2019
137871	11.11.2019	137954	11.11.2019
137872	11.11.2019	137955	11.11.2019
137873	11.11.2019	137956	11.11.2019
137875	11.11.2019	137958	11.11.2019
137876	11.11.2019	137963	11.11.2019
137877	11.11.2019	137964	11.11.2019
137878	11.11.2019	137965	11.11.2019
137879	11.11.2019	137966	11.11.2019
137880	11.11.2019	137969	11.11.2019
137881	11.11.2019	137973	11.11.2019
137882	11.11.2019	137974	11.11.2019
137883	11.11.2019	137979	11.11.2019
137884	11.11.2019	137982	11.11.2019
137885	11.11.2019	137983	11.11.2019
137887	11.11.2019	137989	11.11.2019
137889	11.11.2019	137990	11.11.2019
137890	11.11.2019	137992	11.11.2019
137891	11.11.2019	137994	11.11.2019
137893	11.11.2019	138000	11.11.2019
137894	11.11.2019	138001	11.11.2019
137896	11.11.2019	138002	11.11.2019
137897	11.11.2019	138004	11.11.2019
137898	11.11.2019	138006	11.11.2019
137901	11.11.2019	138007	11.11.2019
137902	11.11.2019	138008	11.11.2019
137903	11.11.2019	138010	11.11.2019
137904	11.11.2019	138011	11.11.2019
137905	11.11.2019	138014	11.11.2019

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель	(11) Номер реєстрації, що є номером патенту	Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель
138015	11.11.2019	138028	11.11.2019
138018	11.11.2019	138029	11.11.2019
138019	11.11.2019	138033	11.11.2019
138020	11.11.2019	138034	11.11.2019
138024	11.11.2019	138041	11.11.2019
138027	11.11.2019	138052	11.11.2019

Відновлення чинності майнових прав інтелектуальної власності

(11) Номер реєстрації, що є номером патенту
136798

ЗМІСТ

Офіційні повідомлення	1.1
Зміни до відомостей про представників у справах інтелектуальної власності	1.1
Відомості про заявки на винаходи	2.1
Розділ А: Життєві потреби людини	2.1
Розділ В: Виконання операцій. Транспортування	2.5
Розділ С: Хімія. Металургія	2.6
Розділ F: Машинобудування. Освітлювання. Опалювання.	
Зброя. Підривні роботи	2.9
Розділ G: Фізика	2.10
Розділ H: Електрика	2.11
Відомості про державну реєстрацію винаходів	3.1
Розділ А: Життєві потреби людини	3.1
Розділ В: Виконання операцій. Транспортування	3.17
Розділ С: Хімія. Металургія	3.24
Розділ E: Будівництво	3.106
Розділ F: Машинобудування. Освітлювання. Опалювання.	
Зброя. Підривні роботи	3.107
Розділ G: Фізика	3.111
Розділ H: Електрика	3.119
Відомості про державну реєстрацію корисних моделей	4.1
Розділ А: Життєві потреби людини	4.1
Розділ В: Виконання операцій. Транспортування	4.7
Розділ С: Хімія. Металургія	4.13
Розділ D: Текстиль та папір	4.16
Розділ E: Будівництво	4.17
Розділ F: Машинобудування. Освітлювання. Опалювання.	
Зброя. Підривні роботи	4.19
Розділ G: Фізика	4.22
Розділ H: Електрика	4.26

Сповіщення	6.1.1
Винаходи	6.1.1
Зміна імені або повного найменування і/або адреси володільця патенту, чи зміна особи володільця патенту	6.1.1
Припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід у зв'язку із закінченням строку чинності	6.1.1
Припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід у разі несплати річного збору	6.1.1
Передача виключних майнових прав інтелектуальної власності на винахід	6.1.3
Виправлення очевидних помилок у публікаціях відомостей щодо державної реєстрації	6.1.3
Відновлення чинності майнових прав інтелектуальної власності	6.1.3
Корисні моделі	6.2.1
Зміна імені або повного найменування і/або адреси володільця патенту, чи зміна особи володільця патенту	6.2.1
Припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель у зв'язку із закінченням строку чинності	6.2.1
Припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель у разі несплати річного збору	6.2.1
Відновлення чинності майнових прав інтелектуальної власності	6.2.6

ПРОМИСЛОВА ВЛАСНІСТЬ

**ВИНАХОДИ
КОРИСНІ МОДЕЛІ
КОМПОНУВАННЯ НАПІВПРОВІДНИКОВИХ
ВИРОБІВ**

**Бюлетень № 22, 2021
Том 1**

Відповідальний за випуск

І.Є. Матусевич

Редагування:

Добриніна І.В.
Белоус Т.П.
Грицай Н.П.
Козирева В.Д.
Кондраток О.В.
Кондратська Н.Й.
Кухар І.В.

Мартинюк А.І.
Солодовник А.О.
Харченко Р.Ч.

Комп'ютерна верстка:

Андрусенко Я.В.
Гуцалюк О.В.
Казбан М.М.
Мироненко І.М.