

Ўзбекистон Республикаси
Давлат патент идораси



РАСМИЙ АХБОРОТНОМА

1993 йилдан бошлаб нашр этилади

- Ихтиролар
- Фойдали моделлар
- Саноат намуналари
- Товар белгилари
- Товар келиб чиққан жой номлари
- ЭХМ учун дастурлар
- Маълумотлар базалари
- Интеграл микросхемалар топологиялари
- Селекция ютуқлари

(43) Ушбу ахборотномага киритилган селекция ютуқларига талабномалар тўғрисидаги маълумотлар **2008 йил 30 апрелдан** чоп этилган деб ҳисобланади

(45) Ушбу ахборотномага киритилган саноат намуналарига муҳофаза ҳужжатлари тўғрисидаги маълумотлар **2008 йил 30 апрелдан** чоп этилган деб ҳисобланади

(450) Ушбу ахборотномага киритилган товар белгиларига гувоҳномалар тўғрисидаги маълумотлар **2008 йил 30 апрелдан** чоп этилган деб ҳисобланади

(46) Ушбу ахборотномага киритилган ихтироларга, фойдали моделларга, селекция ютуқларига, ЭХМ учун дастурларга, маълумотлар базаларига муҳофаза ҳужжатлари тўғрисидаги маълумотлар **2008 йил 30 апрелдан** чоп этилган деб ҳисобланади

Тошкент
2008 йил

4(84)

I-қисм

(19) UZ

Государственное патентное ведомство
Республики Узбекистан



ОФИЦИАЛЬНЫЙ БЮЛЛЕТЕНЬ

Издается с 1993 года

- Изобретения
- Полезные модели
- Промышленные образцы
- Товарные знаки
- Наименования мест происхождения товаров
- Программы для ЭВМ
- Базы данных
- Топологии интегральных микросхем
- Селекционные достижения

(43) Сведения о заявках на селекционные достижения, помещенные в настоящем бюллетене, считаются опубликованными **30 апреля 2008 года**

(45) Сведения об охраняемых документах на промышленные образцы, помещенные в настоящем бюллетене, считаются опубликованными **30 апреля 2008 года**

(450) Сведения о свидетельствах на товарные знаки, помещенные в настоящем бюллетене, считаются опубликованными **30 апреля 2008 года**

(46) Сведения об охраняемых документах на изобретения, полезные модели, селекционные достижения, программы для ЭВМ, базы данных, помещенные в настоящем бюллетене, считаются опубликованными **30 апреля 2008 года**

Ташкент
2008 год

4(84)

I часть

МУНДАРИЖА

I	ИХТИРОЛАР	
	Ихтиролар ва фойдали моделларга оид библиография маълумотларини айнанлаштириш учун халқаро кодлар (БИМТ ST.9 стандарти)	5
	Ихтиролар Давлат реестри рўйхатидан ўтказилган ихтиролар ҳақида маълумотларни нашр қилиш	
	1.1. FG4A Ихтироларга патентлар	
	A. Инсон ҳаётий эҳтиёжларини қондириш	6
	B. Турли технологик жараёнлар	31
	C. Кимё ва металлургия	84
	E. Қурилиш; тоғ ишлари	269
	F. Механика; ёритиш; иситиш; двигателлар ва насослар; портлатиш ишлари	270
	G. Физика	271
	H. Электр	275
	1.5. FG4A Ихтироларга патент талабномаларнинг тизимли ва рақамли кўрсаткичлари	
	1.1-бўлим учун ихтироларга патентларнинг тизимли кўрсаткичи	276
	1.1-бўлим учун ихтироларга талабномаларнинг рақамли кўрсаткичи	277
	1.1-бўлим учун ихтиролар муаллифларининг ном кўрсаткичи	278
II	Фойдали моделлар	
	Фойдали моделлар Давлат реестри рўйхатидан ўтказилган фойдали моделлар ҳақида маълумотларни нашр қилиш	
	2.1. FG4K Фойдали моделларга патентлар	
	A. Инсон ҳаётий эҳтиёжларини қондириш	280
	B. Турли технологик жараёнлар	280
	D. Текстиль ва қоғоз	281
	2.2. FG4K Фойдали моделларга патентларнинг тизимли ва рақамли кўрсаткичлари.	
	Фойдали моделларга патент ва талабномаларнинг тизимли кўрсаткичи	282
	Фойдали моделларга талабномалар бўйича рақамли кўрсаткич	282
	Фойдали моделлар муаллифларининг ном кўрсаткичи	283
III	САНОАТ НАМУНАЛАРИ	
	Саноат намуналарига оид библиография маълумотларини айнанлаштириш учун халқаро кодлар (БИМТ ST.80 стандарти)	284
	Саноат намуналари Давлат реестри рўйхатидан ўтказилган саноат намуналари ҳақида маълумотларни нашр қилиш	
	3.1. FG4L Саноат намуналарига патентлар	285
	3.2. FG4L Саноат намуналарига патент ва талабномаларнинг тизимли ва рақамли кўрсаткичлари	288
IV	ТОВАР БЕЛГИЛАРИ	
	Товар белгиларига оид библиография маълумотларини айнанлаштириш учун халқаро кодлар (БИМТ ST.60 стандарти)	289
	4.1. FG4W Товар белгилари Давлат реестри рўйхатидан ўтказилган товар белгилари ҳақида маълумотларни нашр қилиш	290
	4.2. FG4W Товар белгиларига гувоҳномалар ва талабномалар бўйича тизимли ва рақамли кўрсаткичлар	473
VI	ЭҲМ УЧУН ДАСТУРЛАР	
	ЭҲМ учун дастурлар ва маълумотлар базаларига оид библиография маълумотларини айнанлаштириш учун кодлар	479
	6.1. ЭҲМ учун дастурлар Давлат реестри рўйхатидан ўтказилган ЭҲМ учун дастурлар ҳақида маълумотларни нашр қилиш	480
	6.2 ЭҲМ дастурларига талабномаларнинг рақамли кўрсаткичи	489
VII	МАЪЛУМОТЛАР БАЗАЛАРИ	
	7.1. Маълумотлар базалари Давлат реестри рўйхатидан ўтказилган маълумотлар базалари ҳақида маълумотларни нашр қилиш	490
	7.2. Маълумотлар базаларига талабномаларнинг рақамли кўрсаткичи	491
X	ИНТЕЛЛЕКТУАЛ МУЛК ОБЪЕКТЛАРИГА ҲУҚУҚНИ ТОПШИРИШ БЎЙИЧА ШАРТНОМАЛАР	
	10.1. QB4A Лицензия шартномалари	492
	10.2. PC4W Ҳуқуқни бошқа шахсга ўтказиш шартномалари	492
XI	РАСМИЙ АХБОРОТЛАР	493
XII	ХАБАРЛАР	
	ND4W Ўзбекистон Республикасининг товар белгисига берилган гувоҳномаларининг амал қилиш муддатини узайтириш	501
	PD4A Ўзбекистон Республикасининг ихтирога берилган патент эгасининг номини ўзгартириш	502
	PD4W Ўзбекистон Республикасининг товар белгисига берилган гувоҳнома эгасининг номини ўзгартириш	502
	TE4W Ўзбекистон Республикасининг товар белгисига берилган гувоҳнома эгасининг манзилгоҳини ўзгартириш	503
	Товар белгисига гувоҳнома дубликатини бериш	504
XIV	РЎЙХАТГА ОЛИНГАН ТОВАР БЕЛГИЛАРИ РАНГЛИ ТАСВИРЛАРИНИНГ ИФОДАСИ	505

СОДЕРЖАНИЕ

I	ИЗОБРЕТЕНИЯ	
	Международные коды для идентификации библиографических данных, относящихся к изобретениям и полезным моделям (Стандарт ВОИС ST.9)	5
	Публикация сведений об изобретениях, зарегистрированных в Государственном реестре изобретений	
	1.1. FG4A Патенты на изобретения	
	А. Удовлетворение жизненных потребностей человека	6
	В. Различные технологические процессы	31
	С. Химия и металлургия	84
	Е. Строительство; горное дело	269
	Г. Механика; освещение; отопление; двигатели и насосы; взрывные работы	270
	Г. Физика	271
	Н. Электричество	275
	1.5. FG4A Систематический и нумерационный указатели патентов и заявок на изобретения	
	Систематический указатель патентов на изобретения к подразделу 1.1	276
	Нумерационный указатель заявок на изобретения к подразделу 1.1	277
	Именной указатель авторов изобретений к подразделу 1.1	278
II	ПОЛЕЗНЫЕ МОДЕЛИ	
	Публикация сведений о полезных моделях, зарегистрированных в Государственном реестре полезных моделей	
	2.1. FG4K Патенты на полезные модели	
	А. Удовлетворение жизненных потребностей человека	280
	В. Различные технологические процессы	280
	Г. Механика; освещение; отопление; двигатели и насосы; взрывные работы	281
	2.2. FG4K Систематический и нумерационный указатели патентов и заявок на полезные модели	
	Систематический указатель патентов на полезные модели	282
	Нумерационный указатель заявок на полезные модели	282
	Именной указатель авторов полезных моделей	283
III	ПРОМЫШЛЕННЫЕ ОБРАЗЦЫ	
	Международные коды для идентификации библиографических данных, относящихся к промышленным образцам (Стандарт ВОИС ST.80)	284
	Публикация сведений о промышленных образцах, зарегистрированных в Государственном реестре промышленных образцов	
	3.1. FG4L Патенты на промышленные образцы	285
	3.2. FG4L Систематический и нумерационный указатели патентов и заявок на промышленные образцы	288
IV	ТОВАРНЫЕ ЗНАКИ	
	Международные коды для идентификации библиографических данных, относящихся к товарным знакам (Стандарт ВОИС ST.60)	289
	4.1. FG4W Публикация сведений о товарных знаках, зарегистрированных в Государственном реестре товарных знаков	290
	4.2. FG4W Систематический и нумерационный указатели свидетельств и заявок на товарные знаки	473
VI	ПРОГРАММЫ ДЛЯ ЭВМ	
	Коды для идентификации библиографических данных, относящихся к программам для ЭВМ и базам данных	479
	6.1. Публикация сведений о программах для ЭВМ, зарегистрированных в Государственном реестре программ для ЭВМ	480
	6.2. Нумерационный указатель заявок на программы для ЭВМ	489
VII.	БАЗЫ ДАННЫХ	
	7.1. Публикация сведений о базах данных, зарегистрированных в Государственном реестре базы данных	490
	7.2. Нумерационный указатель заявок на базы данных	491
X	ДОГОВОРЫ О ПЕРЕДАЧЕ ПРАВ НА ОБЪЕКТЫ ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ	
	10.1. QB4W Лицензионные договоры	492
	10.2. PC4W Договоры о передаче прав	492
XI	ОФИЦИАЛЬНЫЕ СООБЩЕНИЯ	493
XII	ИЗВЕЩЕНИЯ	
	ND4W Продление срока действия свидетельства Республики Узбекистан на товарный знак	501
	PD4A Изменение наименования патентообладателя патента Республики Узбекистан на изобретения	502
	PDW4. Изменение наименования владельца свидетельства Республики Узбекистан на товарный знак	502
	TE4W Изменение адреса владельца свидетельства Республики Узбекистан на товарный знак	503
	Выдача дубликата свидетельства на товарный знак	504
XIV	ВОСПРОИЗВЕДЕНИЕ ЦВЕТНЫХ ИЗОБРАЖЕНИЙ ЗАРЕГИСТРИРОВАННЫХ ТОВАРНЫХ ЗНАКОВ ..	505

**ИХТИРОЛАР ВА ФОЙДАЛИ МОДЕЛЛАРГА ОИД БИБЛИОГРАФИЯ
МАЪЛУМОТЛАРИНИ АЙНАНЛАШТИРИШ УЧУН ХАЛҚАРО КОДЛАР
(БИМТ ST.9 стандарти)**

**МЕЖДУНАРОДНЫЕ КОДЫ ДЛЯ ИДЕНТИФИКАЦИИ
БИБЛИОГРАФИЧЕСКИХ ДАННЫХ, ОТНОСЯЩИХСЯ
К ИЗОБРЕТЕНИЯМ И ПОЛЕЗНЫМ МОДЕЛЯМ
(Стандарт ВОИС ST.9)**

- | | |
|--|---|
| (11) - патент рақами | (11) - номер патента |
| (13) - ҳужжат турининг коди | (13) - код вида документа |
| (21) - талабномани рўйхатдан ўтказиш рақами | (21) - регистрационный номер заявки |
| (22) - талабномани топшириш санаси | (22) - дата подачи заявки |
| (23) - аввал берилган талабномага қўшимча материалларнинг келиш санасини киритган ҳолда бошқа сана (саналар) | (23) - прочая(ие) дата(ы), включая дату поступления дополнительных материалов к более ранней заявке |
| (31) - устуворлик талабномасининг рақами | (31) - номер приоритетной заявки |
| (32) - устуворлик талабномасининг топширилиш санаси | (32) - дата подачи приоритетной заявки |
| (33) - устуворлик мамлакатининг коди | (33) - код страны приоритета |
| (46) - муҳофаза ҳужжатининг чоп этилиш санаси | (46) - дата публикации охранного документа |
| (51) - Халқаро патент классификациянинг (ХПК) индекси(лари) | (51) - индекс(ы) Международной патентной классификации (МПК) |
| (54) - ихтиро номи | (54) - название изобретения |
| (57) - ихтиро ёки фойдали моделнинг реферати, формуласи | (57) - реферат, формула изобретения или полезной модели |
| (60) - бошқа ҳуқуқий ёки расмийлаштириш билан боғлиқ миллий ёки собиқ миллий патент ҳужжатларига ҳавола қилиниш | (60) - ссылки на другие юридически или процедурно связанные отечественные или бывшие отечественные патентные документы |
| (63) - ушбу ҳужжат давоми ҳисобланган, илгарироқ берилган талабноманинг рақами ва санаси | (63) - номер и дата подачи более ранней заявки, по отношению к которой настоящий документ является продолжением |
| (65) - ушбу талабномага тегишли илгари нашр қилинган патент ҳужжатларининг рақами | (65) - номер ранее опубликованного патентного документа, касающегося данной заявки |
| (71) - талабнома берувчининг номи, мамлакат коди | (71) - имя заявителя, код страны |
| (72) - муаллифнинг номи, мамлакат коди | (72) - имя автора, код страны |
| (73) - патентга эгалик қилувчининг номи | (73) - имя патентообладателя |
| (85) - РСТнинг 23(1) ёки 40(1) - моддасига мувофиқ халқаро талабноманинг миллий босқичга ўтиш санаси | (85) - дата перехода международной заявки на национальную фазу в соответствии со ст.23(1) или 40(1) РСТ |
| (86) - РСТ халқаро талабномага берилган маълумотлар, яъни талабнома топширилган сана, талабноманинг рўйхатдан ўтказилган рақами, нашр қилинган талабноманинг дастлабки топширилгандаги тили- ихтиёрий равишда | (86) - заявочные данные международной заявки РСТ, т.е. дата подачи заявки, регистрационный номер заявки и факультативно язык, на котором была первоначально подана опубликованная заявка |
| (87) - РСТ халқаро талабномасининг нашр қилинишга оид маълумотлар, яъни талабноманинг нашр қилинган санаси, нашр рақами ва ихтиёрий равишда талабнома нашр қилинган тил | (87) - данные относительно публикации международной заявки РСТ, т.е. дата публикации, номер публикации и факультативно язык публикации заявки |

I. ИХТИРОЛАР ИЗОБРЕТЕНИЯ

Ихтиролар Давлат реестри рўйхатидан ўтказилган ихтиролар ҳақида маълумотларни нашр қилиш

Публикация сведений об изобретениях, зарегистрированных в Государственном реестре изобретений

1.1. FG4A

ИХТИРОЛАРГА ПАТЕНТЛАР ПАТЕНТЫ НА ИЗОБРЕТЕНИЯ

А бўлими
ИНСОН ҲАЁТИЙ ЭҲТИЁЖЛАРИНИ
ҚОНДИРИШ

Раздел А
УДОВЛЕТВОРЕНИЕ ЖИЗНЕННЫХ
ПОТРЕБНОСТЕЙ ЧЕЛОВЕКА

A 01

- | | |
|---|------------------------|
| (11) IAP 03618 | (13) C |
| (51) 8 A 01 B 49/00 | |
| (21) IAP 2005 0363 | (22) 13.10.2005 |
| (71)(73) Қарши мухандислик иктисодиёт институти, UZ | |
| Каршинский инженерно-экономический институт, UZ | |
| (72) Маматов Фармон Муртозевич, Чуянов Дустмурот Шодмонович, Худояров Бердирасул Мирзаевич, Эргашев Гайрат Худоярович, Гулбоев Сухроб Исломович, Зоиров Уткир Зиятович, Ризокулов Ботир Баратович, Дустёров Шерзод Норсубхонович, UZ | |
| (54) Тупроққа ишлов бериш ва экиш учун мужассамлашган қурол | |
| Комбинированное орудие для обработки почвы и посева | |

(57) 1. Таркибига рама, дала учун қирғоқлари бир-бирига қараган ва асбобнинг симметрия ўқи бўйлаб жойлашган ўнг – ва сўлга буриладиган плуг учун корпуслар, заплужниклар ва уларнинг ортидан кетма-кетма ўрнатилган тупроқ қовлагичлар, ер юмшатувчи – текисловчи каток, жўякясагич ва корпусларнинг ён томонида жойлашган ер юмшатгичлар кирган тупроққа ишлов бериш ва экиш учун комбинацияланган асбоб шу билан ф а р қ л а н а д и к и, жўяк ясагичларнинг орқасида корпусларнинг камраб олиш кенглиги бўйлаб ўнг ва сўл экув-

чи аппаратлар ўрнатилган, бунда плуг учун корпуслар лемехлари пичоқларининг ўрнатиш баландлиги ён томондаги ер юмшатгичларни ўрнатиш баландлигидан ошмайди, шунинг билан бирга ўнг ва сўл экувчи аппаратлар бир-биридан тупроқ қовлагичлар орасидаги масофага тенг масофада жойлашган.

2. 1-банд бўйича асбоб шу билан ф а р қ л а н а д и к и, ҳар бир тупроқ қовлагич мос корпус лемехи пичоғининг учидан лемехнинг ер юмшатгичга нисбатан жойлашиш баландлигидан кам бўлмаган масофада жойлашган.

3. 1-банд бўйича асбоб шу билан ф а р қ л а н а д и к и, ер юмшатувчи – текисловчи катокнинг ўрта қисми асослари билан бир-бирига қараган, иккита кесилган конуслар шаклида қилинган.

1. Комбинированное орудие для обработки почвы и посева, содержащее раму, право- и лево-оборачивающие плужные корпуса, полевые обрезающие которых обращены друг к другу и расположены по оси симметрии орудия, заплужники и за ними последовательно установленные почвоуглубители, рыхлительно-выравнивающий каток, бороздоделатель и рыхлители, расположенные сбоку корпусов, о т л и ч а ю щ е е с я тем, что по ширине захвата корпусов за бороздоделателем установлены правый и левый высевающие аппараты, при этом высота установки лезвий лемехов плужных корпусов не превышает высоты установки боковых рыхлителей, причем правый и левый высевающие аппараты расположены на расстоянии друг от друга равном расстоянию между почвоуглубителями.

2. Орудие по п. 1, о т л и ч а ю щ е е с я тем, что каждый почвоуглубитель расположен от конца лезвия лемеха соответствующего корпу-

са на расстоянии не менее высоты расположения лемеха относительно почвоуглубителя.
3. Орудие по п. 1, отличающееся тем, что средняя часть рыхлительно-выравнивающего катка выполнена в виде двух усеченных конусов, обращенных основаниями друг к другу.

A 61

(11) IAP 03619

(13) C

(51) 8 A 61 K 9/107, A 61 K 31/366, A 61 K 31/4427, A 61 P 31/00

(21) IAP 2003 0800

(22) 30.10.2001

(31)(32)(33) 60/244,434, 31.10.2000, US

(71)(73) БЭРИНГЕР Ингельхайм Фармасьютикалс, Инк., US

(72) ЧЕН, Ширлин; ГАНН, Джоселин А., US

(85) 30.05.2003

(86) PCT/US 01/48683, 30.10.2001

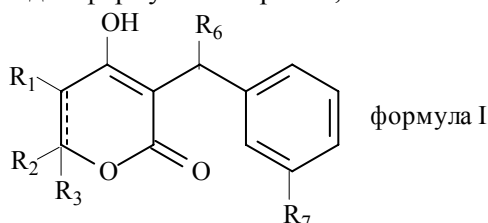
(87) WO 02/36110, 10.05.2002

(54) Пиранонлар синфига кирувчи протеаза ингибиторларининг ўз-ўзидан эмулгирланувчи перорал дори композициялари

Пероральные лекарственные самоэмульгирующие композиции ингибиторов протеазы из класса пиранонов

(57) 1. Таркибида камида 0,5% этанол ва пропиленгликоль бўлган фармацевтик композиция ичига қуйидагилар кирради:

(а) фармацевтик фаолликка эга бўлган агент сифатида I формулани пиранон,



бу ерда R₁ билан H- белгиланган;

R₂ билан C₃-C₅алкил, фенил(CH₂)₂-, het-SO₂NH-(CH₂)₂-, циклопропил(CH₂)₂-,

F-фенил(CH₂)₂-, het-SO₂NH-фенил-, ёки F₃C-(CH₂)₂- белгиланган; ёки

R₁ ва R₂ биргаликда иккиланган алоқани билдиради;

R₃ билан R₄-(CH₂)_n-CH(R₅)-, H₃C-[O(CH₂)₂]₂-CH₂-, C₃-C₅алкил, фенил(CH₂)₂-, het-SO₂NH-(CH₂)₂-,

(HOCH₂)₃C-NH-C(O)-NH-(CH₂)₃-,

(HO₂C)(H₂N)CH-(CH₂)₂-C(O)-NH-(CH₂)₃-,

пиперазин-1-ил-C(O)-NH-(CH₂)₃,

HO₃S(CH₂)₂-N(CH₃)-C(O)-(CH₂)₆-C(O)-NH-

(CH₂)₃-, циклопропил(CH₂)₂-, F-фенил-(CH₂)₂-, het-SO₂NH-фенил или F₃C-(CH₂)₂- белгиланган;

n = 0, 1 ёки 2;

R₄ билан фенил, het, циклопропил, H₃C-[O(CH₂)₂]₂-, het-SO₂NH-, Br-, N₃- ёки HO₃S(CH₂)₂-N(CH₃)-C(O)-(CH₂)₆-C(O)-NH- белгиланган;

R₅ билан -CH₂-CH₃ или -CH₂-циклопропил белгиланган;

R₆ билан циклопропил, CH₃-CH₂- ёки трет-бутил белгиланган;

R₇ билан -NR₈SO₂-het, -NR₈SO₂-фенил, унинг R₉ билан алмаштирилган бўлиши ўшарт эмас, -CH₂-SO₂-фенил, унинг R₉ ёки -CH₂-SO₂-het билан алмаштирилган бўлиши шарт эмас, белгиланган;

R₈ билан -H ёки -CH₃ белгиланган;

R₉ билан -CN, -F, -OH ёки -NO₂ белгиланган;

het билан 5, 6 ёки 7 хадли тўйинтирилган ёки тўйинтирилмаган ҳалқа белгиланиб, унинг таркибига азот, кислород ва олтингугуртдан иборат гуруҳдан танлаб олинган 1-3 та гетероатом кирради;

ҳамда ҳар қандай бициклик гуруҳни ўз ичига оладики, унда юқорида кўрсатиб ўтилган гетероциклик ҳалқаларнинг ҳар қайсиси бензол ҳалқаси ёки -CH₃, -CN, -OH, -C(O)OC₂H₅, -CF₃, -NH₂ ёки -C(O)-NH₂ билан ўрин алмашиши шарт бўлмаган бошқа гетероцикл билан конденсацияланади;

ёки ушбу бициклик гуруҳнинг фармацевтик мақбул тузини ўз ичига олади;

бу ерда I формула бирикмаси бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 1% дан тахминан 40% гача миқдорда мавжуд бўлади; (б) битта ёки бир нечта фармацевтик мақбул юзаки-фаол моддалар;

(в) ўртача молекуляр массаси 300 дан юқори, аммо 600 дан кам бўлган полиэтиленгликоль, бу ерда полиэтиленгликоль бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 1% дан тахминан 40% гача миқдорда мавжуд бўлади; ва

(г) бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 0,1% дан тахминан 10% гача миқдорда мавжуд бўлган асосий амин, бу ерда асосий амин алкиламин (энг пасти), асосий аминокислота ёки холин гидроксидини билдирадики, бу ерда алкиламин (энг пасти) ни этанол-амин, диэтанол-амин, триэтанол-амин, этиленди-амин, диметиламиноэтанол ёки трис(гидроксиметил)аминометандан танлаб оладики;

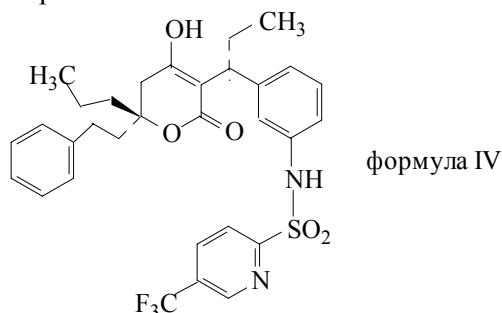
2. 1-банд бўйича фармацевтик композиция таркибида қўшимча равишда бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 5% дан тахминан 35% гача миқдорда диглицерид и моноглицеридлар аралашмаси мавжуд.

3. 2-банд бўйича фармацевтик композиция, бу ерда диглицерид и моноглицеридлар аралашма-

си киприл ва каприн кислоталарининг моно ва диглицерид аралашмасини билдиради.

4. 2-банд бўйича фармацевтик композиция, бу ерда диглицерид и моноглицеридлар моно- ёки дитўйинтирилган ёғли кислоталар ва глицерин эфирларини билдириб, бу эфирлар 8 тадан то 10 тагача углерод атомларидан иборат занжирга эга.

5. 1-банд бўйича фармацевтик композиция, бу ерда I формулани пиранон IV формула бирикмасидан иборат

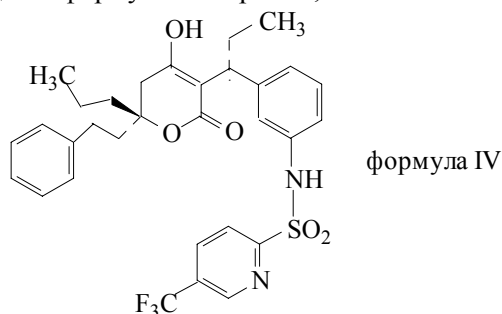


6. 1-банд бўйича фармацевтик композиция, бу ерда полиэтиленгликоль тахминан 400 ўртача молекуляр массага эга.

7. 1-банд бўйича фармацевтик композиция, бу ерда юзаки-фаол модда бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 20% дан тахминан 60% гача миқдорда мавжуд.

8. 1-банд бўйича фармацевтик композиция қуйидагиларни ўз ичига олади:

(а) бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 1% дан тахминан 40% гача миқдорда IV формулани пиранон;



(б) бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 5% дан тахминан 35% гача мавжуд бўлган липофил фаза;

(в) бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 10% дан тахминан 40% гача миқдордаги ўртача молекуляр массаси тахминан 300 дан ортиқ, аммо тахминан 600 дан кам бўлган полиэтиленгликоль;

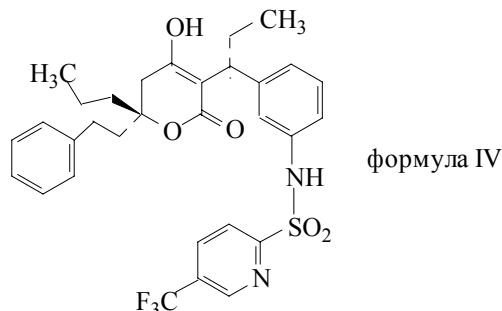
(г) полиоксилланган канақунжут мойи, полиоксизэтиленглицеринтририцинолеат ва тўйинтирилган полиглицоллаштирилган каприн-каприн глицеридини ўз ичига олган гуруҳдан танлаб олинган, бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 20% дан тахминан 60% гача миқдордаги юзаки-фаол модда; ва

(д) алкиламин (энг пасти), асосий аминокислота ёки холин гидроксидини ўз ичига олган гуруҳдан танлаб олинган асосий амин, бу ерда гап бораётган асосий амин бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 0,1% дан тахминан 10% гача миқдорда мавжуд бўлиб, бунда алкиламин (энг пасти) ни этаноламин, диэтианоламин, триэтианоламин, этилендиамин, диметиламиноэтанол ёки трис(гидроксиметил)аминометандан таркиб топган гуруҳдан танлаб оладилар.

9. 8-банд бўйича фармацевтик композиция, бу ерда липофил фаза диглицеридлар ва моноглицеридлар аралашмасини билдиради.

10. 1-банд бўйича фармацевтик композиция қуйидагиларни ўз ичига олади:

(а) бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 1% дан тахминан 40% гача миқдорда IV формулани пиранон



(б) киприл ва каприн кислоталарининг моно ва диглицерид аралашмасини ўз ичига олган гуруҳдан танлаб олинган липофил фаза,

полиэтиленгликолнинг ёғли қаторидаги моно, ди ва триглицеридли ва моно ва ди мураккаб эфирлар аралашмаси, бу ерда олеин кислотасидан иборат ёғли кислота ва каприн ва каприн кислоталари триглицеридларининг аралашмаси устунлик қилади, ва

юқорида айтиб ўтилганларнинг композицияси, бу ерда где липофил фаза бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 5% дан тахминан 35% гача миқдорда мавжуд;

(в) ўртача молекуляр массаси тахминан 300 дан ортиқ, аммо тахминан 600 дан кам бўлган, бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 10% дан тахминан 40% гача миқдордаги полиэтиленгликоль;

(г) полиоксилланган канақунжут мойи, полиоксизэтиленглицеринтририцинолеат ва тўйинтирилган полиглицоллаштирилган каприн-каприн глицеридини ўз ичига олган гуруҳдан танлаб олинган, бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 20% дан тахминан 60% гача миқдордаги юзаки-фаол модда; ва

(д) алкиламин (энг пасти), асосий аминокислота ёки холин гидроксидини ўз ичига олган гуруҳ-

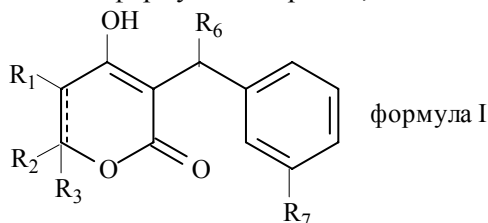
дан танлаб олинган асосий амин, бу ерда асосий амин бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 0,1% дан тахминан 10% гача миқдорда мавжуд бўлиб, бунда алкиламин (энг пасти) ни этаноламин, диэаноламин, триэаноламин, этилендиамин, диметиламиноэтанол ёки трис(гидроксиметил)аминометандан таркиб топган гуруҳдан танлаб оладилар.

11. 10-банд бўйича композиция суюқ шаклда мавжуд бўлиб, у билан юмшоқ эластик капсулаларни тўлдирса бўлади.

12. 10-банд бўйича композиция суюқ шаклда мавжуд бўлиб, у билан қаттиқ желатин ёки ножелатин капсулаларни тўлдирса бўлади.

13. 0,5% дан кам бўлган этанол ва пропиленгликольдан таркиб топган фармацевтик композиция, ўз ичига қуйидагиларни олади:

(а) фармацевтик фаолликка эга бўлган агент сифатидаги I формулани пиранон,



формула I

бу ерда R_1 билан H- белгиланган;

R_2 билан C_3 - C_5 алкил, фенил $(CH_2)_2$ -, het- SO_2NH -(CH_2) $_2$ -, циклопропил $(CH_2)_2$ -, F-фенил $(CH_2)_2$ -, het- SO_2NH -фенил-, ёки F_3C -(CH_2) $_2$ - белгиланган; ёки

R_1 ва R_2 биргаликда иккиланган алоқани билдиради;

R_3 билан R_4 -(CH_2) $_n$ -CH(R_5)-, H_3C -[O(CH_2) $_2$] $_2$ - CH_2 -, C_3 - C_5 алкил, фенил $(CH_2)_2$ -, het- SO_2NH -(CH_2) $_2$ -, ($HOCH_2$) $_3$ C-NH-C(O)-NH-(CH_2) $_3$ -, (HO_2C)(H_2N)CH-(CH_2) $_2$ -C(O)-NH-(CH_2) $_3$ -, пиперазин-1-ил-C(O)-NH-(CH_2) $_3$ -, HO_3S (CH_2) $_2$ -N(CH_3)-C(O)-(CH_2) $_6$ -C(O)-NH-(CH_2) $_3$ -, циклопропил $(CH_2)_2$ -, F-фенил-(CH_2) $_2$ -, het- SO_2NH -фенил или F_3C -(CH_2) $_2$ - белгиланган;

$n = 0, 1$ ёки 2 ; R_4 билан фенил, het, циклопропил, H_3C -[O(CH_2) $_2$] $_2$ -, het- SO_2NH -, Br-, N_3 - ёки HO_3S (CH_2) $_2$ -N(CH_3)-C(O)-(CH_2) $_6$ -C(O)-NH- белгиланган;

R_5 билан $-CH_2-CH_3$ или $-CH_2$ -циклопропил белгиланган;

R_6 билан циклопропил, CH_3-CH_2 - ёки трет-бутил белгиланган;

R_7 билан $-NR_8SO_2$ -het, $-NR_8SO_2$ -фенил, унинг R_9 билан алмаштирилган бўлиши ўшарт эмас, $-CH_2-SO_2$ -фенил, унинг R_9 ёки $-CH_2-SO_2$ -het билан алмаштирилган бўлиши шарт эмас, белгиланган;

R_8 билан H ёки $-CH_3$ белгиланган;

R_9 билан $-CN$, $-F$, $-OH$ ёки $-NO_2$ белгиланган;

het билан 5, 6 ёки 7 ҳадли тўйинтирилган ёки тўйинтирилмаган ҳалқа белгиланиб, унинг таркибига азот, кислород ва олтин гугуртдан иборат гуруҳдан танлаб олинган 1-3 та гетероатом кирди;

хамда ҳар қандай бициклик гуруҳни ўз ичига оладик, унда юқорида кўрсатиб ўтилган гетероциклик ҳалқаларнинг ҳар қайсиси бензол ҳалқаси ёки $-CH_3$, $-CN$, $-OH$, $-C(O)OC_2H_5$, $-CF_3$, $-NH_2$ ёки $-C(O)-NH_2$ билан ўрин алмашилиши шарт бўлмаган бошқа гетероцикл билан конденсацияланади; ёки ушбу бициклик гуруҳнинг фармацевтик мақбул тузини ўз ичига олади;

бу ерда I формула бирикмаси бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 1% дан тахминан 40% гача миқдорда мавжуд бўлади; (б) битта ёки бир нечта фармацевтик мақбул юзак-фаол моддалар;

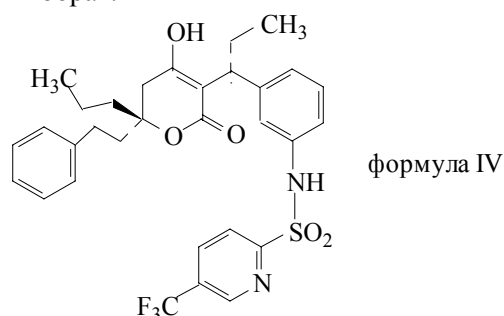
(в) ўртача молекуляр массаси 300 дан юқори, аммо 600 дан кам бўлган полиэтиленгликоль, бу ерда полиэтиленгликоль бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 1% дан тахминан 40% гача миқдорда мавжуд бўлади;

(г) бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 5% дан тахминан 35% гача миқдорда мавжуд бўлган диглицерид и моноглицеридлар аралашмаси, бу ерда диглицерид ва моноглицеридлар каприл ва каприн кислоталарининг моно ва диглицеридли аралашмаларини билдиради.

14. 8-банд бўйича фармацевтик композиция таркибида қўшимча равишда бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 0,1% дан тахминан 10% гача миқдорда асосий амин мавжуд.

15. 9-банд бўйича фармацевтик композиция, бунда асосий амин (энг пасти) алкиламин, асосий аминокислота ёки холин гидроксидидан иборат, бунда алкиламин (энг пасти) ни этаноламин, диэаноламин, триэаноламин, этилендиамин, диметиламиноэтанол ёки трис(гидроксиметил)аминометандан таркиб топган гуруҳдан танлаб оладилар.

16. 8-банд бўйича фармацевтик композиция, бу ерда I формулани пиранон IV формула бирикмасидан иборат.



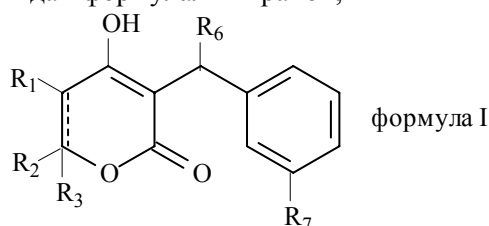
формула IV

17. 11-банд бўйича фармацевтик композиция, бу ерда полиэтиленгликоль тахминан 400 ўртача молекуляр массага эга.

18. 8-банд бўйича фармацевтик композиция, бу ерда юзаки-фаол модда бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 20% дан тахминан 60% гача миқдорда мавжуд.

19. Таркибида камида 0,5% этанол ва пропиленгликоль бўлган фармацевтик композиция ичига қуйидагилар киради:

(а) фармацевтик фаолликка эга бўлган агент сифатида I формулани пиранон,



бу ерда R_1 билан H- белгиланган;
 R_2 билан C_3 - C_5 алкил, фенил $(CH_2)_2$ -, het- SO_2NH - $(CH_2)_2$ -, циклопропил $(CH_2)_2$ -, F-фенил $(CH_2)_2$ -, het- SO_2NH -фенил-, ёки F_3C - $(CH_2)_2$ - белгиланган;
 ёки

R_1 ва R_2 биргаликда иккиланган алокани билдиради;

R_3 билан R_4 - $(CH_2)_n$ - $CH(R_5)$ -, H_3C - $[O(CH_2)_2]_2$ - CH_2 -, C_3 - C_5 алкил, фенил $(CH_2)_2$ -, het- SO_2NH - $(CH_2)_2$ -, $(HOCH_2)_3C$ - NH - $C(O)$ - NH - $(CH_2)_3$ -, $(HO_2C)(H_2N)CH$ - $(CH_2)_2$ - $C(O)$ - NH - $(CH_2)_3$ -, пиперазин-1-ил- $C(O)$ - NH - $(CH_2)_3$ -, $HO_3S(CH_2)_2$ - $N(CH_3)$ - $C(O)$ - $(CH_2)_6$ - $C(O)$ - NH - $(CH_2)_3$ -, циклопропил $(CH_2)_2$ -, F-фенил- $(CH_2)_2$ -, het- SO_2NH -фенил или F_3C - $(CH_2)_2$ - белгиланган;
 $n = 0, 1$ ёки 2 ;

R_4 билан фенил, het, циклопропил, H_3C - $[O(CH_2)_2]_2$ -, het- SO_2NH -, Br-, N_3 - ёки $HO_3S(CH_2)_2$ - $N(CH_3)$ - $C(O)$ - $(CH_2)_6$ - $C(O)$ - NH - белгиланган;

R_5 билан $-CH_2-CH_3$ или $-CH_2$ -циклопропил белгиланган;

R_6 билан циклопропил, CH_3-CH_2 - ёки трет-бутил белгиланган;

R_7 билан $-NR_8SO_2$ -het, $-NR_8SO_2$ -фенил, унинг R_9 билан алмаштирилган бўлиши ўшарт эмас, $-CH_2-SO_2$ -фенил, унинг R_9 ёки $-CH_2-SO_2$ -het билан алмаштирилган бўлиши шарт эмас, белгиланган;

R_8 билан H ёки $-CH_3$ белгиланган;

R_9 билан $-CN$, $-F$, $-OH$ ёки $-NO_2$ белгиланган;

het билан 5, 6 ёки 7 ҳадли тўйинтирилган ёки тўйинтирилмаган ҳалқа белгиланиб, унинг таркибига азот, кислород ва олтин гугуртдан иборат гуруҳдан танлаб олинган 1-3 та гетероатом киради;

хамда ҳар қандай бициклик гуруҳни ўз ичига оладики, унда юқорида кўрсатиб ўтилган гетеро-

циклик ҳалқаларнинг ҳар қайсиси бензол ҳалқаси ёки $-CH_3$, $-CN$, $-OH$, $-C(O)OC_2H_5$, $-CF_3$, $-NH_2$ ёки $-C(O)-NH_2$ билан ўрин алмашилиши шарт бўлмаган бошқа гетероцикл билан конденсацияланади;

ёки ушбу бициклик гуруҳнинг фармацевтик мақбул тузини ўз ичига олади;

бу ерда I формула бирикмаси бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 1% дан тахминан 40% гача миқдорда мавжуд бўлади;

(б) битта ёки бир нечта фармацевтик мақбул юзаки-фаол моддалар;

(в) ўртача молекуляр массаси 300 дан юқори, аммо 600 дан кам бўлган полиэтиленгликоль, бу ерда полиэтиленгликоль бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 1% дан тахминан 40% гача миқдорда мавжуд бўлади; ва

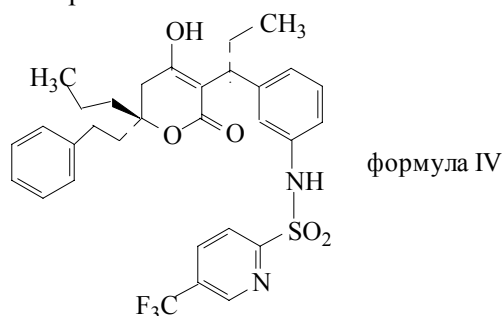
(г) бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 5% дан тахминан 35% гача миқдорда мавжуд бўлган диглицерид ва моноглицеридлар аралашмаси, бу ерда диглицерид ва моноглицеридлар 8 тадан 10 тагача углерод атомларидан таркиб топган занжирга эга бўлган моно

ёки икки марта тўйинтирилган ёғли кислоталар эфирлари ва глицериндан иборат.

20. 14-банд бўйича фармацевтик композиция таркибида қўшимча равишда бутун композиция массасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 0,1% дан тахминан 10% гача миқдорда асосий амин мавжуд.

21. 15-банд бўйича фармацевтик композиция, бунда асосий амин (энг пасти) алкиламин, асосий аминокислота ёки холин гидроксидидан иборат, бунда алкиламин (энг пасти) ни этаноламин, диэтианоламин, триэтианоламин, этилендиамин, диметиламиноэтанол ёки трис(гидроксиметил)аминометандан таркиб топган гуруҳдан танлаб оладилар.

22. 14-банд бўйича фармацевтик композиция, бу ерда I формулани пиранон IV формула бирикмасидан иборат.



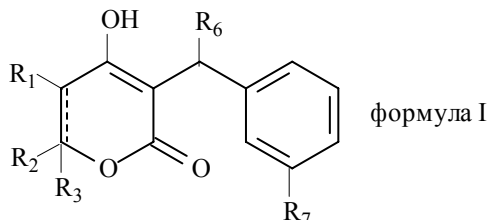
23. 14-банд бўйича фармацевтик композиция, бу ерда полиэтиленгликоль тахминан 400 ўртача молекуляр массага эга.

24. 14-банд бўйича фармацевтик композиция, бу ерда юзаки-фаол модда бутун композиция мас-

сасига нисбатан ҳисоблаганда тахминан 20% дан тахминан 60% гача микдорда мавжуд.

1. Фармацевтическая композиция, содержащая менее 0,5% этанола и пропиленгликоля, включающая:

(а) пиранон формулы I в качестве обладающего фармацевтической активностью агента



где R₁ обозначает H-;

R₂ обозначает C₃-C₅алкил, фенил(CH₂)₂-, het-SO₂NH-(CH₂)₂-, циклопропил(CH₂)₂-, F-фенил(CH₂)₂-, het-SO₂NH-фенил-, или F₃C-(CH₂)₂-; или

R₁ и R₂ вместе обозначают двойную связь;

R₃ обозначает R₄-(CH₂)_n-CH(R₅)-,

H₃C-[O(CH₂)₂]₂-CH₂-, C₃-C₅алкил, фенил(CH₂)₂-, het-SO₂NH-(CH₂)₂-,

(HOCH₂)₃C-NH-C(O)-NH-(CH₂)₃-,

(HO₂C)(H₂N)CH-(CH₂)₂-C(O)-NH-(CH₂)₃-,

пиперазин-1-ил-C(O)-NH-(CH₂)₃,

HO₃S(CH₂)₂-N(CH₃)-C(O)-(CH₂)₆-C(O)-NH-(CH₂)₃-,

циклопропил(CH₂)₂-, F-фенил-(CH₂)₂-,

het-SO₂NH-фенил или F₃C-(CH₂)₂-;

n равно 0, 1 или 2;

R₄ обозначает фенил, het, циклопропил,

H₃C-[O(CH₂)₂]₂-, het-SO₂NH-, Br-, N₃- или HO₃S(CH₂)₂-N(CH₃)-C(O)-(CH₂)₆-C(O)-NH-;

R₅ обозначает -CH₂-CH₃ или -CH₂-циклопропил;

R₆ обозначает циклопропил, CH₃-CH₂- или трет-бутил;

R₇ обозначает -NR₈SO₂-het, -NR₈SO₂-фенил, необязательно замещенный R₉, -CH₂-SO₂-фенил, необязательно замещенный R₉ или -CH₂-SO₂-het;

R₈ обозначает -H или -CH₃;

R₉ обозначает -CN, -F, -OH или -NO₂;

het обозначает 5-, 6- или 7-членное насыщенное или ненасыщенное кольцо, содержащее 1-3 гетероатома, выбранных из группы, состоящей из азота, кислорода и серы;

и включает любую бициклическую группу, в которой любое из указанных выше гетероциклических колец сконденсировано с бензольным кольцом или другим гетероциклом, необязательно замещенным -CH₃, -CN, -OH, -C(O)OC₂H₅, -CF₃, -NH₂ или -C(O)-NH₂;

или его фармацевтически приемлемую соль;

где соединение формулы I присутствует в коли-

честве от приблизительно 1% до приблизительно 40% в пересчете на массу всей композиции;

(б) одно или несколько фармацевтически приемлемых поверхностно-активных веществ;

(в) полиэтиленгликоль, имеющий среднюю молекулярную массу более 300, но менее 600, где полиэтиленгликоль присутствует в количестве от приблизительно 10% до приблизительно 40% в пересчете на массу всей композиции; и

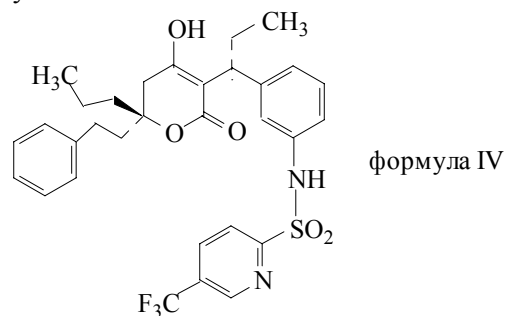
(г) основной амин в количестве от приблизительно 0,1% до приблизительно 10% в пересчете на массу всей композиции, где основной амин представляет собой (низш.)алкиламин, основную аминокислоту или гидроксид холина, где (низш.)-алкиламин выбирают из группы, включающей этаноламин, диэтанолламин, триэтанолламин, этилендиамин, диметиламиноэтанол или трис(гидроксиметил)аминометан.

2. Фармацевтическая композиция по п. 1, дополнительно содержащая смесь диглицерида и моноглицеридов в количестве от приблизительно 5% до приблизительно 35% в пересчете на массу всей композиции.

3. Фармацевтическая композиция по п. 2, где смесь диглицерида и моноглицеридов представляет собой моно и диглицеридную смесь каприловой и каприновой кислот.

4. Фармацевтическая композиция по п. 2, где диглицерид и моноглицериды представляют собой эфиры моно- или динасыщенных жирных кислот и глицерина, имеющие цепь, содержащую от 8 до 10 атомов углерода.

5. Фармацевтическая композиция по п. 1, где пиранон формулы I представляет собой соединение формулы IV

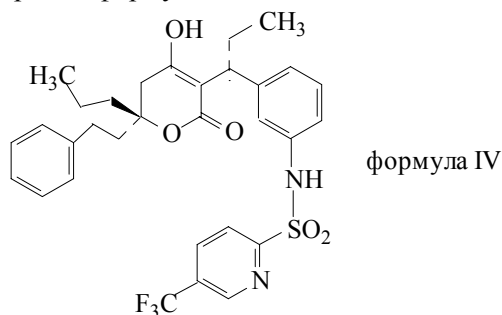


6. Фармацевтическая композиция по п. 1, где полиэтиленгликоль имеет среднюю молекулярную массу приблизительно 400.

7. Фармацевтическая композиция по п. 1, где поверхностно-активное вещество присутствует в количестве от приблизительно 20% до приблизительно 60% в пересчете на массу всей композиции.

8. Фармацевтическая композиция по п. 1, включающая:

(а) пиранон формулы IV



в количестве от приблизительно 1% до приблизительно 40% в пересчете на массу всей композиции;

(б) липофильную фазу, составляющую от приблизительно 5% до приблизительно 35% в пересчете на массу всей композиции;

(в) полиэтиленгликоль со средней молекулярной массой более приблизительно 300, но менее приблизительно 600, в количестве от приблизительно 10% до приблизительно 40% в пересчете на массу всей композиции;

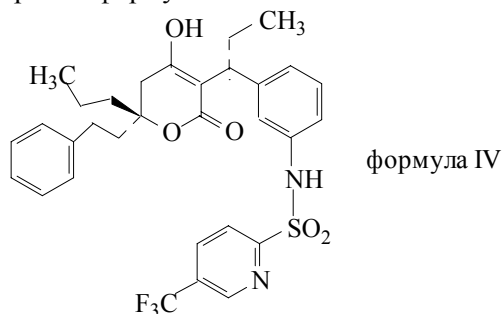
(г) поверхностно-активное вещество, выбранное из группы, включающей полиоксилированное касторовое масло, полиоксиэтиленглицеринтририциноолеат и насыщенный полиглицеролизированный каприловый-каприновый глицерид, в количестве от приблизительно 20% до приблизительно 60% в пересчете на массу всей композиции; и

(д) основной амин, выбранный из группы, включающей (низш.)алкиламин, основную аминокислоту или гидроксид холина, где указанный основной амин присутствует в количестве от приблизительно 0,1% до приблизительно 10% в пересчете на массу всей композиции, где (низш.)-алкиламин выбирают из группы, состоящей из этаноламина, диэтанолamina, триэтанолamina, этилендиамина, диметиламиноэтанола или трис(гидроксиетил)аминометана.

9. Фармацевтическая композиция по п. 8, где липофильная фаза представляет собой смесь диглицеридов и моноглицеридов.

10. Фармацевтическая композиция по п. 1, включающая:

(а) пиранон формулы IV



в количестве от приблизительно 1% до приблизительно 40% в пересчете на массу всей композиции;

(б) липофильную фазу, выбранную из группы, включающей моно- и диглицеридовую смесь каприловой и каприновой кислот, смесь моно-, ди- и триглицеридовых и моно- и ди-сложных эфиров жирного ряда полиэтиленгликоля, где доминирует жирная кислота, являющаяся олеиновой кислотой, и смесь триглицеридов каприловой и каприновой кислот, и комбинацией из вышеуказанного,

где липофильная фаза присутствует в количестве от приблизительно 5% до приблизительно 35% в пересчете на массу всей композиции;

(в) полиэтиленгликоль со средней молекулярной массой более приблизительно 300, но менее приблизительно 600, в количестве от приблизительно 10% до приблизительно 40% в пересчете на массу всей композиции;

(г) поверхностно-активное вещество, выбранное из группы, включающей полиоксилированное касторовое масло, полиоксиэтиленглицеринтририциноолеат и насыщенный полиглицеролизированный каприловый-каприновый глицерид, в количестве от приблизительно 20% до приблизительно 60% в пересчете на массу всей композиции, и

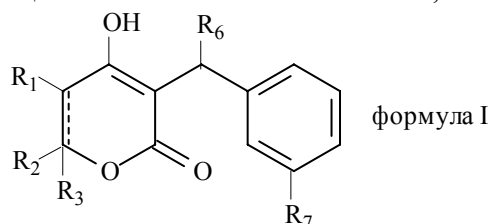
(д) основной амин, выбранный из группы, включающей (низш.)алкиламин, основную аминокислоту или гидроксид холина, где (низш.)алкиламин выбирают из группы, состоящей из этаноламина, диэтанолamina, триэтанолamina, этилендиамина, диметиламиноэтанола или трис(гидроксиетил)аминометана, где указанный основной амин присутствует в количестве от приблизительно 0,1% до приблизительно 10% в пересчете на массу всей композиции.

11. Композиция по п. 10, находящаяся в жидкой форме, которой можно заполнять мягкие эластичные капсулы.

12. Композиция по п. 10, находящаяся в жидкой форме, которой можно заполнять твердые желатиновые или нежелатиновые капсулы.

13. Фармацевтическая композиция, содержащая менее 0,5% этанола и пропиленгликоля, включающая:

(а) пиранон формулы I в качестве обладающего фармацевтической активностью агента,



где R_1 обозначает H-;

R_2 обозначает C_3 - C_5 алкил, фенил $(CH_2)_2$ -,

het- $SO_2NH-(CH_2)_2$ -, циклопропил $(CH_2)_2$ -,

F-фенил $(CH_2)_2$ -, het- SO_2NH -фенил-, или

$F_3C-(CH_2)_2$ -; или

R_1 и R_2 вместе обозначают двойную связь;

R_3 обозначает $R_4-(CH_2)_n-CH(R_5)$ -,

$H_3C-[O(CH_2)_2]_2-CH_2$ -, C_3 - C_5 алкил, фенил $(CH_2)_2$ -,

het- $SO_2NH-(CH_2)_2$ -,

$(HOCH_2)_3C-NH-C(O)-NH-(CH_2)_3$ -,

$(HO_2C)(H_2N)CH-(CH_2)_2-C(O)-NH-(CH_2)_3$ -,

пиперазин-1-ил- $C(O)-NH-(CH_2)_3$,

$HO_3S(CH_2)_2-N(CH_3)-C(O)-(CH_2)_6-C(O)-NH-$

$(CH_2)_3$ -, циклопропил $(CH_2)_2$ -,

F-фенил $(CH_2)_2$ -, het- SO_2NH -фенил или

$F_3C-(CH_2)_2$ -;

n равно 0, 1 или 2;

R_4 обозначает фенил, het, циклопропил, H_3C-

$[O(CH_2)_2]_2$ -, het- SO_2NH -, Br-, N_3 - или

$HO_3S(CH_2)_2-N(CH_3)-C(O)-(CH_2)_6-C(O)-NH$;

R_5 обозначает $-CH_2-CH_3$ или $-CH_2$ -циклопропил;

R_6 обозначает циклопропил, CH_3-CH_2 - или трет-

бутил;

R_7 обозначает $-NR_8SO_2$ -het, $-NR_8SO_2$ -фенил, не-

обязательно замещенный R_9 , $-CH_2-SO_2$ -фенил,

необязательно замещенный R_9 или $-CH_2-SO_2$ -het;

R_8 обозначает H или $-CH_3$;

R_9 обозначает $-CN$, $-F$, $-OH$ или $-NO_2$;

het обозначает 5-, 6- или 7-членное насыщенное

или ненасыщенное кольцо, содержащее 1-3 гете-

роатома, выбранных из группы, состоящей из

азота, кислорода и серы;

и включает любую бициклическую группу, в ко-

торой любое из указанных выше гетероцикли-

ческих колец сконденсировано с бензольным

кольцом или другим гетероциклом, необязатель-

но замещенным $-CH_3$, $-CN$, $-OH$, $-C(O)OC_2H_5$,

$-CF_3$, $-NH_2$ или $-C(O)-NH_2$;

или его фармацевтически приемлемую соль;

где соединение формулы I присутствует в коли-

честве от приблизительно 1% до приблизительно

40% в пересчете на массу всей композиции;

(б) одно или несколько фармацевтически прием-

лемых поверхностно-активных веществ;

(в) полиэтиленгликоль, имеющий среднюю моле-

кулярную массу более 300, но менее 600, где

полиэтиленгликоль присутствует в количестве

от приблизительно 10% до приблизительно 40%

в пересчете на массу всей композиции;

(г) смесь диглицерида и моноглицеридов в коли-

честве от приблизительно 5% до приблизительно

35% в пересчете на массу всей композиции, где

диглицерид и моноглицериды представляют со-

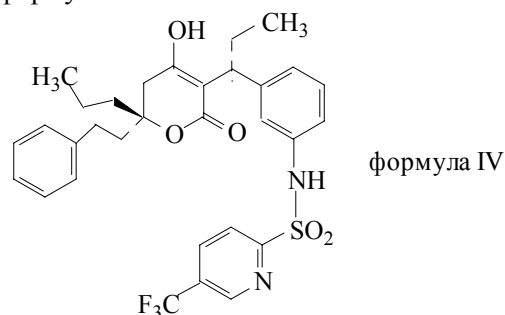
бой моно- и диглицеридовую смесь каприловой

и каприновой кислот.

14. Фармацевтическая композиция по п. 13, до-
полнительно содержащая основной амин в коли-
честве от приблизительно 0,1% до приблизи-
тельно 10% в пересчете на массу всей компо-
зиции.

15. Фармацевтическая композиция по п. 14, где
основной амин представляет собой (низш.)ал-
киламин, основную аминокислоту или гидрок-
сид холина, где (низш.)алкиламин выбирают из
группы, включающей этаноламин, диэтаноламин,
триэтаноламин, этилендиамин, диметиламино-
этанол или трис(гидроксиметил)аминометан.

16. Фармацевтическая композиция по п. 13, где
пиранон формулы I представляет собой соедине-
ние формулы IV



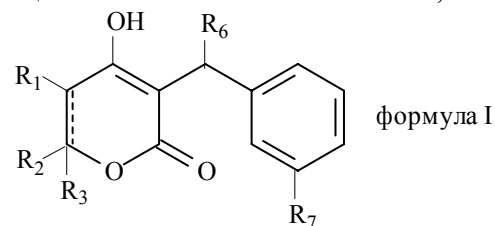
формула IV

17. Фармацевтическая композиция по п. 16, где
полиэтиленгликоль имеет среднюю молекуляр-
ную массу приблизительно 400.

18. Фармацевтическая композиция по п. 13, где
поверхностно-активное вещество присутствует в
количестве от приблизительно 20% до приблизи-
тельно 60% в пересчете на массу всей компо-
зиции.

19. Фармацевтическая композиция, содержащая
менее 0,5% этанола и пропиленгликоля, вклю-
чающая:

(а) пиранон формулы I в качестве обладающего
фармацевтической активностью агента,



формула I

где R_1 обозначает H-;

R_2 обозначает C_3 - C_5 алкил, фенил $(CH_2)_2$ -,

het- $SO_2NH-(CH_2)_2$ -, циклопропил $(CH_2)_2$ -,

F-фенил $(CH_2)_2$ -, het- SO_2NH -фенил-, или

$F_3C-(CH_2)_2$ -; или

R_1 и R_2 вместе обозначают двойную связь;

R_3 обозначает $R_4-(CH_2)_n-CH(R_5)$ -,

$H_3C-[O(CH_2)_2]_2-CH_2$ -, C_3 - C_5 алкил, фенил $(CH_2)_2$ -,

het- $SO_2NH-(CH_2)_2$ -,

$(HOCH_2)_3C-NH-C(O)-NH-(CH_2)_3$ -,

$(HO_2C)(H_2N)CH-(CH_2)_2-C(O)-NH-(CH_2)_3$ -,

пиперазин-1-ил-С(О)-NH-(CH₂)₃,
HO₃S(CH₂)₂-N(CH₃)-C(О)-(CH₂)₆-C(О)-NH-(CH₂)₃-,
циклопропил(CH₂)₂-, F-фенил-(CH₂)₂-,
het-SO₂NH-фенил или F₃C-(CH₂)₂-;
n равно 0, 1 или 2;

R₄ обозначает фенил, het, циклопропил,
H₃C-[O(CH₂)₂]₂-, het-SO₂NH-, Br-, N₃- или
HO₃S(CH₂)₂-N(CH₃)-C(О)-(CH₂)₆-C(О)-NH-;
R₅ обозначает -CH₂-CH₃ или -CH₂-циклопропил;
R₆ обозначает циклопропил, CH₃-CH₂- или трет-
бутил;

R₇ обозначает -NR₈SO₂-het, -NR₈SO₂-фенил,
необязательно замещенный R₉, -CH₂-SO₂-фенил,
необязательно замещенный R₉ или -CH₂-SO₂-het;
R₈ обозначает -H или -CH₃ ;

R₉ обозначает -CN, -F, -OH или -NO₂;
het обозначает 5-, 6- или 7-членное насыщенное
или ненасыщенное кольцо, содержащее 1-3 гете-
роатома, выбранных из группы, состоящей из
азота, кислорода и серы;

и включает любую бициклическую группу, в ко-
торой любое из указанных выше гетероцикли-
ческих колец сконденсировано с бензольным
кольцом или другим гетероциклом, необяза-
тельно замещенным -CH₃, -CN, -OH,
-C(О)OC₂H₅, -CF₃, -NH₂ или -C(О)-NH₂;

или его фармацевтически приемлемую соль;
где соединение формулы I присутствует в коли-
честве от приблизительно 1% до приблизительно
40% в пересчете на массу всей композиции;

(б) одно или несколько фармацевтически прием-
лемых поверхностно-активных веществ;

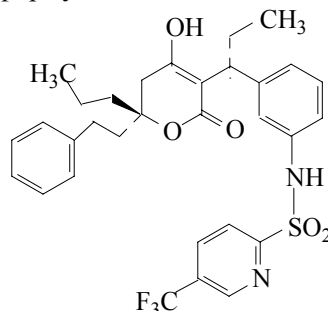
(в) полиэтиленгликоль, имеющий среднюю моле-
кулярную массу более 300, но менее 600, где по-
лиэтиленгликоль присутствует в количестве от
приблизительно 10% до приблизительно 40% в
пересчете на массу всей композиции;

(г) смесь диглицерида и моноглицеридов в коли-
честве от приблизительно 5% до приблизительно
35% в пересчете на массу всей композиции, где
диглицерид и моноглицериды представляют со-
бой эфиры моно- или динасыщенных жирных
кислот и глицерина, имеющие цепь, содержа-
щую от 8 до 10 атомов углерода.

20. Фармацевтическая композиция по п. 19, до-
полнительно содержащая основной амин в коли-
честве от приблизительно 0,1% до приблизительно
10% в пересчете на массу всей композиции.

21. Фармацевтическая композиция по п. 20, где
основной амин представляет собой (низш.)ал-
киламин, основную аминокислоту или гидрок-
сид холина, где (низш.)алкиламин выбирают из
группы, включающей этаноламин, диэтанол-
амин, триэтаноламин, этилендиамин, диметил-
аминоэтанол или трис(гидроксиэтил)амино-
метан.

22. Фармацевтическая композиция по п. 19, где
пиранон формулы I представляет собой соедине-
ние формулы IV



формула IV

23. Фармацевтическая композиция по п. 19, где
полиэтиленгликоль имеет среднюю молекуляр-
ную массу приблизительно 400.

24. Фармацевтическая композиция по п. 19, где
поверхностно-активное вещество присутствует в
количестве от приблизительно 20% до приблизи-
тельно 60% в пересчете на массу всей компози-
ции.

(11) IAP 03620

(13) C

(51) 8 A 61 K 9/127, A 61 K 9/133

(21) IAP 2004 0415

(22) 04.04.2003

(31)(32)(33) 60/370.409, 05.04.2002, US

(71)(73) ЭСПЕРИОН ЛУВ ДИВЕЛОПМЕНТ,
ИНК., US

(72) РОДРИГЕЗА, Венди, В.; БИСГАЙЕР,
Чарльз, Л., US

(85) 04.11.2004

(86) PCT/US 03/10339, 04.04.2003

(87) WO 03/086351, 23.10.2003

**(54) Касалликларни даволаш ва олдини олиш
учун маълум ўлчамдаги липосомларни миқ-
дорлаш учун композициялар ва усуллар
Композиции и способы дозирования липосом
определенных размеров для лечения или пре-
дотвращения заболевания**

(57) 1. Шунга мухтож бўлган шахсга тахминан
50 дан 250 нмгача ўртача диаметрга эга, тарки-
бига фосфолипидлар ва сув қатлами кирган липо-
сомларни бир марталик ёки бўлинган 50 дан
300 мг/кггача дозаларда миқдорлашнинг узлук-
сиз схемаси асосида 4дан 10 кунгача интервалда
киритишни ўз ичига олган, дислипидемик бузи-
лиш билан боғлиқ касаллик ёки организм ҳола-
тини олдини олиш ёки даволаш усули.

2. 1-банд бўйича усулда липосомлар тахминан
50 нм дан 150 нмгача, ёки тахминан 50 нм дан
200 нмгача, ёки тахминан 100 нм дан 200 нмгача,
ёки тахминан 100 нм дан 250 нмгача, ёки тах-
минан 150 нм дан 200 нмгача, ёки тахминан 150
нм дан 250 нмгача ўртача диаметрга эга.

3. 1- ёки 2-банд бўйича усулда липосомлар кўп қатламли везикуллар, катта бир қатламли везикуллар, кичик бир қатламли везикуллардан тузилган гуруҳдан танланган бошқа фосфолипид везикуллар билан комбинацияда киритилади.

4. 1-3-бандларнинг ҳар бири бўйича усул шахсда LDL даражаларининг кўп миқдорда кўтарилиши ёки пасайишига олиб келмайди.

5. 1-3-бандларнинг ҳар бири бўйича усул шахсда LDL даражаларининг кўп миқдорда кўтарилиши ёки пасайишига олиб келади.

6. 1-банд бўйича усулда фосфолипид тухум фосфатидилхолини, тухум фосфатидилглицерини, дистеароилфосфатидилхолин ёки дистеароилфосфатидилглицерин, фосфатидилхолин, фосфатидилглицерин, лецитин, β, γ -дипальмитоил-альфа-лецитин, сфингомиелин, фосфатидилсерин, диацилфосфатид кислотаси, гликолипид боғланган фосфолипид, хлорид N-(2,3-ди(9-(Z)-октадеценилкси))-проп-1-ил-N,N,N-триметиламмоний, фосфатидилэтанолламин, лизолецитин, лизофосфатидилэтанолламин, фосфатидилинозит, цефалин, кардиолипин, цереброзид, дицетилфосфатидолеилфосфатидилхолин, дипальмитоилфосфатидилхолин, дипаль-митоилфосфатидилглицерин, диолеилфосфатидилглицерин, пальмитоилолеилфосфатидилхолин, дистеароилфосфатидилхолин, стеароилпальмитоилфосфатидилхолин, дипальмитоилфосфатидилэтанолламин, дистеароилфосфатидилэтанолламин, димиристоилфосфатидилсерин, диолеилфосфатидилхолин, олеилпальмитоилфосфатидилхолин, ва уларнинг аралашмасидан ташкил топган гуруҳдан танланади.

7. 1-6-бандларнинг ҳар бири бўйича усулда фосфолипид пальмитоилолеилфосфатидилхолин-дир.

8. 1-7-бандларнинг ҳар бири бўйича усулда касаллик ёки ҳолат, атеросклероз, флебосклероз ёки интим ҳолатда ёки веналарнинг ички қобиғида холестерин ёки бошқа материални ўз ичига олган тошмалар ҳосил бўладиган бошқа ҳар қандай қон томир касалликлари, ўткир коронар синдромлар, стенокардия, хусусан, барқарор стенокардия, нобарқарор стенокардия, яллиғланишлар, томирларнинг яллиғланиши, тери яллиғланишлари, турғун юрак хасталиги, юракнинг хафакон хасталиги (ИБС), юрак қоринчаси аритмияси, периферик томирлар хасталиги, миокард инфаркти, ўта хавфли миокард инфарктининг бошланиши, ўлим хавфи бўлмаган миокард инфаркти, ишемия, юрак-томир ишемияси, ўткинчи бош мияси қон айланишининг бузилишлари, юрак-томир хасталиги билан боғлиқ бўлмаган ишемия, ишемик-реперфузион бузилишлар, реваску-

ляризацияга талабнинг пасайиши, қон қуюлишининг бузилишлари, тромбоцитопении, чуқур веналар тромбози, панкреатит, ноалкогол стеатогепатит, диабетик нейропатия, ретинопатия, оғриқли диабетик нейропатия, чўлоклик, псориаз, қўл-оёқларнинг критик ишемияси, импотенция, гиперлипидемия, гиперлипопротеинемия, гипоальбалипопротеинемия, гипертриглицеридемия, ишемик патологияга олиб келувчи ҳар қандай стеностик ҳолат, диабет, хусусан I тип ва II типдаги диабет, ихтиоз, мияга қон қуйилиши, сезгир тромбоцитлар, Альцгеймер хасталиги, оёқ-қўллар яралари, оғир коронар ишемияси, лимфомлар, катаракталар, эндотелиал дисфункциялар, ксантомлар, охириги орган дисфункциялари, қон-томир касалликлари, чекиш ва диабет оқибатидаги қон-томир касалликлари, уйқу ва коронар артериялар хасталиги, мавжуд тошмалар регресси ва, нобарқарор тошмалар, қон-томирларнинг кучсиз интимлари, қон-томирларнинг нобарқарор интимлари, эндотелиининг бузилишлари, хирургик муолижалар натижасидаги эндотелиал бузилишлар, қон-томир хасталиклари билан боғлиқ касалликлар, артериялар оралиғидаги яллиғланишлар, баллонли ангиопластика натижасидаги рестеноз ва юқорида санаб ўтилган ҳолатларнинг олдиндан симптомлардан ташкил топган гуруҳдан танланган.

9. 1-8-бандларнинг ҳар бири бўйича усулда даволаш қон томирлан интимини мустаҳкамлайди, жигарга ўтказиш учун ҳужайрадан ташқаридаги холестериннинг оқишини тезлаштиради, иммунли жавобларни модуляциялайди, атеросклеротик тошмалардан холестеринни мобилизациялайди, яранинг битишига ёрдам беради, ҳар қандай мембрана, ҳужайра, тўқима, орган, организмнинг ҳужайрадан ташқари ҳудуди ёки таркибини модификациялайди.

10. 1-9-бандларнинг ҳар бири бўйича усулда липосомлар пептид, параоксоназа, липопротеинлипаза, Аро А-I ва Аро-I миметиклар, А-I вариантлар ва улар комбинациясидан ташкил топган гуруҳдан танланган бирикмалар билан қўшимча равишда боғланган ёки улар билан комбинацияда киритилади.

11. 1-9-бандларнинг ҳар бири бўйича усулда липосомлар кичик молекулалар ёки холестерин даражасига таъсир кўрсатувчи дори воситалари билан комбинацияда киритилади.

12. 11-банд бўйича усулда кичик молекула статин, тикланган HDL, кичик HDL ёки HDLнинг синтетик миметик липопротеинли заррасидан иборат.

13. 1-9-бандларнинг ҳар бири бўйича усулда липосомлар битта ёки ундан кўп юрак-томир агент-

лари, диабетга қарши агентлар ёки бошқа терапевтик моддалар билан комбинацияда киритилади.

14. 13-банд бўйича усулда юрак-томир агенти аспирин, бета-блокаторлар, кальцийли каналлар блокаторлари, гепарин, хусусан, пастмолекулярли гепарин, қонда глюкоза даражасини пасайтирувчи агентлар, нитратлар, Пб/Ша ингибиторлари, АПФ ингибиторлари, фибратлар ва сафро кислоталари секвестрантларидан ташкил топган гуруҳдан танланган.

15. 1-14-бандларнинг ҳар бири бўйича усулда липосомлар ҳафтада бир марта тахминан 50 мг/кг дозада, ёки тахминан 100 мг/кг дозада, ёки тахминан 150 мг/кг дозада, ёки тахминан 200 мг/кг дозада, ёки тахминан 250 мг/кг дозада ёки тахминан 300 мг/кг дозада киритилади.

16. 1-15-бандларнинг ҳар бири бўйича усулда липосомлар бир марта киритилади.

17. 1-15-бандларнинг ҳар бири бўйича усулда липосомлар дозалашнинг бир ҳафталик интервалига эга киритишнинг узлуксиз схемаси асосида 2 дан 14 мартагача киритилади.

18. 1-16-бандларнинг ҳар бири бўйича усулда киритишнинг ушбу схемаси 2 ҳафталик дозалаш интервалига, ёки 1 ойлик дозалаш интервалига, ёки 2 ойлик дозалаш интервалига, 3 ойлик дозалаш интервалига, 4 ойлик дозалаш интервалига, 5 ойлик дозалаш интервалига, 6 ойлик дозалаш интервалига, 7 ойлик дозалаш интервалига, 8 ойлик дозалаш интервалига, 9 ойлик дозалаш интервалига, 10 ойлик дозалаш интервалига, 11 ойлик дозалаш интервалига, 3 йиллик дозалаш интервалига, ёки 4 йиллик дозалаш интервалига эга.

19. Бир вақтнинг ўзида липосомлар терапияси билан боғлиқ ноқулай таъсирларни пасайтириш ёки йўқотиш билан бирга периферик тўқимада холестерин даражасини пасайтириш усули ўз ичига шунга муҳтож бўлган беморга тахминан 50 дан 250 нмгача ўртача диаметрга эга, липосомларни бир марталик ёки бўлинган 50 дан 300 мг/кггача дозаларда микдорлашнинг узлуксиз схемаси асосида 4 дан ёки ундан кўп кунгача интервалда киритишни олади.

20. 19-банд бўйича усулда киритиш 1 марта амалга оширилади.

21. 19-банд бўйича усулда киритиш 6 дан 14 мартагача амалга оширилади.

22. 19-банд бўйича усул кўшимча равишда битта ёки ундан кўп юрак томир агентлар, диабетга қарши агентлар ва/ёки қонда шакар даражасини назорат қилувчи агентлар, ва/ёки бошқа терапевтик агентлар билан комбинацияда ушбу липосомларни киритишни ўз ичига олади.

1. Способ предотвращения или лечения заболевания или состояния организма, связанного с дислипидемическим расстройством, включающий введение нуждающемуся в этом субъекту липосом, имеющих средний диаметр приблизительно от 50 нм до 250 нм, включающих фосфолипиды и водный слой, однократной или разделенными дозами от 50 мг/кг до 300 мг/кг согласно непрерывной схеме дозирования с интервалом от 4 до 10 дней.

2. Способ по п. 1, в котором липосомы имеют средний диаметр приблизительно от 50 нм до 150 нм, или приблизительно от 50 нм до 200 нм, или приблизительно от 100 нм до 200 нм, или приблизительно от 100 нм до 250 нм, или приблизительно от 150 нм до 200 нм, или приблизительно от 150 нм до 250 нм.

3. Способ по п. 1 или п. 2, в котором липосомы вводят в комбинации с другими фосфолипидными везикулами, выбранными из группы, состоящей из многослойных везикул, больших однослойных везикул, маленьких однослойных везикул и их смесей.

4. Способ по любому из пп. 1-3, который не вызывает значительного повышения или понижения уровней LDL у субъекта.

5. Способ по любому из пп. 1-3, который вызывает значительное повышение или понижение уровней LDL у субъекта.

6. Способ по п. 1, в котором фосфолипид выбирают из группы, состоящей из яичного фосфатидилхолина, яичного фосфатидилглицерина, дистеароилфосфатидилхолина или дистеароилфосфатидилглицерина, фосфатидилхолина, фосфатидилглицерина, лецитина, β , γ -дипальмитоилальфа-лецитина, сфингомиелина, фосфатидилсерина, диацилфосфатидной кислоты, гликолипид-связанного фосфолипида, хлорида N-(2,3-ди(9-(Z)-октадеценилокси))-проп-1-ил-N,N,N-триметиламмония, фосфатидилэтанолamina, лизолецитина, лизофосфатидилэтанолamina, фосфатидилинозита, цефалина, кардиолипина, цереброзида, дицетилфосфат-диолеилфосфатидилхолина, дипальмитоилфосфатидилхолина, дипальмитоилфосфатидилглицерина, диолеилфосфатидилглицерина, пальмитоилолеилфосфатидилхолина, дистеароилфосфатидилхолина, стеароилпальмитоилфосфатидилхолина, дипальмитоилфосфатидилэтанолamina, дистеароилфосфатидилэтанолamina, димиристоилфосфатидилсерина, диолеилфосфатидилхолина, олеилпальмитоилфосфатидилхолина, и их смесей.

7. Способ по любому из пп. 1-6, в котором фосфолипидом является пальмитоилолеилфосфатидилхолин.

8. Способ по любому из пп. 1-7, в котором заболевание или состояние организма выбрано из группы, состоящей из атеросклероза, флебосклероза или любого венозного состояния, при котором в интима или внутренней оболочке вен образуются бляшки, содержащие холестерин или другой материал, острых коронарных синдромов, стенокардии, включая стабильную стенокардию, нестабильную стенокардию, воспаления, воспаления сосудов, воспаления кожи, застойной сердечной недостаточности, ишемической болезни сердца (ИБС), желудочковых аритмий, заболевания периферических сосудов, инфаркта миокарда, начала смертельного инфаркта миокарда, несмертельного инфаркта миокарда, ишемии, сердечно-сосудистой ишемии, преходящих нарушений мозгового кровообращения, ишемии, не связанной с сердечно-сосудистым заболеванием, ишемически-реперфузионного повреждения, пониженной потребности в реваскуляризации, нарушений свертываемости крови, тромбоцитопении, тромбоза глубоких вен, панкреатита, неалкогольного стеатогепатита, диабетической нейропатии, ретинопатии, болезненной диабетической нейропатии, хромоты, псориаза, критической ишемии конечностей, импотенции, гиперлипидемии, гиперлипопротеинемии, гипоальфалиппротеинемии, гипертриглицеридемии, любого стенотического состояния, ведущего к ишемической патологии, диабета, включая диабет типа I и типа II, ихтиоза, удара, чувствительных тромбоцитов, болезни Альцгеймера, язв нижних конечностей, тяжелой коронарной ишемии, лимфом, катаракт, эндотелиальной дисфункции, ксантом, дисфункции концевых органа, сосудистого заболевания, сосудистого заболевания, являющегося результатом курения и диабета, заболевания сонных и коронарных артерий, регресса и сморщивания уже существующих бляшек, нестабильных бляшек, слабой интимы сосудов, нестабильной интимы сосудов, повреждения эндотелия, эндотелиального повреждения в результате хирургических процедур, заболеваемости, связанной с сосудистым заболеванием, изъязвления в просвете артерий, рестеноза в результате баллонной ангиопластики и симптомов-предвестников вышеперечисленных состояний.

9. Способ по любому из пп. 1-8, в котором лечение укрепляет интиму сосудов, стимулирует отток внеклеточного холестерина для транспорта в печень, модулирует иммунные ответы, мобилизует холестерин из атеросклеротических бляшек, способствует заживлению ран, модифицирует любую мембрану, клетку, ткань, орган, внеклеточную область или структуру организма.

10. Способ по любому из пп. 1-9, в котором липосомы вводят в комбинации или дополнительно связанными с соединениями, выбранными из группы, состоящей из пептида, параоксоназы, липопротеин-липазы, Аро А-I и Аро-I миметиков, вариантов А-I и их комбинаций.

11. Способ по любому из пп. 1-9, в котором липосомы вводят в комбинации с малыми молекулами или лекарственными средствами, которые влияют на уровни холестерина.

12. Способ по п. 11, в котором малая молекула представляет собой статин, воссозданный HDL, малый HDL или синтетическую миметическую липопротеиновую частицу HDL.

13. Способ по любому из пп. 1-9, в котором липосомы вводят в комбинации с одним или более сердечно-сосудистых агентов, противодиабетических агентов или других терапевтических веществ.

14. Способ по п. 13, в котором сердечно-сосудистый агент выбран из группы, состоящей из аспирина, бета-блокаторов, блокаторов кальциевых каналов, гепарина, включая низкомолекулярный гепарин, агентов, понижающих уровень глюкозы в крови, нитратов, ингибиторов Пб/Ша, ингибиторов АПФ, фибратов и секвестрантов желчных кислот.

15. Способ по любому из пп. 1-14, в котором липосомы вводят один раз в неделю в дозе приблизительно 50 мг/кг, или в дозе приблизительно 100 мг/кг, или в дозе приблизительно 150 мг/кг, или в дозе приблизительно 200 мг/кг, или в дозе приблизительно 250 мг/кг, или в дозе приблизительно 300 мг/кг.

16. Способ по любому из пп. 1-15, в котором липосомы вводят однократно.

17. Способ по любому из пп. 1-15, в котором липосомы вводят от 2 до 14 раз в соответствии с непрерывной схемой введения, имеющей недельный интервал дозирования.

18. Способ по любому из пп. 1-16, в котором указанная схема введения имеет интервалы дозирования 2 недели, или интервалы дозирования 1 месяц, или интервалы дозирования 1 месяц, или интервалы дозирования 2 месяца, или интервалы дозирования 3 месяца, или интервалы дозирования 4 месяца, или интервалы дозирования 5 месяцев, или интервалы дозирования 6 месяцев, или интервалы дозирования 7 месяцев, или интервалы дозирования 8 месяцев, или интервалы дозирования 9 месяцев, или интервалы дозирования 10 месяцев, или интервалы дозирования 11 месяцев, или интервалы дозирования 3 года, или интервалы дозирования 4 года.

19. Способ снижения содержания холестерина в периферической ткани с одновременным сни-

жением или исключением неблагоприятных эффектов, связанных с терапией липосомами, который включает введение пациенту, который в этом нуждается, липосом, имеющих средний диаметр от 50 нм до 250 нм, однократной или разделенной дозой от 50 мг/кг до 300 мг/кг согласно непрерывной схеме введения, имеющей интервал дозирования 4 или более дней.

20. Способ по п. 19, в котором введение осуществляют 1 раз.

21. Способ по п. 19, в котором введение осуществляют от 6 до 14 раз.

22. Способ по п. 19, дополнительно включающий введение указанных липосом в комбинации с одним или более сердечно-сосудистых агентов, противодиабетических агентов и/или агентов, контролирующих уровень сахара в крови, и/или других терапевтических агентов.

(11) IAP 03621

(13) C

(51) 8 A 61 K 31/12, A 61 K 31/121, A 61 K 36/00, C 07 C 49/00

(21) IAP 2004 0275

(22) 14.12.2002

(31)(32)(33) 60/340,165, 14.12.2001, US

(71)(73) Каунсил оф Сайентифик энд Индустриал Рисерч, IN

(72) РЕЙ, Мадхур; ПАЛ, Рагхвендра; СИНГХ, Сатиаван; КХАННА, Нанду, Мал, IN

(85) 14.07.2004

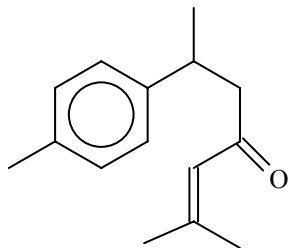
(86) PCT/IB 02/05366, 14.12.2002

(87) WO 03/051380, 26.06.2003

(54) **Нейроцереброваскуляр хасталикларни даволаш учун композиция**

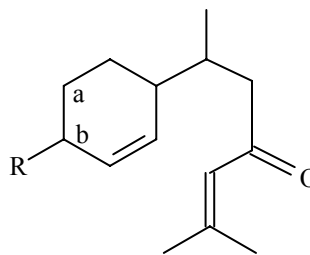
Композиция для лечения нейроцереброваскулярных нарушений

(57) 1. Нейроцереброваскуляр хасталикларни даволаш учун, куркумен ва зингибериндан тузилган В фракцияси, ва гермакрон, куркумерон, зедоарон, зедоарондиол, изозедоаронидиол, куркуменон ва курлондан ташкил топган С фракция билан бирга бўлиши шарт бўлмаган, таркибига 1 формуланинг α -d-турмеронидан тузилган А фракция



1

ва α -турмеронда $R=CH_3$, β -турмеронда эса, $R=CH_2$ бўлган 2 формуланинг α - ва β -турмерони



2

кирган композиция ва/ёки фармацевтик мувофик кўшимчалар.

2. 1-банд бўйича композицияда *Curcuma* тури *Curcuma domestica* Valetonдир.

3. 1-банд бўйича композицияда А фракция В, фракция ва С фракциянинг нисбати 1-3:1 дан 3:1-3гача.

4. 1-банд бўйича композицияда кўшимчалар мелатонин, антиоксидантлар, кальцийли каналлар антагонистлари, плазминоген (t-PA) тўқима активатори ва хужайра мембраналарни стабилизацияловчи агентлардан ташкил топган гуруҳдан танланади.

5. 1-банд бўйича композицияда, композиция азот оксиди (NOS) синтазаси устмахсулотини ингибирлайди, кальций билан нейронларнинг перегрузкасининг олдини олади ва эркин радикалларни ютади.

6. 1-банд бўйича композицияда нейроцереброваскуляр хасталиклар ишемия, миёга қон қуйилиши, миёга қон қуйилишидан кейинги хасталиклар, қон қуйилишлар, реперфузион бузилишлар, тромбоз, қон томирларининг торайиши, азот оксиди билан индуцирланган эркин радикаллар билан оксидланган бузилишлар, инфаркт, яллиғланишлар ва Альцгеймер касалликларидан ташкил топган гуруҳдан танланади.

7. 1-банд бўйича композицияда композициянинг А фракцияси энг самаралидир.

8. 1-банд бўйича композиция таблеткалар, капсулалар, суппозиторийлар, шариклар ва аэрозоллардан ташкил топган гуруҳдан танланган турли етказиб бериш тизимларининг шакли ҳисобланади.

9. 1-банд бўйича композициянинг терапевтик самарали микдорини киритиш йўли билан ҳайвонлар, жумладан, инсонда нейроцереброваскуляр хасталикларни даволаш усули.

10. 9-банд бўйича усул азот оксиди синтазаси уст махсулотини ингибирлаш, кальций билан нейронлардан кальций йиғилиб қолишини олдини олиш ва эркин радикалларни йўқотишни ўз ичига олади.

11. 9-банд бўйича усулда нейроцереброваскуляр хасталиклар ишемия, миёга қон қуйилиши, миёга қон қуйилишидан кейинги хасталиклар, қон қуйилишлар, реперфузион бузилишлар, тромбоз,

қон томирларининг торайиши, азот оксиди билан индуцирланган эркин радикаллар билан оксидланган бузилишлар, инфаркт, яллиғланишлар ва Альцгеймер касалликларидан ташкил топган гуруҳдан танланади.

12. 9-банд бўйича усулда композициянинг А фракцияси энг самаралидир.

13. 9-банд бўйича усулда композиция таблеткалар, капсулалар, суппозиторийлар, шариклар ва аэрозоллардан ташкил топган гуруҳдан танланган турли етказиб бериш тизимларининг шакли ҳисобланади .

14. 1-банд бўйича композициянинг терапевтик самарали миқдорини киритиш йўли билан ҳайвонлар, жумладан, инсонда ишемияни даволаш усули

15. 14-банд бўйича усулда бош миянинг оғир ишемияси даволанади.

16. 14-банд бўйича усулда самарали миқдор бўлинган умумий доза схемаси бўйича 10-1000 мг/кунни ташкил қилади.

17. 14-банд бўйича усулда композиция турли, жумладан, қорин ичи ва перорал усулларда киритилади.

18. 14-банд бўйича усул кальций ионлари билан митохондрийлар перегрузкасини олдини олади.

19. 14-банд бўйича усулда А фракцияси энг самаралидир.

20. 1-банд бўйича композициянинг терапевтик самарали миқдорини киритиш йўли билан ҳайвонлар, жумладан, инсонда мияга қон қуйилишини даволаш усули.

21. 20-банд бўйича усулда мияга қон қуйилишлари тромботик, эмболик ва ўчоқли мияга қон қуйилишини ўз ичига олган гуруҳдан танланади.

22. 20-банд бўйича усулда самарали миқдор бўлинган умумий доза схемаси бўйича 10-1000 мг/кунни ташкил қилади.

23. 20-банд бўйича усулда композиция турли, жумладан, қорин ичи ва перорал усулларда киритилади.

24. 20-банд бўйича усулда А фракцияси энг самаралидир.

25. 1-банд бўйича композициянинг терапевтик самарали миқдорини киритиш йўли билан ҳайвонлар, жумладан, инсонда қон қуйилишини даволаш усули.

26. 25-банд бўйича усулда самарали миқдор бўлинган умумий доза схемаси бўйича 10-500 мг/кунни ташкил қилади.

27. 25-банд бўйича усулда композиция турли, жумладан, қорин ичи ва перорал усулларда киритилади.

28. 25-банд бўйича усулда А фракцияси энг самаралидир.

29. 1-банд бўйича композициянинг терапевтик самарали миқдорини киритиш йўли билан ҳайвонлар, жумладан, инсонда тромбозни даволаш усули.

30. 29-банд бўйича усулда тромбоз церебрал, коронар тромбоз ва чуқур веналар тромбозини ўз ичига олган гуруҳдан танланади.

31. 29-банд бўйича усулда самарали миқдор бўлинган умумий доза схемаси бўйича 10-1000 мг/ кунни ташкил қилади.

32. 29-банд бўйича усулда композиция турли, жумладан, қорин ичи ва перорал усулларда киритилади.

33. 29-банд бўйича усул тромбни чорак миқдорга кичрайтиради.

34. 29-банд бўйича усулда А фракцияси энг самаралидир.

35. 1-банд бўйича композициянинг терапевтик самарали миқдорини киритиш йўли билан ҳайвонлар, жумладан, инсонда артериал гипертензияни даволаш усули.

36. 35-банд бўйича усулда самарали миқдор бўлинган умумий доза схемаси бўйича 10-1000 мг/кунни ташкил қилади.

37. 35-банд бўйича усулда композиция турли, жумладан, қорин ичи ва перорал усулларда киритилади.

38. 35-банд бўйича усул қон босимини тахминан 40%га пасайтиради.

39. 35-банд бўйича усул қон босимини нормал ҳолда ушлайди.

40. 35-банд бўйича усулда А фракцияси энг самаралидир.

41. 1-банд бўйича композициянинг терапевтик самарали миқдорини киритиш йўли билан ҳайвонлар, жумладан, инсонда қон томирлари торайишини даволаш усули.

42. 41-банд бўйича усулда самарали миқдор бўлинган умумий доза схемаси бўйича 10-1000 мг/кунни ташкил қилади.

43. 41-банд бўйича усулда композиция турли, жумладан, қорин ичи ва перорал усулларда киритилади.

44. 41-банд бўйича усулда А фракцияси энг самаралидир.

45. 1-банд бўйича композициянинг терапевтик самарали миқдорини киритиш йўли билан ҳайвонлар, жумладан, инсонда супероксид ва азот оксиди билан индуцирланган эркин радикаллар билан оксидалниш хасталигини даволаш усули.

46. 45-банд бўйича усул кислород, жумладан, супероксиддисмутаза (SOD) ва каталазани ютувчи ферментлар даражасини оширади.

47. 45-банд бўйича усул реакциявийлик хоссага эга тиобарбитур кислотаси (TBARS) даражасини пасайтиради.

48. 45-банд бўйича усулда самарали миқдор бўлинган умумий доза схемаси бўйича 10-1000 мг/ кунни ташкил қилади.

49. 45-банд бўйича усулда композиция турли, жумладан, қорин ичи ва перорал усулларда кирилади.

50. 45-банд бўйича усулда А фракцияси энг самаралидир.

51. 1-банд бўйича композициянинг терапевтик самарали миқдорини киритиш йўли билан ҳайвонлар, жумладан, инсонда шиши даволаш усули.

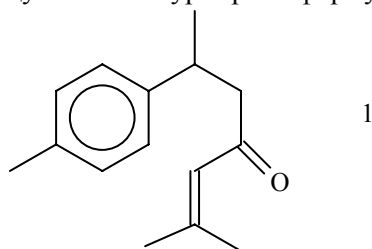
52. 51-банд бўйича усул таркибига мия шиши ва ўпка шиши кирган гуруҳдан танланган турли хил шишларни даволашни ўз ичига олади.

53. 51-банд бўйича усулда самарали миқдор бўлинган умумий доза схемаси бўйича 10-1000 мг/ кунни ташкил қилади.

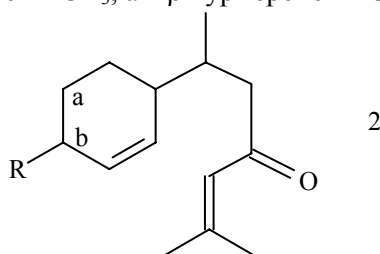
54. 51-банд бўйича усулда композиция турли, жумладан, қорин ичи ва перорал усулларда кирилади.

55. 51-банд бўйича усулда А фракцияси энг самаралидир.

1. Композиция для лечения нейроцереброваскулярных нарушений, полученная из растворимого липидного экстракта корневищ видов *Curcuma* семейства *Zingiberaceae*, содержащая фракцию А, состоящую из α -d-турмерона формулы 1



и α - и β -турмерона формулы 2, в которой в α -турмероне $R=CH_3$, а в β -турмероне $R=CH_2$



необязательно вместе с фракцией В, состоящей из куркумена и зингиберина, и фракцией С, состоящей из гермакрона, куркумерона, зедоарона, зедоарондиола, изозедоаронидиола, куркумена и курлона, и/или фармацевтически приемлемые добавки.

2. Композиция по п. 1, в которой видом *Curcuma* является *Curcuma domestica* Valetton.

3. Композиция по п. 1, в которой соотношение фракции А, фракции В и фракции С составляет от 1-3:1 до 3:1-3.

4. Композиция по п. 1, в которой добавки выбирают из группы, состоящей из мелатонина, антиоксидантов, антагонистов кальциевых каналов, тканевого активатора плазминогена (t-РА) и агентов, стабилизирующих клеточные мембраны.

5. Композиция по п. 1, где композиция ингибирует сверхпродукцию синтазы оксида азота (NOS), предотвращает перегрузку нейронов кальцием и поглощает свободные радикалы.

6. Композиция по п. 1, где нейроцереброваскулярные нарушения выбирают из группы, состоящей из ишемии, удара, расстройства после удара, кровоизлияния, реперфузионного поражения, тромбоза, сужения кровеносных сосудов, индуцированного оксидом азота окислительного поражения свободными радикалами, инфаркта, воспаления и болезни Альцгеймера.

7. Композиция по п. 1, где фракция А композиции является наиболее эффективной.

8. Композиция по п. 1, которая является формой различных систем доставки, выбранной из группы, состоящей из таблеток, капсул, суппозиторий, шариков и аэрозолей.

9. Способ лечения нейроцереброваскулярных нарушений у животных, включая человека, путем введения терапевтически эффективного количества композиции по п. 1.

10. Способ по п. 9, где указанный способ включает ингибирование сверхпродукции синтазы оксида азота, предотвращение накопления кальция в нейронах и удаление свободных радикалов.

11. Способ по п. 9, в котором нейроцереброваскулярные нарушения выбирают из группы, включающей ишемию, удар, расстройство после удара, кровоизлияние, реперфузионное повреждение, тромбоз, сужение кровеносных сосудов, индуцированное оксидом азота окислительное поражение свободными радикалами, инфаркт, воспаление и болезнь Альцгеймера.

12. Способ по п. 9, где фракция А композиции является наиболее эффективной.

13. Способ по п. 9, где композицию является формой различных систем доставки, выбранной из группы, состоящей из таблеток, капсул, суппозиторий, шариков и аэрозолей.

14. Способ лечения ишемии у животных, включая человека, путем введения терапевтически эффективного количества композиции по п. 1.

15. Способ по п. 14, при котором лечат тяжелую ишемию головного мозга.

16. Способ по п. 14, в котором эффективное количество составляет 10-1000 мг/день по схеме разделенной общей дозы.

17. Способ по п. 14, в котором указанную композицию вводят различными способами, включая внутрибрюшинный и пероральный.
18. Способ по п. 14, где указанный способ предотвращает перегрузку митохондрий ионами кальция.
19. Способ по п. 14, в котором фракция А является наиболее эффективной.
20. Способ лечения удара у животных, включая человека, путем введения терапевтически эффективного количества композиции по п. 1.
21. Способ по п. 20, в котором удары выбирают из группы, включающей тромботический, эмболический и очаговый удар.
22. Способ по п. 20, в котором эффективное количество составляет 10-1000 мг/день по схеме разделенной общей дозы.
23. Способ по п. 20, в котором указанную композицию вводят различными способами, включая внутрибрюшинный и пероральный.
24. Способ по п. 20, в котором фракция А является наиболее эффективной.
25. Способ лечения кровоизлияния у животных, включая человека, путем введения терапевтически эффективного количества композиции по п. 1.
26. Способ по п. 25, в котором эффективное количество составляет 10-500 мг/день по схеме разделенной общей дозы.
27. Способ по п. 25, в котором указанную композицию вводят различными способами, включая внутрибрюшинный и пероральный.
28. Способ по п. 25, в котором фракция А является наиболее эффективной.
29. Способ лечения тромбоза у животных, включая человека, путем введения терапевтически эффективного количества композиции по п. 1.
30. Способ по п. 29, в котором тромбоз выбирают из группы, включающей церебральный, коронарный тромбоз и тромбоз глубоких вен.
31. Способ по п. 29, в котором эффективное количество составляет 10-1000 мг/день по схеме разделенной общей дозы.
32. Способ по п. 29, в котором указанную композицию вводят различными способами, включая внутрибрюшинный и пероральный.
33. Способ по п. 29, где указанный способ уменьшает тромб на одну четверть.
34. Способ по п. 29, в котором фракция А является наиболее эффективной.
35. Способ лечения артериальной гипертонии у животных, включая человека, путем введения терапевтически эффективного количества композиции по п. 1.
36. Способ по п. 35, в котором эффективное количество составляет 10-1000 мг/день по схеме разделенной общей дозы.
37. Способ по п. 35, в котором указанную композицию вводят различными способами, включая внутрибрюшинный и пероральный.
38. Способ по п. 35, причем указанный способ снижает кровяное давление приблизительно на 40%.
39. Способ по п. 35, причем указанный способ поддерживает кровяное давление нормальным.
40. Способ по п. 35, в котором фракция А является наиболее эффективной.
41. Способ лечения сужения кровеносных сосудов у животных, включая человека, путем введения терапевтически эффективного количества композиции по п. 1.
42. Способ по п. 41, в котором эффективное количество составляет 10-1000 мг/день по схеме разделенной общей дозы.
43. Способ по п. 41, в котором указанную композицию вводят различными способами, включая внутрибрюшинный и пероральный.
44. Способ по п. 41, в котором фракция А является наиболее эффективной.
45. Способ лечения индуцированного супероксидом и оксидом азота окислительного поражения свободными радикалами у животных, включая человека, путем введения терапевтически эффективного количества композиции по п. 1.
46. Способ по п. 45, причем указанный способ повышает уровень ферментов, поглощающих кислород, включая супероксиддисмутазу (SOD) и каталазу.
47. Способ по п. 45, причем указанный способ снижает уровень реакционноспособной тиобарбитуровой кислоты (TBARS).
48. Способ по п. 45, в котором эффективное количество составляет 10-1000 мг/день по схеме разделенной общей дозы.
49. Способ по п. 45, в котором указанную композицию вводят различными способами, включая внутрибрюшинный и пероральный.
50. Способ по п. 45, в котором фракция А является наиболее эффективной.
51. Способ лечения отека у животных, включая человека, путем введения терапевтически эффективного количества композиции по п. 1.
52. Способ по п. 51, указанный способ включает лечение различных типов отека, выбранных из группы, включающей отек мозга и отек легкого.
53. Способ по п. 51, в котором эффективное количество составляет 10-1000 мг/день по схеме разделенной общей дозы.

54. Способ по п. 51, в котором указанную композицию вводят различными способами, включая внутрибрюшинный и пероральный.

55. Способ по п. 51, в котором фракция А является наиболее эффективной.

(11) IAP 03622

(13) C

(51) 8 A 61 K 31/683, A 61 K 31/185, A 61 K 9/08, A 61 K 9/10, A 61 K 9/20, A 61 K 9/48, A 61 P 1/00

(21) IAP 2006 0210

(22) 05.06.2006

(31)(32)(33) 2005117552/15, 07.06.2005, RU

(71)(73) "Нижегородский химико-фармацевтический завод" очик турдаги акциядорлик жамияти, RU

Открытое акционерное общество "Нижегородский химико-фармацевтический завод", RU

(72) ИКСАНОВ Рустам Мунирович; ИВАНОВ Иван Владимирович; ЖУКОВА Людмила Владимировна; РУДЬКО Александр Иосифович; ЕРЕМИНА Светлана Александровна; МОРУГИНА Людмила Валентиновна, RU

(54) Гепатопротектор фаолликка эга бўлган ва алмашинув жараёнларини нормаллаштирувчи композиция

Композиция, обладающая гепатопротекторной активностью и нормализующая обменные процессы

(57) 1. Гепатопротектор фаолликка эга бўлган ва алмашинув жараёнларини нормаллаштирувчи, ўсимлик ва ҳайвонлардан олинган фосфолипид, органик кислота ва тўлдирувчини ўз ичига олган фармацевтик композиция, шу билан ф а р қ л а н а д и к и, органик кислота сифатида унинг таркибига фосфолипид ва аминокислота суммар таркиби 15-80 % ва уларнинг масса нисбати 2:1 бўлгандаги, ўрнини босиб бўлмайдиган аминокислота кирган.

2. 1-банд бўйича фармацевтик композиция, шу билан ф а р қ л а н а д и к и, унинг таркибига ўрнини босиб бўлмайдиган аминокислота сифатида α -амино- γ -метилтиоёғ кислотаси (метионин) ёки α -амино- β -оксиёғ кислотаси (треонин) кирган.

3. 1-банд бўйича фармацевтик композиция, шу билан ф а р қ л а н а д и к и, унинг таркибига ўсимликдан олинган фосфолипид сифатида соядан олинган фосфолипид кирган.

4. 1-банд бўйича фармацевтик композиция, шу билан фаркланадики, унинг таркибига ҳайвондан олинган фосфолипид сифатида тухум сариғидан олинган фосфолипид кирган.

5.3 ва 4-бандлар бўйича фармацевтик композиция, шу билан ф а р қ л а н а д и к и, унинг тар-

кибига кирган фосфолипид 73-79 мас.% фосфатидилхолинни ўз ичига олади.

6. 1-банд бўйича фармацевтик композиция, шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у таблетка, гранула ёки пеллет кўринишида қилинган бўлиши мумкин.

7. 6-банд бўйича фармацевтик композиция, шу билан ф а р қ л а н а д и к и, таблеткалар, ёки гранулалар, ёки пеллетлар полимер асосидаги кобик билан қопланиши мумкин.

8. 6 ва 7-бандлар бўйича фармацевтик композиция, шу билан ф а р қ л а н а д и к и, пеллет ёки грануларнинг маълум миқдори перорал киритиш учун фармацевтик мувофиқ капсулага жойлаштирилиши мумкин.

9. 8-банд бўйича фармацевтик композиция, шу билан ф а р қ л а н а д и к и, капсула пеллет ва гранулалар билан шундай миқдорда тўлдирилади, ундаги таъсир кўрсатувчи моддалар миқдори терапевтик дозага эквивалентдир.

10. 1-банд бўйича фармацевтик композиция, шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у тўлдирувчи сифатида соя ўсимлик ёғини ўз ичига олган.

11. 10-банд бўйича фармацевтик композиция, шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у перорал киритиш учун фармацевтик мувофиқ капсулага шундай миқдорда жойлаштириладики, ундаги таъсир кўрсатувчи моддалар миқдори терапевтик дозага эквивалентдир.

12. 1-банд бўйича фармацевтик композиция, шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у инъекциялар, сироп, суспензия учун эритма кўринишида бажарилиши мумкин.

1. Фармацевтическая композиция, обладающая гепатопротекторной активностью и нормализующая обменные процессы и содержащая фосфолипид как растительного, так и животного происхождения, органическую кислоту и наполнитель, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что в качестве органической кислоты она содержит незаменимую аминокислоту при суммарном содержании фосфолипида и аминокислоты 15-80 мас.% и их массовом соотношении 2:1.

2. Фармацевтическая композиция по п. 1, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что она в качестве незаменимой аминокислоты содержит α -амино- γ -метилтиомасляную кислоту (метионин) или α -амино- β -оксимасляную кислоту (треонин).

3. Фармацевтическая композиция по п. 1, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что она в качестве фосфолипида растительного происхождения содержит фосфолипид из сои.

4. Фармацевтическая композиция по п. 1, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что она в качестве фосфоли-

пида животного происхождения содержит фосфолипид из яичного желтка.

5. Фармацевтическая композиция по пп. 3 и 4, отличающаяся тем, что входящий в ее состав фосфолипид содержит 73-79 мас.% фосфатидилхолина.

6. Фармацевтическая композиция по п. 1, отличающаяся тем, что она может быть выполнена в виде таблетки, гранулы или пеллеты.

7. Фармацевтическая композиция по п. 6, отличающаяся тем, что таблетки, или гранулы, или пеллеты могут быть покрыты оболочкой на основе полимера.

8. Фармацевтическая композиция по пп. 6 и 7, отличающаяся тем, что некоторое количество пеллет или гранул может быть помещено в фармацевтически приемлемую капсулу для перорального введения.

9. Фармацевтическая композиция по п. 8, отличающаяся тем, что капсула может быть заполнена пеллетами или гранулами в таком количестве, что содержание в них действующих веществ эквивалентно терапевтической дозе.

10. Фармацевтическая композиция по п. 1, отличающаяся тем, что она в качестве наполнителя содержит растительное масло – соевое.

11. Фармацевтическая композиция по п. 10, отличающаяся тем, что она может быть помещена в капсулу для перорального введения в таком количестве, что содержание в ней действующих веществ эквивалентно терапевтической дозе.

12. Фармацевтическая композиция по п. 1, отличающаяся тем, что она может быть выполнена в виде раствора для инъекций, сиропа, суспензии.

(11) IAP 03623

(13) С

(51) 8 А 61 К 36/00

(21) IAP 2005 0128

(22) 13.04.2005

(71)(73) Ўзбекистон Республикаси Фанлар академияси С.Ю.Юнусов номидаги ўсимлик моддалари кимёси институти, UZ

Институт химии растительных веществ им. С.Ю.Юнусова Академии наук Республики Узбекистан, UZ

(72) Маматханов Ахматхон Умарович, Азимова Шахноз Садиковна, Турахожаев Муратбек Турахожаевич, Якубова Мохира Рахимовна, Сыров Владимир Николаевич, UZ

(54) Экдистерон олиш усули

Способ получения экдистерона

(57) Ўсимлик хом ашёсини спирт билан экстракциялаш, экстрактни парлатиш, сув билан араштираш, хлороформ билан қайта ишлаш, хлороформни кетгизиш, органик эритма билан экдистероидларни сув эритмасидан олиш, олинган моддаларни қуюлтириш, биргаликдаги моддаларни чўктириш ва ҳосил бўлган чўкиндини йўқотиш, алюминий оксидага экстрактни хроматографик тозалаш, органик эритма билан экдистеронни элюирлаш ва уни қайта кристаллаш йўли билан экдистерон олиш усули шу билан фарқланади, ўсимлик хом ашёси сифатида туркистон живучкасининг (*Ajuga turkestanica*) ер усти қисмидан фойдаланилади, ўсимлик хом ашёси экстракцияси 95%-ди этанол билан амалга оширилади, экдистероидларнинг сув эритмасидан олиниши бутанол билан олиб борилади, биргаликдаги моддалар ацетон билан тиндирилади, экдистерон хлороформ-изопропил спирти билан уларнинг мос равишда 3:1 га тенг ҳажм нисбатида элюирланади.

Способ получения экдистерона путем экстракции растительного сырья спиртом, упаривания экстракта, разбавления его водой, обработки хлороформом, удаления хлороформного извлечения, извлечения экдистероидов из водного раствора органическим растворителем, сгущения извлечения, осаждения сопутствующих веществ и удаления образовавшегося осадка, хроматографической очистки экстракта на окиси алюминия, элюирования экдистерона органическим растворителем и его перекристаллизации, отличающийся тем, что в качестве растительного сырья используют надземную часть живучки туркестанской (*Ajuga turkestanica*), экстракцию растительного сырья осуществляют 95%-ным этанолом, извлечение экдистероидов из водного раствора ведут бутанолом, осаждают сопутствующие вещества ацетоном, элюируют экдистерон смесью хлороформ-изопропиловый спирт при их объемном соотношении, равном 3:1 соответственно.

(11) IAP 03624

(13) С

(51) 8 А 61 К 38/08, А 61 К 9/08, А 61 К 47/26

(21) IAP 2004 0247

(22) 15.11.2002

(31)(32)(33) 10157628.5, 26.11.2001, DE

(71)(73) Центарис ГмбХ., DE

(72) САРЛИКИОТИС, Вернер, GR; БАУЕР, Хорст; РИШЕР, Матиас; ЭНГЕЛЬ, Юрген; ГЮТЛЯЙН, Франк; ДИ СТЕФАНО, Доминик, DE

(85) 28.06.2004

(86) PCT/EP 02/12798, 15.11.2002

(87) WO 03/045419, 05.06.2003

(54) LHRH антагонистининг инъекцион эритмаси

Инъекционный раствор антагониста LHRH

(57) 1. Таркибига глюкокон кислотаси, тўлдирувчи кирган ва юзаки фаол модданинг кириши шарт бўлмаган, LHRH антагонистининг сувли инъекцион эритмаси шу билан ф а р қ л а н а д и к и, LHRH антагонисти сифатида цетрореликс, тевереликс, D-63153 (Ac-D-Nal-pCl-D-Phe-3-D-Pal-Ser-N-Me-Tyr-D-H-Cit-Iso-Leu-Arg-Pro-D-Ala-NH₂), ганиреликс, абареликс, антид ёки азалин В ишлатилади, шу билан бирга глюкокон кислотаси LHRH антагонисти миқдори ҳисобидан эквимольдан кўпроқ миқдорда иштирок этади, бунда глюкокон кислотаси глюкокон кислотасининг дельта-лактони кўринишида қўшилади, тўлдирувчи сифатида маннит, юзаки фаол модда сифатида эса, Твин-80 ишлатилади.

2. 1-банд бўйича ўз ичига юзаки фаол модда сифатида Твин-80 Они олган, LHRH антагонистининг сувли инъекцион эритмаси.

3. 1-банд бўйича ўз ичига қуйидагиларни олган LHRH антагонистининг сувли инъекцион эритмаси:

500 мг цетрореликс,

2,4 г глюкокон кислотасининг дельта-лактони,

2 г Твин-80,

95,0 г маннит

2 л инъекция учун сув.

4. 1-банд бўйича глюкокон кислотаси дельта-лактонининг тўйинган эритмаси билан 50 млгача етказилган қуйидаги молддаларни ўз ичига олган LHRH антагонистининг сувли инъекцион эритмаси:

500 мг D-63153,

100 мг Твин-80,

475 мг маннит.

5. 1-банд бўйича глюкокон кислотаси дельта-лактонининг тўйинган эритмаси билан 100 млгача етказилган қуйидаги молддаларни ўз ичига олган LHRH антагонистининг сувли инъекцион эритмаси:

100 мг тевереликс,

100 мг Твин-80,

475 мг маннит.

6. 1-5-бандларнинг ҳар бири бўйича LHRH антагонистининг сувли инъекцион эритмаларини олиш усули шу билан ф а р қ л а н а д и к и, альтернатив равишда, LHRH антагонисти, глюкокон кислотаси LHRH антагонисти миқдори ҳисобидан эквимольдан кўпроқ миқдорда иштирок этадиган глюкокон кислотасининг дельта-лактони

кўринишидаги глюкокон кислотаси, тўлдирувчи сифатида маннит ва юзаки фаол модда сифатида қўшилиши шарт бўлмаган Твин-80 инъекциялар учун сувда эритилади, гомогенизацияланади ва инъекция мақсадлари учун қайта ишланади; ёки LHRH антагонисти, тўлдирувчи сифатида маннит ва юзаки фаол модда сифатида қўшилиши шарт бўлмаган Твин-80 глюкокон кислотаси дельта-лактонининг тўйинган сувли эритмасида эритилади, гомогенизацияланади ва инъекция мақсадлари учун қайта ишланади.

1. Водный инъекционный раствор антагониста LHRH, содержащий глюконовую кислоту, наполнитель и необязательно поверхностно-активное вещество, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что в качестве антагониста LHRH используют цетрореликс, тевереликс, D-63153 (Ac-D-Nal-pCl-D-Phe-3-D-Pal-Ser-N-Me-Tyr-D-H-Cit-Iso-Leu-Arg-Pro-D-Ala-NH₂), ганиреликс, абареликс, антид или азалин В, при этом глюконовая кислота присутствует в более чем эквимольном количестве из расчета на количество антагониста LHRH, где глюконовую кислоту добавляют в виде дельта-лактона глюконовой кислоты, в качестве наполнителя используют маннит, а в качестве поверхностно-активного вещества используют Твин-80.

2. Водный инъекционный раствор антагониста LHRH по пункту 1, дополнительно включающий в себя Твин-80 в качестве поверхностно-активного вещества.

3. Водный инъекционный раствор антагониста LHRH по пункту 1, включающий в себя:

500 мг цетрореликса,

2,4 г дельта-лактона глюконовой кислоты,

2 г Твина-80,

95,0 г маннита

в 2 л воды для инъекций.

4. Водный инъекционный раствор антагониста LHRH по пункту 1, включающий в себя:

500 мг D-63153,

100 мг Твина-80,

475 мг маннита,

доведенных до 50 мл насыщенным раствором дельта-лактона глюконовой кислоты.

5. Водный инъекционный раствор антагониста LHRH по пункту 1, включающий в себя

100 мг тевереликса,

100 мг Твина-80,

475 мг маннита,

доведенных до 100 мл насыщенным раствором дельта-лактона глюконовой кислоты.

6. Способ получения водных инъекционных растворов антагониста LHRH по любому из пунктов 1-5, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что альтер-

нативно антагонист LHRH, глюконовую кислоту в виде дельта-лактона глюконовой кислоты, где глюконовая кислота присутствует в более чем эквимольном количестве из расчета на количество антагониста LHRH, маннит в качестве наполнителя и необязательно Твин-80 в качестве поверхностно-активного вещества растворяют в воде для инъекций, гомогенизируют и перерабатывают для инъекционных целей; или антагонист LHRH, маннит в качестве наполнителя и необязательно Твин-80 в качестве поверхностно-активного вещества растворяют в насыщенном водном растворе дельта-лактона глюконовой кислоты, гомогенизируют и перерабатывают для инъекционных целей.

(11) IAP 03625

(13) C

(51) 8 A 61 K 47/48

(21) IAP 2003 0938

(22) 22.01.2002

(31)(32)(33) 60/263,435, 23.01.2001, US

(71)(73) АВЕНТИС ПАСТЕР, US

(72) РАЙЭЛЛ, Роберт, П., US

(85) 22.08.2003

(86) PCT/US 02/01963, 22.01.2002

(87) WO 02/058737, 01.08.2002

(54) Иммунологик композиция

Иммунологическая композиция

(57) 1. Иммунологик композиция таркибига иккита-гуртта алоҳида бўлган ёки алоҳида тайёрланган оксил билан полисахарид конъюгатлар комбинацияси киради, шунинг билан бирга конъюгатларнинг ҳар бири оксил ташувчи билан конъюгирланган А, С, W-135 ёки Y олтингугурт гуруҳларнинг N.meningitidisдан олинган тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади, бунда камида битта олтингугуртгуруҳ W-135 ёки Yдан иборат.

2. 1-банд бўйича иммунологик композицияда капсулани полисахаридларнинг камида биттаси А ёки С олтингугурт гуруҳнинг N. meningitidisдан олинган.

3.2-банд бўйича иммунологик композицияда капсулани полисахаридларнинг камида биттаси А олтингугурт гуруҳнинг N.meningitidisдан олинган.

4. 2-банд бўйича иммунологик композицияда капсулани полисахаридларнинг камида биттаси С олтингугурт гуруҳнинг N.meningitidisдан олинган.

5. 1-банд бўйича таркибига иккита алоҳида бўлган ёки алоҳида тайёрланган оксил билан полисахарид конъюгатларнинг комбинацияси кирган иммунологик композиция, бунда биринчи конъюгат W-135 олтингугуртгуруҳнинг N. meningi-

tidis тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади, иккинчи конъюгат А, С, ёки Y олтингугурт гуруҳларнинг N.meningitidis тозаланган капсулани полисахаридларидан ташкил топган гуруҳдан танланган тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади.

6. 5-банд бўйича иммунологик композицияда иккинчи конъюгат Y олтингугурт гуруҳнинг N. meningitidis тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади.

7. 5-банд бўйича иммунологик композицияда иккинчи конъюгат А олтингугурт гуруҳнинг N. meningitidis тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади.

8. 5-банд бўйича иммунологик композицияда иккинчи конъюгат С олтингугурт гуруҳнинг N. meningitidis тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади.

9. 1-банд бўйича таркибига иккита алоҳида бўлган ёки алоҳида тайёрланган оксил билан полисахарид конъюгатлари комбинацияси кирган иммунологик композиция, бунда биринчи конъюгат Y олтингугурт гуруҳнинг N. meningitidisдан олинган тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади, иккинчи конъюгат эса, А ёки С олтингугурт гуруҳларнинг N. meningitidisдан олинган тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади.

10.9-банд бўйича иммунологик композицияда иккинчи конъюгат А олтингугурт гуруҳнинг N. meningitidisдан олинган тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади.

11. 9-банд бўйича иммунологик композицияда иккинчи конъюгат С олтингугурт гуруҳнинг N. meningitidisдан олинган тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади.

12. 1-банд бўйича таркибига учта алоҳида бўлган ёки алоҳида тайёрланган оксил билан полисахарид конъюгатлари комбинацияси кирган иммунологик композиция, бунда биринчи конъюгат W-135 олтингугурт гуруҳнинг N.meningitidis тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади, иккинчи конъюгат Y олтингугурт гуруҳнинг N. meningitidis тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади, учинчи конъюгат эса, Y, А ёки С олтингугурт гуруҳлардан ташкил топган гуруҳдан танланган N.meningitidis тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади, бунда иккинчи конъюгат учинчи конъюгатдан фарқ қилади.

13. 12-банд бўйича иммунологик композицияда иккинчи конъюгат ва учинчи конъюгатлардан камида биттаси Y олтингугурт гуруҳнинг N.meningitidis тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади.

14. 12-банд бўйича иммунологик композицияда иккинчи конъюгат ва учинчи конъюгатлардан камида биттаси А олтингугурт гуруҳнинг *N.meningitidis* тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади.

15. 12-банд бўйича иммунологик композицияда иккинчи конъюгат ва учинчи конъюгатлардан камида биттаси С олтингугурт гуруҳнинг *N.meningitidis* тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади.

16. 1-банд бўйича таркибига тўртта алоҳида бўлган ёки алоҳида тайёрланган оксил билан полисахарид конъюгатлари комбинацияси кирган иммунологик композиция, бунда биринчи конъюгат W-135 олтингугурт гуруҳнинг *N.meningitidis* тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади, иккинчи конъюгат Y олтингугурт гуруҳнинг *N.meningitidis* тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади, учинчи конъюгат А олтингугурт гуруҳнинг *N.meningitidis* тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади, тўртинчи конъюгат эса, С олтингугурт гуруҳнинг *N.meningitidis* тозаланган капсулани полисахаридни ўз ичига олади.

17. 1-банд бўйича қўшимча равишда адьювантни ўз ичига олган иммунологик композиция.

18. 17-банд бўйича иммунологик композицияда ушбу адьювант алюминли адьювант, Фройнд адьюванти, N-(2-дезоксид-лейциламино-β-D-глюкопиранозил)-N-октадецилдодеканоиламид гидроацетат, 3-β-[N-(N',N"-диметиламиноэтан)-карбамоил]холестерин, поли[бис(карбоксилат-феноксид)фосфазен] ва ёки поли[ди(карбоксилат-феноксид)фосфазен], монофосфорил липид А, олигодезоксинуклеотидли мотивлар, сапонинли адьювантлар, вабо ва формил-метионилли токсинни ўз ичига олган гуруҳдан танланган.

19. 18-банд бўйича иммунологик композицияда адьювант алюминий гидроксиддан иборат.

20. 17-банд бўйича иммунологик композицияда ушбу оксил ташувчи бир турдаги оксилдан иборат.

21. 20-банд бўйича иммунологик композицияда ушбу бир турдаги оксил *Corynebacteria diphtheriae*, *Clostridium tetani*, *Bordetella pertussis*, *Pseudomonas aeruginosa* ва *Escherichia coli*дан ташкил топган гуруҳдан танланган бактериядан олинган инактивацияланган бактериал токсинни ўз ичига олади.

22. 21-банд бўйича иммунологик композицияда инактивацияланган бактериал токсин *Corynebacteria diphtheriae*дан олинган.

23. 22-банд бўйича иммунологик композицияда инактивацияланган бактериал токсин *Corynebacteria diphtheriae* CRM197дан олинган.

24. 16-банд бўйича стерил суюқлик кўринишида олинган иммунологик композиция.

25. 16-банд бўйича қўшимча равишда фармацевтик мувофиқ консервантни ўз ичига олган иммунологик композиция.

26. 25-банд бўйича иммунологик композицияда ушбу фармацевтик мувофиқ консервант бензил спирти, парабенлар, тиомерсал, хлорбутанол ва хлорид бензалконийни ўз ичига олган рўйхатдан танланган.

1. Иммунологическая композиция, содержащая комбинацию двух, трех или четырех отдельных и отдельно приготовленных конъюгатов полисахарида с белком, причем каждый из конъюгатов содержит очищенный капсульный полисахарид, полученный из *N. meningitidis* серогрупп А, С, W-135 или Y, конъюгированных с белком-носителем, где по меньшей мере одна серогруппа представляет собой W-135 или Y.

2. Иммунологическая композиция по п. 1, в которой по меньшей мере один из капсульных полисахаридов получен из *N. meningitidis* серогруппы А или С.

3. Иммунологическая композиция по п. 2, в которой по меньшей мере один из капсульных полисахаридов получен из *N. meningitidis* серогруппы А.

4. Иммунологическая композиция по п. 2, в которой по меньшей мере один из капсульных полисахаридов получен из *N. meningitidis* серогруппы С.

5. Иммунологическая композиция по п. 1, содержащая комбинацию двух отдельных и отдельно приготовленных конъюгатов полисахарида с белком, причем первый конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид *N. meningitidis* серогруппы W-135, а второй конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид, выбранный из группы, состоящей из очищенных капсульных полисахаридов *N. meningitidis* серогрупп Y, А или С.

6. Иммунологическая композиция по п. 5, в которой второй конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид *N. meningitidis* серогруппы Y.

7. Иммунологическая композиция по п. 5, в которой второй конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид *N. meningitidis* серогруппы А.

8. Иммунологическая композиция по п. 5, в которой второй конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид *N. meningitidis* серогруппы С.

9. Иммунологическая композиция по п. 1, содержащая комбинацию двух отдельных и отдельно приготовленных конъюгатов полисахарида с белком, причем первый конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид из *N. meningitidis* серогруппы Y, а второй конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид из *N. Meningitidis* серогрупп A или C.

10. Иммунологическая композиция по п. 9, в которой второй конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид из *N. meningitidis* серогруппы A.

11. Иммунологическая композиция по п. 9, в которой второй конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид из *N. meningitidis* серогруппы C.

12. Иммунологическая композиция по п. 1, содержащая комбинацию трех отдельных и отдельно приготовленных конъюгатов полисахарида с белком, причем первый конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид из *N. meningitidis* серогруппы W-135, второй конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид *N. meningitidis*, выбранный из группы, состоящей из Y, A и C, а третий конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид *N. meningitidis*, выбранный из группы, состоящей из серогрупп Y, A или C, причем второй конъюгат отличается от третьего конъюгата.

13. Иммунологическая композиция по п. 12, в которой по меньшей мере один из второго конъюгата и третьего конъюгата содержит очищенный капсульный полисахарид из *N. meningitidis* серогруппы Y.

14. Иммунологическая композиция по п. 12, в которой по меньшей мере один из второго конъюгата и третьего конъюгата содержит очищенный капсульный полисахарид из *N. meningitidis* серогруппы A.

15. Иммунологическая композиция по п. 12, в которой по меньшей мере один из второго конъюгата и третьего конъюгата содержит очищенный капсульный полисахарид из *N. meningitidis* серогруппы C.

16. Иммунологическая композиция по п. 1, содержащая комбинацию четырех отдельных и отдельно приготовленных конъюгатов полисахарида с белком, причем первый конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид *N. meningitidis* серогруппы W-135, второй конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид *N. meningitidis* серогруппы Y, третий конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид *N. meningitidis* серогруппы A, а четвертый конъюгат содержит очищенный капсульный полисахарид *N. meningitidis* серогруппы C.

17. Иммунологическая композиция по п. 1, дополнительно содержащая адъювант.

18. Иммунологическая композиция по п. 17, где указанный адъювант выбран из группы, включающей алюминий адъювант, адъювант Фройнда, N-(2-дезоксид-L-лейциламино-β-D-глюкопиранозил)-N-октадецилдодеканоиламида гидроацетат, 3-β-[N-(N',N''-диметиламиноэтан)карбамоил]холестерин, поли[бис(карбоксилатфенокси)фосфазен] и/или поли[ди(карбоксилатфенокси)фосфазен], монофосфорил липид A, олигодезоксинуклеотидные мотивы, сапониновые адъюванты, токсин холеры и формил-метиониловый белок.

19. Иммунологическая композиция по п. 18, в которой адъювантом является гидроксид алюминия.

20. Иммунологическая композиция по п. 17, в которой указанный белок-носитель представляет собой белок одного вида.

21. Иммунологическая композиция по п. 20, в которой указанный белок одного вида включает инактивированный бактериальный токсин, полученный из бактерии, которая выбрана из группы, состоящей из *Corynebacteria diphtheriae*, *Clostridium tetani*, *Bordetella pertussis*, *Pseudomonas aeruginosa* и *Echerichia coli*.

22. Иммунологическая композиция по п. 21, в которой инактивированный бактериальный токсин получен из *Corynebacteria diphtheriae*.

23. Иммунологическая композиция по п. 22, в которой инактивированный бактериальный токсин получен из *Corynebacteria diphtheriae* CRM197.

24. Иммунологическая композиция по п. 16, полученная в виде стерильной жидкости.

25. Иммунологическая композиция по п. 16, дополнительно содержащая фармацевтически приемлемый консервант.

26. Иммунологическая композиция по п. 25, в которой указанный фармацевтически приемлемый консервант выбран из перечня, включающего бензиловый спирт, парабены, тиомерсал, хлорбутанол и бензалкония хлорид.

(11) IAP 03626

(13) C

(51) 8 A 61 M 5/32, A 61 M 5/50

(21) IAP 2005 0400

(22) 25.05.2004

(31)(32)(33) 10-2003-0033400, 26.05.2003; 10-2004-0014356, 03.03.2004, KR

(71)(72)(73) БАИК Вoo Ин, KR

(85) 25.11.2005

(86) PCT/KR 2004/001241, 25.05.2004

(87) WO 2004/103429, 02.12.2004

(54) Бир марталик шприц

Одноразовый шприц

(57) 1. Бир марталик шприц таркибига иккала томони очиқ цилиндр, цилиндрнинг бир томонидан киритилган ўтказувчи трубка, ўтказувчи трубкага ўрнатилган ва ўтказувчи трубканинг цилиндр ички периферияси билан герметик контактини таъминловчи қўшилган трубка, цилиндрга ўрнатилган поршень кирган, бунда ўтказувчи трубка кичик диаметр элементи ва ички диаметри кичик диаметр элементи диаметрдан катта бўлган катта диаметр элементини ўз ичига олади, қўшилган трубка таркибига эса ўтказувчи трубканинг катта диаметр элементи ички периферияси билан герметик контактда бўладиган контакт қилувчи элемент ва кичик диаметр элементига ўрнатилган қўшилган элемент кирган.

2. 1-банд бўйича қўшимча равишда биринчи контакт қилувчи элементнинг орқа учи ёнида кенгайиб кетадиган қилиб бажарилган ва цилиндрнинг ички периферияси билан контактда бўлувчи иккинчи контакт қилувчи элементни ўз ичига олган бир марталик шприц.

3. 2-банд бўйича бир марталик шприцда ўтказувчи трубканинг кичик диаметр элементи устида иккинчи бириктирувчи элемент бажарилган бўлиб, қўшилган трубканинг қўшилган элементида эса, ўтказувчи трубканинг иккинчи бириктирувчи элементига мос иккинчи бўртик бажарилган.

4. 3-банд бўйича бир марталик шприцда қўшилган трубканинг иккинчи бўртиги қўшилган трубканинг фақат олдинги қисмида бажарилган.

5. 3-банд бўйича бир марталик шприцда, қўшилган трубканинг иккинчи бўртиги қўшилган трубканинг олдинги учига нисбатан нишаб қилиб бажарилган.

6. 1-банд бўйича бир марталик шприцда, қўшилган трубка орқа учининг ёнида ички периферия бўйлаб, биринчи бириктирувчи элемент бажарилган, поршеннинг олдинги учининг ёнида эса, қўшилган трубка биринчи бириктирувчи элементига мос биринчи бўртик бажарилган.

7. 6-банд бўйича бир марталик шприцда қўшилган трубка биринчи бириктирувчи элементи ёки поршеннинг биринчи бўртиги нишаб қилиб бажарилган.

8. 1-банд бўйича бир марталик шприцда қўшилган трубка биринчи бириктирувчи элементининг ташки диаметри ўтказувчи трубка катта диаметр элементи ички диаметрдан ортик.

9. 1-банд бўйича бир марталик шприцда ўтказувчи трубканинг ташки перифериясида бўртик бажарилган, цилиндрнинг ички перифериясида эса, ўтказувчи трубканинг бўртигига мос келувчи тирқиш бажарилган.

10. 1-банд бўйича бир марталик шприцда камида ўтказувчи трубка ёки қўшилган трубка эгилувчан материалдан қилинган.

11. 1-банд бўйича бир марталик шприцда ўтказувчи трубканинг ташки перифериясида чиқиб турувчи элемент бажарилган, ушбу цилиндрнинг ички перифериясида эса, ўтказувчи трубканинг чиқиб турувчи элементига мос келувчи бўртик учун тирқиш бажарилган.

12. 1-банд бўйича бир марталик шприцда ўтказувчи трубканинг олдинги учига инъекцион суюкликни чиқариш учун кенгайиб кетувчи трубка бажарилган.

13. 12-банд бўйича бир марталик шприцда инъекцион суюкликни чиқариш учун трубкага шприц нинасини ушлагич қўшилган.

14. 12-банд бўйича бир марталик шприцда цилиндрнинг олд томонида ички перифериясида бўртик қилинган уловчи трубка қилинган, шприц нинасини ушлагичда эса, уловчи трубка бўртигига мос келувчи фланец бажарилган.

15. 12-банд бўйича бир марталик шприцда поршеннинг олд томонида инъекцион суюкликни чиқариш учун трубкага ўрнатилган, эксцентрик жойлашган, босим ҳосил қилувчи элемент бажарилган.

16. 15-банд бўйича бир марталик шприцда босим ҳосил қилувчи элемент эгилувчан материалдан бажарилган.

1. Одноразовый шприц, содержащий: цилиндр, оба конца которого открыты, переходную трубку, вставленную с одной стороны цилиндра, вставную трубку, вставленную в переходную трубку и обеспечивающую герметичный контакт переходной трубки с внутренней периферией цилиндра, и поршень, вставленный в цилиндр, при этом переходная трубка содержит элемент малого диаметра и элемент большого диаметра, внутренний диаметр которого превышает диаметр элемента малого диаметра, а вставная трубка содержит первый контактирующий элемент, находящийся в герметичном контакте с внутренней периферией элемента большого диаметра переходной трубки, и вставной элемент, вставленный в элемент малого диаметра.

2. Одноразовый шприц по п. 1, дополнительно содержащий второй контактирующий элемент, выполненный с расширением у заднего конца первого контактирующего элемента и находящийся в контакте с внутренней периферией цилиндра.

3. Одноразовый шприц по п. 2, в котором на элементе малого диаметра переходной трубки выполнен второй соединительный элемент, а на вставном элементе вставной трубки выполнен второй выступ, соответствующий второму соединительному элементу переходной трубки.

4. Одноразовый шприц по п. 3, в котором второй выступ вставной трубки выполнен только на передней части вставной трубки.

5. Одноразовый шприц по п. 3, в котором второй выступ вставной трубки выполнен с наклоном к переднему концу вставной трубки.

6. Одноразовый шприц по п. 1, в котором по внутренней периферии у заднего конца вставной трубки выполнен первый соединительный элемент, а у переднего конца поршня выполнен первый выступ, соответствующий первому соединительному элементу вставной трубки.

7. Одноразовый шприц по п. 6, в котором первый соединительный элемент вставной трубки или первый выступ поршня выполнен с наклоном.

8. Одноразовый шприц по п. 1, в котором наружный диаметр первого контактирующего элемента вставной трубки превышает внутренний диаметр элемента большего диаметра переходной трубки.

9. Одноразовый шприц по п. 1, в котором на внешней периферии переходной трубки выполнен выступ, а на внутренней периферии цилиндра выполнен паз, соответствующий выступу переходной трубки.

10. Одноразовый шприц по п. 1, в котором по меньшей мере переходная трубка или вставная трубка выполнена из упругого материала.

11. Одноразовый шприц по п. 1, в котором на внешней периферии переходной трубки выполнен выступающий элемент, а на внутренней периферии указанного цилиндра выполнен паз для вставки, соответствующий выступающему элементу переходной трубки.

12. Одноразовый шприц по п. 1, в котором на переднем конце переходной трубки выполнена с расширением трубка для выпуска инъекционной жидкости.

13. Одноразовый шприц по п. 12, в котором к трубке для выпуска инъекционной жидкости присоединен держатель иглы шприца.

14. Одноразовый шприц по п. 12, в котором на переднем конце цилиндра выполнена соединительная трубка, на внутренней периферии которой выполнен выступ, а на держателе иглы шприца выполнен фланец, соответствующий выступу соединительной трубки.

15. Одноразовый шприц по п. 12, в котором у переднего конца поршня выполнен эксцентрически расположенный создающий давление элемент, вставленный в трубку для выпуска инъекционной жидкости.

16. Одноразовый шприц по п. 15, в котором создающий давление элемент выполнен из упругого материала.

A 62

(11) IAP 03627

(13) C

(51) 8 A 62 B 18/00

(21) IAP 2006 0381

(22) 17.03.2005

(31)(32)(33) 0406291.5, 19.03.2004, GB

(71)(73) Скотт Хелт энд Сейфети Лтд, GB

(72) САТТОН, Роберт, Чарльз; РИЧАРДСОН, Грант, Стюарт, GB

(85) 19.10.2006

(86) PCT/GB 2005/050039, 17.03.2005

(87) WO 2005/089876, 29.09.2005

(54) Респиратор

Респиратор

(57) 1. Таркибида фойдаланувчига кўриш имкониятини берувчи кўриш учун ойнаси бор фойдаланувчининг камида юзини беркитиш учун респиратор, бунда ушбу респиратор ичкарида бирламчи фильтр орқали ташқаридан ҳаво тортилиши мумкин бўлган асосий ҳажм, ва фойдаланувчи оғзи ва бурнини қоплайдиган қилиб ўрнатилган ички ҳажм ҳосил қилиб, шу билан ф а р қ л а н а д и к и, асосий ҳажмдан ёрдамчи ҳажмга ўтувчи газни филтшлаш учун ёрдамчи филтрга эга.

2. 1-банд бўйича респиратор шу билан ф а р қ л а н а д и к и, ёрдамчи ҳажм фойдаланувчининг юзига тегиб турадиган жойи бўйича эгилувчан қаттиқликка эга оғиз бурун никоб шаклида бажарилган.

3. 1 ёки 2-бандлар бўйича респиратор шу билан ф а р қ л а н а д и к и, ташқаридан асосий ҳажмга ҳаво ичида кўрсатилган бирламчи фильтр ўрнатилган бирламчи киритувчи канал орқали сўрилади.

4. 3-банд бўйича респиратор шу билан ф а р қ л а н а д и к и, ушбу киритувчи канал қўшимча равишда ташқаридан ҳавони асосий ҳажмга ўтказиб, қарама-қарши йўналишга ўтказмайдиган қилиб ишлайдиган бир чизикли клапан билан таъминланган.

5. 4-банд бўйича респиратор шу билан ф а р қ л а н а д и к и, ушбу бир чизикли клапан бирламчи филтрининг оқими бўйлаб пастроқда жойлашган.

6. Юқоридаги бандларнинг ҳар бири бўйича респиратор шу билан ф а р қ л а н а д и к и, қўшимча бир чизикли клапан ҳаво оқими бўйича асосий ҳажмдан ёрдамчи ҳажм томон ўрнатилган, ушбу бир чизикли клапан ҳавони асосий ҳажмдан ёрдамчи ҳажмга ўтказиб, қарама-қарши йўналишга ўтказмайдиган қилиб ишлайди.

7. 6-банд бўйича респиратор шу билан ф а р қ л а н а д и к и, қўшимча бир чизикли клапан иккинчи фильтр оқими бўйлаб пастроқда жойлашган.

8. Юқоридаги бандларнинг ҳар бири бўйича респиратор шу билан фарқланадики, асосий ҳажмдан ёрдамчи ҳажмга ўтувчи ҳавони киритиш учун тешик, ушбу бирламчи киритиш каналиган нисбатан асосий ҳажмнинг қарама-қарши томонида шундай жойлашганки, ҳаво ушбу бирламчи киритиш каналидан ушбу киритиш каналига ўтиш чоғида кўриш ойнаси бўйлаб ўтади.

9. 8-банд бўйича респиратор шу билан фарқланадики, кўшимча равишда трубкани ўз ичига олиб, трубканинг киритиш тешиги таркибига асосий ҳажмдан ёрдамчи ҳажмга ўтувчи ҳаво учун ушбу киритиш тешиги кирган, ва трубка иккиламчи киритиш каналида тугайди, ушбу канал орқали ёрдамчи ҳажмга ҳаво оқиб боради.

10. 9-банд бўйича респиратор шу билан фарқланадики, трубканинг киритиш тешиги бирламчи киритиш каналига нисбатан асосий ҳажмнинг қарама-қарши томонида жойлашган, трубканинг чиқариш тешиги асосий ҳажмнинг бирламчи киритиш канали жойлашган томонида жойлашган.

11. 9 ёки 10-бандлар бўйича респиратор шу билан фарқланадики, ушбу иккиламчи фильтр кўрсатилган трубкада ўрнатилган.

12. Юқоридаги бандларнинг ҳар бири бўйича респиратор шу билан фарқланадики, ушбу иккиламчи ҳажм кўшимча равишда нафас чиқариш клапани билан таъминланган бўлиб, унинг воситасида ҳавони ташқарига чиқариш мумкин.

13. Юқоридаги бандларнинг ҳар бири бўйича респиратор шу билан фарқланадики, ёрдамчи ҳажм асосий ҳажмнинг ичида алоҳида мустақил ҳажм ташкил қиладики, у фойдаланувчининг юзига нисбатан асосий ҳажмнинг қаттиқлигидан алоҳида ўзининг хусусий қаттиқликка эга.

1. Респиратор для закрывания по меньшей мере лица пользователя, содержащий смотровое стекло, расположенное так, чтобы дать пользователю возможность видеть, причем указанный респиратор образует внутри основной объем, в который воздух может втягиваться извне через первичный фильтр, и вспомогательный объем, расположенный так, чтобы охватывать нос и рот пользователя, отличающийся с тем, что имеет вспомогательный фильтр, чтобы фильтровать газ, проходящий из основного объема во вспомогательный объем.

2. Респиратор по п. 1, отличающийся с тем, что вспомогательный объем имеет форму ротовой маски, имеющей упругое уплотнение по месту ее контакта с лицом пользователя.

3. Респиратор по пп. 1 или 2, отличающийся с тем, что воздух втягивается в основной объем извне через первичный впускной канал, в котором установлен указанный первичный фильтр.

4. Респиратор по п. 3, отличающийся с тем, что указанный впускной канал дополнительно снабжен однолинейным клапаном, работающим пропуская воздух извне в основной объем, но не в обратном направлении.

5. Респиратор по п. 4, отличающийся с тем, что указанный однолинейный клапан расположен ниже по потоку первичного фильтра.

6. Респиратор по любому из предшествующих пунктов, отличающийся с тем, что дополнительный однолинейный клапан установлен в потоке воздуха от основного объема к вспомогательному объему, причем указанный однолинейный клапан работает на пропускание воздуха из основного объема во вспомогательный объем, но не в обратном направлении.

7. Респиратор по п. 6, отличающийся с тем, что указанный дополнительный однолинейный клапан расположен ниже по потоку вторичного фильтра.

8. Респиратор по любому из предшествующих пунктов, отличающийся с тем, что впускное отверстие для воздуха, пропускаемого из основного объема во вспомогательный объем, расположено с противоположной стороны основного объема относительно указанного первичного впускного канала, так что воздух, проходя из указанного первичного впускного канала в указанное впускное отверстие, проходит по смотровому стеклу.

9. Респиратор по п. 8, отличающийся с тем, что дополнительно содержит трубку, впускное отверстие которой содержит указанное впускное отверстие для воздуха, пропускаемого из основного объема во вспомогательный объем, и которая заканчивается во вторичном впускном канале, через который воздух течет во вспомогательный объем.

10. Респиратор по п. 9, отличающийся с тем, что впускное отверстие трубки расположено с противоположной стороны основного объема относительно первичного впускного канала, а выпускное отверстие трубки расположено с той же стороны основного объема, что и первичный впускной канал.

11. Респиратор по пп. 9 или 10, отличающийся с тем, что указанный вторичный фильтр установлен в указанной трубке.

12. Респиратор по любому из предшествующих пунктов, отличающийся с тем, что указан-

ный вторичный объем дополнительно снабжен клапаном выдоха, посредством которого воздух можно выпускать наружу.

13. Респиратор по любому из предшествующих пунктов, отличающийся тем, что вспомогательный объем составляет отдельный, самостоятельный объем внутри основного объема, имеющий свое собственное уплотнение относительно лица пользователя, отдельное от уплотнения основного объема.

В бўлими

ТУРЛИ ТЕХНОЛОГИК ЖАРАЁНЛАР

Раздел В

РАЗЛИЧНЫЕ ТЕХНОЛОГИЧЕСКИЕ ПРОЦЕССЫ

В 42

(11) IAP 03628

(13) С

(51) 8 В 42 D 15/00

(21) IAP 2004 0450

(22) 23.04.2003

(31)(32)(33) 102 18897.1, 26.04.2002, DE

(71)(73) Гизеке энд Девриент ГмбХ, DE

(72) ХАЙМ, Манфред; ШМИТЦ, Христиан, DE

(85) 26.11.2004

(86) PCT/EP 03/04221, 23.04.2003

(87) WO 03/091042, 06.11.2003

(54) **Химоялаш элементи ва қалбакилаштиришдан химояланган қоғоз**

Защитный элемент и защищенная от подделки бумага

(57) 1. Асосга ва унинг устида жойлашган камида иккита металл қатламга эга қалбакилаштиришдан химояланган қоғоз, банкнот, шахсий гувоҳнома ва шунга ўхшаш ҳужжатлар учун химоя элементи шу билан фарқланади, металл қатлавлари бир-биридан фаркланадиган оптик зичлик кўрсаткичларига эга.

2. 1-банд бўйича химоя элементи шу билан фарқланади, камида иккита металл қатлам асоснинг бир томонида жойлашган.

3. 1 ёки 2-банд бўйича химоя элементи шу билан фарқланади, металл қатлавлари бевоcита бир-бирининг устида жойлашган.

4. 1-3-бандлардан бири бўйича химоя элементи шу билан фарқланади, камида иккита металл қатлавларининг оптик зичлиги камроқ бўлган қатлами асоснинг камида оптик зичлиги кўпроқ бўлган қатлам мавжуд бўлмаган жойларида жойлашган.

5. 1-3-бандлардан бири бўйича химоя элементи шу билан фарқланади, камида иккита металл қатлавларининг оптик зичлиги кўпроқ бўлган қатламида кесимлар мавжуд.

6. 5-банд бўйича химоя элементи шу билан фарқланади, кесимлар ҳарф-рақам белгилар, расмлар, логотиплар ёки бошқа шунга ўхшаш график элементлар шаклиган эга ёки штрих-код кўринишида бажарилган.

7. 1-6-бандлардан бири бўйича химоя элементи шу билан фарқланади, камроқ оптик зичликка эга қатлам яхлит қилиб бажарилган.

8. 1-7-бандлардан бири бўйича химоя элементи шу билан фарқланади, каттароқ оптик зичликка эга қатламининг ёруғлик ўтказиш даражаси максимум 30 %ни, асосан максимум 10 %ни ташкил қилади.

9. 1-8-бандлардан бири бўйича химоя элементи шу билан фарқланади, каттароқ оптик зичликка эга металл қатламининг ёруғлик ўтказиш даражаси максимум 10 %ни, камроқ оптик зичликка эга металл қатламининг ёруғлик ўтказиш даражаси – минимум 50 %ни ташкил қилади.

10. 1-9-бандлардан бири бўйича химоя элементи шу билан фарқланади, металл қатлавлари бир хил материалдан бажарилган.

11. 1-9-бандлардан бири бўйича химоя элементи шу билан фарқланади, металл қатлавлари турли материаллардан бажарилган.

12. 1-11-бандлардан бири бўйича химоя элементи шу билан фарқланади, металл алюминий, кумуш, мис, олтин, темир, хром, никель, кобальт, платина, палладий, титан, инконель, кумуш бронза, олтин бронза ёки ушбу металллар камида иккитасининг эритмасидан иборат бўлиши мумкин.

13. 1-12-бандлардан бири бўйича химоя элементи шу билан фарқланади, камида иккита металл қатлами турлича қалинликка эга.

14. 1-13-бандлардан бири бўйича химоя элементи шу билан фарқланади, битта металл қатлами шаффоф қилиб бажарилган, бошқа металл қатлами ярим шаффоф қилиб бажарилган.

15. 1-14-бандлардан бири бўйича химоя элементи шу билан фарқланади, камида иккита металл қатлавларидаги баъзи кесимлар бир бири билан қўшилган.

16. 1-15-бандлардан бири бўйича химоя элементи шу билан фарқланади, каттароқ оптик зичликка эга қатламининг қалинлиги тахминан 20 дан 300 нмгачани ташкил қилади, камроқ оптик зичликка эга қатламининг қалинлиги тахминан 2 дан 20 нмгачани ташкил қилади.

17. 1-16-бандлардан бири бўйича ҳимоя элементи шу билан ф а р қ л а н а д и к и асос полимер қатламдан иборат.

18. 1-17-бандлардан бири бўйича ҳимоя элементи шу билан ф а р қ л а н а д и к и асос рельеф таркиб кўринишидаги дифракцион таркибга эга.

19. 1-18-бандлардан бири бўйича ҳимоя элементи шу билан ф а р қ л а н а д и к и асос ўз-ўзини ташувчи полимер пленкадан иборат.

20. 1-19-бандлардан бири бўйича ҳимоя элементи шу билан ф а р қ л а н а д и к и асосда таглик устида жойлашган.

21. 1-3-бандлардан бири бўйича ҳимоя элементи шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у ўтказувчи элемент кўринишида бажарилган.

22. 1-3-бандлардан бири бўйича ҳимоя элементи шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у ўз-ўзини ташийдиган этикетка кўринишида бажарилган.

23. 1-22-бандлардан бири бўйича ҳимоя элементи шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у думалоқ, узунчок, юлдузсимон, тўғрибурчак, трапециясимон ёки йўл-йўл контурга эга.

24. 1-3-бандлардан бири бўйича ҳимоя элементи шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у ҳимоя ипи кўринишида бажарилган.

25. 1-3-бандлардан бири бўйича ҳимоя элементи шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у каширлаш учун пленка кўринишида бажарилган.

26. Қимматли хужжатларни тайёрлаш учун қалбакилаштиришдан ҳимояланган қоғоз шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у 1-25-бандларнинг бири бўйича камида битта ҳимоя элементига эга.

27. 26-банд бўйича қалбакилаштиришдан ҳимояланган қоғоз шу билан ф а р қ л а н а д и к и, ҳимоя элементи ушбу қоғозга камида қисман киририлган ёки сингдирилган ҳимоя ипидан иборат.

28. 26-банд бўйича қалбакилаштиришдан ҳимояланган қоғоз шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у икки томони очиқ тешикка эга, бунда ҳимоя элементи ушбу тешик худудидан жойлашган бўлиб, ҳар томондан унинг чегарасидан чиқиб туради.

29. 26-банд бўйича қалбакилаштиришдан ҳимояланган қоғоз шу билан ф а р қ л а н а д и к и, ҳимоя элементи қоғознинг устига суртилган ўтказувчи элементдан ёки қоғознинг устига ётқизилган каширлаш учун пленкадан иборат.

30. 26-29-бандларнинг бири бўйича қалбакилаштиришдан ҳимояланган қоғоз шу билан ф а р қ л а н а д и к и, ҳимоя элементи думалоқ, узунчок, юлдузсимон, тўғрибурчак, трапециясимон ёки йўл-йўл контурга эга.

1. Защитный элемент для защищённых от подделки бумаги, банкнот, удостоверений личности или иных аналогичных документов, имеющий ос-

нову и по меньшей мере два расположенных на ней металлических слоя, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что металлические слои имеют различающиеся между собой показатели оптической плотности.

2. Защитный элемент по п. 1, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что по меньшей мере два металлических слоя расположены с одной и той же стороны основы.

3. Защитный элемент по п. 1 или 2, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что металлические слои расположены непосредственно один над другим.

4. Защитный элемент по одному из пп. 1-3, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что слой с меньшей оптической плотностью из числа по меньшей мере двух металлических слоев расположен по меньшей мере на тех участках основы, на которых слой с большей оптической плотностью отсутствует.

5. Защитный элемент по одному из пп. 1-4, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что по меньшей мере в слое с большей оптической плотностью из числа по меньшей мере двух металлических слоев имеются вырезы.

6. Защитный элемент по п. 5, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что вырезы имеют форму буквенно-цифровых знаков, рисунков, логотипов или иных аналогичных графических элементов либо выполнены в виде штрих-кода.

7. Защитный элемент по одному из пп. 1-6, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что слой с меньшей оптической плотностью выполнен сплошным.

8. Защитный элемент по одному из пп. 1-7, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что степень светопропускания слоя с большей оптической плотностью составляет максимум 30%, предпочтительно максимум 10 %.

9. Защитный элемент по одному из пп. 1-8, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что степень светопропускания металлического слоя с большей оптической плотностью составляет максимум 10 %, а металлического слоя с меньшей оптической плотностью – минимум 50 %.

10. Защитный элемент по одному из пп. 1-9, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что металлические слои выполнены из одного и того же материала.

11. Защитный элемент по одному из пп. 1-9, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что металлические слои выполнены из различных материалов.

12. Защитный элемент по одному из пп. 1-11, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что металл может представлять собой алюминий, серебро, медь, золото, железо, хром, никель, кобальт, платину, палладий, титан, инконель, серебряную бронзу, золотистую бронзу или сплав из по меньшей мере двух указанных металлов.

13. Защитный элемент по одному из пп. 1-12, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что по меньшей мере два металлических слоя имеют различную толщину.
14. Защитный элемент по одному из пп. 1-13, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что один металлический слой выполнен непрозрачным, а другой металлический слой выполнен полупрозрачным.
15. Защитный элемент по одному из пп. 1-14, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что некоторые из вырезов по меньшей мере в двух металлических слоях совмещены друг с другом.
16. Защитный элемент по одному из пп. 1-15, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что толщина слоя с большей оптической плотностью составляет примерно от 20 до 300 нм, а толщина слоя с меньшей оптической плотностью составляет примерно от 2 до 20 нм.
17. Защитный элемент по одному из пп. 1-16, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что основа представляет собой полимерный слой.
18. Защитный элемент по одному из пп. 1-17, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что основа имеет дифракционную структуру в виде рельефной структуры.
19. Защитный элемент по одному из пп. 1-18, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что основа представляет собой самонесущую полимерную пленку.
20. Защитный элемент по одному из пп. 1-19, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что основа расположена на подложке.
21. Защитный элемент по одному из пп. 1-3, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что он выполнен в виде переводного элемента.
22. Защитный элемент по одному из пп. 1-3, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что он выполнен в виде самонесущей этикетки.
23. Защитный элемент по одному из пп. 1-22, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что он имеет круглый, овальный, звездообразный, прямоугольный, трапециевидный или полосовой контур.
24. Защитный элемент по одному из пп. 1-3, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что он выполнен в виде защитной нити.
25. Защитный элемент по одному из пп. 1-3, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что он выполнен в виде пленки для каширования.
26. Защищенная от подделки бумага для изготовления ценных документов, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что она имеет по меньшей мере один защитный элемент по одному из пп. 1-25.
27. Защищенная от подделки бумага по п. 26, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что защитный элемент представляет собой защитную нить, которая по

меньшей мере частично заделана или внедрена в эту бумагу.

28. Защищенная от подделки бумага по п. 26, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что имеет сквозное отверстие, при этом защитный элемент расположен в зоне этого отверстия и со всех сторон выступает за его пределы.

29. Защищенная от подделки бумага по п. 26, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что защитный элемент представляет собой нанесенный на ее поверхность переводной элемент или нанесенную на ее поверхность пленку для каширования.

30. Защищенная от подделки бумага по одному из пп. 26-29, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что защитный элемент имеет круглый, овальный, звездообразный, прямоугольный, трапециевидный или полосовой контур.

В 61

(11) IAP 03629 (13) C

(51) 8 В 61 D 17/04

(21) IAP 2004 0072

(22) 27.02.2004

(71)(73) Ўзбекистон Республикаси Фанлар академияси М.Т.Ўрозбоев номидаги механика ва иншоатлар сейсмик мустаҳкамлиги институти, UZ
А.Икромов номли Тошкент темир йул муҳандислари институти, UZ

Институт механики и сейсмостойкости сооружений им. М.Т.Уразбаева Академии наук Республики Узбекистан, UZ

Ташкентский институт инженеров железнодорожного транспорта им. А. Икрамова, UZ

(72) Хромова Галина Алексеевна, Файзиев Бахтияр Тахирович, Бабаджанов Азамат Адылович, UZ

(54) Транспорт воситасининг кузови учун таглик

Половой настил кузова транспортного средства

(57) 1. Пулатдан ишланган ва орасида амортизацияловчи элемент жойлаштирилган устки ва пастки тўшамалардан таркиб топган, шунинг билан бирга пастки тўшама транспорт воситасининг рамасида жойлашган, ҳамда катма-кат бажарилган транспорт воситаси кузовининг тўшама-си шу билан ф а р қ л а н а д и к и, амортизацияловчи элемент учта демпферловчи эластик катламдан иборат бўлиб, резина ёки металл керамикадан ишланган биринчи қатлам пастки тўшамада жойлаштирилган, транспорт воситасининг бўйлама ўқида жойлаштирилган ҳамда ораларида эластик зичликлар мавжуд бўлган тахта сек-

циялардан иборат иккинчи қатлам резина ёки металл керамика қатлами устига жойлаштирилган, учинчи қатлам эса металл тўрдан бажарилган бўлиб, тахта секциялардан ишланган қатламда жойлаштирилган.

2. 1-банд бўйича тўшамшу билан ф а р қ л а н а д и к и, тахта секциялар орасидаги эластик зичлик хом резинадан ишланган, бунда зичлик раскосининг бурчаги 50 до 60° ни ташкил қилади.

1. Половой настил кузова транспортного средства, выполненный слоистым и содержащий выполненные из стали верхний и нижний настилы, между которыми расположен амортизирующий элемент, причем нижний настил расположен на раме транспортного средства, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что амортизирующий элемент выполнен из трех демпфирующих упругих слоев, при этом один слой, выполненный из резины или металлокерамики, расположен на нижнем настиле, второй слой, выполненный в виде расположенных вдоль продольной оси транспортного средства деревянных секций, между которыми размещены упругие уплотнения, расположен на слое из резины или металлокерамики, а третий слой, выполненный из металлической сетки, расположен на слое из деревянных секций.

2. Настил по п. 1, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что упругое уплотнение между деревянными секциями выполнено из сырой резины, при этом угол раскоса уплотнения составляет от 50 до 60°.

(11) IAP 03630

(13) C

(51) 8 C 07 D 207/00, C 07 D 213/00, C 07 D 401/00, C 07 D 403/00, A 61 K 31/40, A 61 P 7/00

(21) IAP 2004 0193

(22) 14.11.2002

(31)(32)(33) 60/334,168, 29.11.2001; 60/384,895, 31.05.2002, US

(71)(73) Уорнер-Ламберт Компани ЛЛС, US

(72) БИГЖ, Кристофер, Франклин; ДАДЛИ, Данетт, Андреа; ЭДМУНДС, Джереми, Джон; ВАН ХЕЙС, Чэд, Элан; КАСИМИРО-ГАРСИА, Агустин; ФИЛИПСКИ, Кевин, Джеймс; КОРТ, Джеффри, Томас, US

(85) 28.05.2004

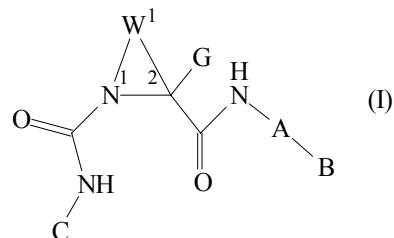
(86) PCT/IB 02/04757, 14.11.2002

(87) WO 03/045912, 05.06.2003

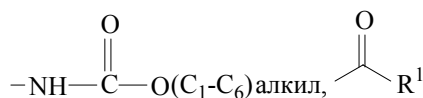
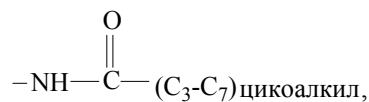
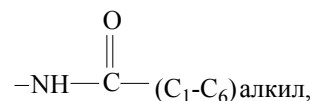
(54) Коагуляцион каскадга боғланган Ха факторининг ва бошқа серинли протеазаларнинг ингибиторлари, уларни олиш усули, улар асосидаги фармацевтик композициялар ҳамда уларни қўллаган ҳолда хасталикларни олдини олиш ва даволаш усули

Ингибиторы фактора Ха и других сериновых протеаз, вовлеченных в коагуляционный каскад, способ их получения, фармацевтическая композиция на их основе и способ профилактики или лечения с их использованием

(57) 1. I формулалари бирикма:



ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи, бунда:
А арил ёки моноциклик гетероарилдан иборат;
В



(C₃-C₇)циклоалкил, (C₃-C₇)гетероцикло, (C₄-C₇)циклоалкенил, тўйинмаган (C₄-C₇)гетероцикло, арил ёки гетероарилдан иборат, бунда уларнинг ҳар бири галоген, (C₁-C₆)алкил ёки галоген-(C₁-C₆)алкил, O-(C₁-C₆), -CN, галогеналкил, амина, алкиламино, амидино, амидо ёки сульфонамидо билан алмашилиши шарт эмас;

C фенил ёки гетероарилдан иборат, бунда фенил ёки гетероарил арил, гетероарил, галоген, гидроксиди, -CO₂R², -COR², -CONR²R^{2'}, алкокси, алкил, -CN, галогеналкил, амина, алкиламино, амидино, амидо ёки сульфонамидодан танланган битта ёки бир нечта ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас;

G H, галоген, (C₁-C₆)алкил, галоген(C₁-C₆)алкил, гидроксиди(C₁-C₆)алкил, -CH₂O-(C₁-C₆)алкил, -CH₂-CO₂(C₁-C₆)алкил, -CH₂-NR²R^{2'} ёки -CH₂-CONH(C₁-C₆)алкилдан иборат;

W¹ тўйинган ёки тўйинмаган, алмашилган ёки алмашилмаган углеводород занжиридан ёки 2-6 атомлардан ташкил топган гетероатомларни ўз ичига олган углеводород занжиридан иборат, бунда W¹ 4-8-аъзоли ҳалқани ҳосил қилиш билан, 1 ҳолатидаги азот атомини 2 ҳолатидаги углерод атоми билан бириктиради;

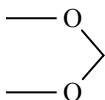
R¹ (C₁-C₆)алкокси, (C₃-C₇)циклоалкил, (C₃-C₇)ге-

гетероциклоалкил, (C₄-C₇)циклоалкенил, (C₄-C₇)гетероциклоалкенил, арил, моноциклический гетероарил ёки -NR³R⁴ дан иборат;

хар бир R² ва R^{2'} мустақил равишда Н ёки (C₁-C₆)алкилдан иборат; ва

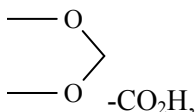
хар бир R³ ва R⁴ мустақил равишда Н, (C₁-C₆)алкил, аралкил, арил, моноциклик гетероарил, алкоксикарбонил, аралкоксикарбонил, -SO₂- алкилдан иборат ёки тўйинган ёки тўйинмаган 3-7-аъзоли ҳалқани ҳосил қилиш билан биргаликда бириктирилган;

алкил куйи алкокси, куйи тиаалкокси, галоген, нитро, циано, оксо, тио, -OH, -SH, -F, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -CO₂H, -CO₂(C₁-C₆)алкил, -NH₂, -NH(C₁-C₆)алкил,



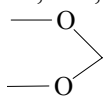
-CONR₈R₉ ёки N(C₁-C₆алкил)₂ дан танланган битта ёки ундан кўп ўринбосарлар билан алмашилмаган ёки алмашилиши шарт бўлмаган, ўз ичига 1 дан 11 гача углерод атомларини олган чизиқли ёки тармоқланган углеводороддан иборат;

арил куйи алкил, куйи алкокси, куйи тиаалкокси, галоген, нитро, циано, -OH, -SH, -F, -CF₃, -OCF₃, -NO₂,



-CO₂(C₁-C₆)алкил, -NH₂, -NH(C₁-C₆)алкил, -CONR⁸R⁹, -SO₂алкил, -SO₂NH₂ ва -N(C₁-C₆алкил)₂ дан танланган, 1 дан 4 гача ўринбосарлар билан алмашилмаган ёки алмашилиши шарт бўлмаган ароматик ҳалқадан иборат;

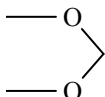
куйи алкил, куйи алкокси, куйи тиаалкокси, галоген, нитро, циано, оксо, тио,



-OH, -SH, -F, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -CO₂H, -CO₂(C₁-C₆)алкил, -NH₂, -NH(C₁-C₆)алкил,

-CONR⁸R⁹ ёки -N(C₁-C₆алкил)₂ дан танланган битта ёки ундан кўп ўринбосарлар билан алмашилиши шарт бўлмаган (C₃-C₇)циклоалкил циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил ва циклогептилдан иборат;

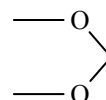
гетероарил куйи алкокси, куйи тиаалкокси, галоген, нитро, циано, оксо, тио, -OH, -SH, -F, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -CO₂H, -CO₂(C₁-C₆)алкил, -NH₂, -NH(C₁-C₆)алкил,



-CONR₈R₉ ёки N(C₁-C₆алкил)₂ дан танланган 1 дан 3 гача ўринбосарлар билан эҳтимол алмашилмаган ёки алмашилган N, O ва Sдан танланган 1 дан 8 гача гетероатомларни ўз ичига олган ароматик циклик ёки полициклик тизимдан иборат;

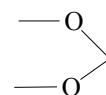
гетероатом кислород, азот ёки олтингурут, сульфоксил ёки сульфонилдан иборат;

гетероцикл ёки гетероцикло таркибида 3 дан 12 гача ҳалқадаги атомлар бўлган тўйинган ёки тўйинмаган моноциклик ҳалқали тизимдан, ёки таркибида амидин, алкилкетон, альдегид, сульфон, сульфоксид ва C₁₋₆алкилдан танланган гуруҳлар билан алмашилиши шарт бўлмаган, ва куйи алкокси, куйи тиаалкокси, галоген, нитро, циано, оксо, тио, -OH, -SH, -F, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -CO₂H, -CO₂(C₁-C₆)алкил, -NH₂, -NH(C₁-C₆)алкил,



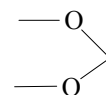
-CONR₈R₉ ёки N(C₁-C₆алкил)₂ дан танланган 1 дан 3 гача ўринбосарлар билан алмашилган N, O ва Sдан танланган 1 дан 4 гача гетероатомларни ўз ичига олган 7 дан 17 гача атомлари бўлган бициклик гетероциклик тизимдан иборат;

углеводородли занжир 2-6 углерод атомларидан тузилган, куйи алкил, куйи алкокси, куйи тиаалкокси, галоген, нитро, циано, оксо, тио, -OH, -SH, -F, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -CO₂H, -CO₂(C₁-C₆)алкил, -NH₂, -NH(C₁-C₆)алкил,



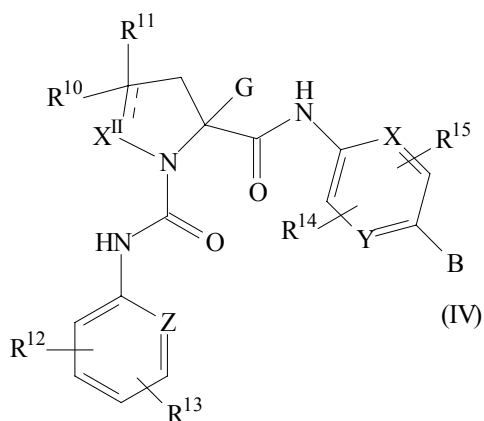
-CONR⁸R⁹ ёки -N(C₁-C₆алкил)₂ дан танланган битта ёки бир нечта ўринбосарлар билан алмашилиши шарт бўлмаган тўғри чизиқли углеводородли занжирга киради; ва

таркибида гетероатомлар бўлган углеводородли занжир куйи алкил, куйи алкокси, куйи тиаалкокси, галоген, нитро, циано, оксо, тио, -OH, -SH, -F, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -CO₂H, -CO₂(C₁-C₆)алкил, -NH₂, -NH(C₁-C₆)алкил,



-CONR⁸R⁹ ёки -N(C₁-C₆алкил)₂ дан танланган битта ёки бир нечта ўринбосарлар билан алмашилиши шарт бўлмаган углеводородли занжирга киради, бунда битта ёки бир нечта углерод атомлари гетероатом билан алмашилган.

2. 1-банд бўйича (IV) формулали бирикма:

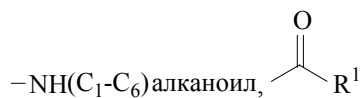
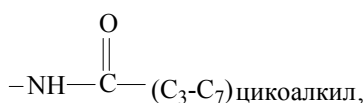
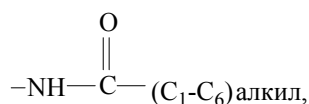


ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи, бунда «---» мавжуд эмас ёки боғланишдан иборат; Z C-Н, C-галоген, C-(C₁-C₆)алкил, C-галоген-(C₁-C₆)алкил, C-(C₁-C₆)алкокси ёки N дан иборат;

X^{II} CH₂, CH, NH ёки Nдан иборат;

хар бир R¹⁰ ва R¹¹ мустақил равишда H, -OH, галоген, алкил, галогеналкил, -NR⁸R⁹, -OR², -CN, -CH₂OH, -CH₂-NR³R⁴, арил, моноциклик гетероарил, алкиларил, -CH=O, -CH₂OR², -COR², -CO₂R² ёки -CONR³R⁴ дан иборат, ёки бирга бирлашиб, =O, =NOR², =C(C₁-C₆алкил)₂ ёки R²Нни ҳосил қиладилар, шу шарт биланки, агар «---» боғланишдан иборат бўлса, унда R¹¹ мавжуд эмас, X^{II} эса, CH ёки Nдан иборат, ва R¹⁰ H, -OH, галоген, алкил, галогеналкил, -NR⁸R⁹, -OR², -CN, -CH₂OH, -CH₂-NR³R⁴, арил, моноциклик гетероарил, алкиларил, -CH=O, -CH₂OR², -COR², -CO₂R² ёки -CONR³R⁴ дан иборат;

B



(C₃-C₇)циклоалкил, (C₃-C₇)гетероциклоалкил, (C₄-C₇)циклоалкенил, (C₄-C₇)гетероциклоалкенил, арил ёки гетероарилдан иборат, бунда R¹ (C₁-C₆)алкокси, (C₃-C₇)циклоалкил, (C₃-C₇)гетероциклоалкил, (C₄-C₇)циклоалкенил, (C₄-C₇)гетероциклоалкенил, арил, моноциклик гетероарил ёки -NR³R⁴ дан иборат;

G H, галоген, (C₁-C₆)алкил, галоген(C₁-C₆)алкил, гидрокси(C₁-C₆)алкил, -CH₂O-(C₁-C₆)алкил, -CH₂-CO₂(C₁-C₆)алкил, -CH₂-CONH₂ ёки H₂-CONH(C₁-C₆)алкилдан иборат;

хар бир R² ва R^{2'} мустақил равишда H ёки (C₁-C₆)алкилдан иборат; ва

R³ ва R⁴ мустақил равишда H, (C₁-C₆)алкил, аралкил, арил, моноциклик гетероарил, алкоксикарбонил, аралкоксикарбонил, -SO₂алкилдан иборат ёки тўйинган ёки тўйинмаган 5-7 аъзоли ҳалқа ҳосил қилиб, бирга бирлаштирилган;

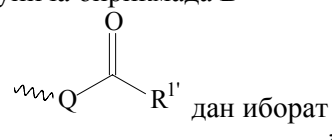
хар бир R¹² ва R¹³ мустақил равишда H, галоген, (C₁-C₆)алкил ёки галоген(C₁-C₆)алкил, ёки (C₁-C₆)алкоксидан иборат;

хар бир R¹⁴ ва R¹⁵ мустақил равишда H, галоген, алкил ёки галогеналкил, ёки NR⁸R⁹ дан иборат, бунда R⁸ ва R⁹ R³ ва R⁴ учун қандай белгиланган бўлса, шундайлар;

хар бир X ва Y Сдан иборат, ёки один из X ва Y ларнинг бири Сдан иборат, бошқаси эса, Nдан иборат, шу шарт биланки, агар X ёки Yларнинг бири Nдан иборат бўлса, унда R¹⁴ ёки R¹⁵ бу ҳолатда мавжуд эмас;

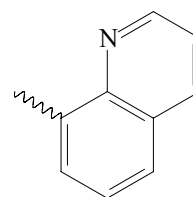
алкил, арил, (C₃-C₇)циклоалкил, гетероарил, гетероатом, гетероцикл ва гетероцикло 1-бандда аниқланган кўрсаткичларга эга.

3. 2-банд бўйича бирикмада B

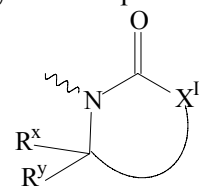


" --- " бирикиш жойини кўрсатади,

Q NHдан иборат; ва бунда R^{1'} -O-(C₁-C₆) ёки NR³R⁴ дан иборат, бунда R^{3'} ва R^{4'} мустақил равишда H, (C₁-C₆)алкилдан иборат, ёки улар алмашилиши шарт бўлмаган тўйинган ёки тўйинмаган 5-7 аъзоли ҳалқани ҳосил қилиб, бирлаштирилган;

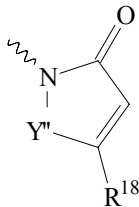


" --- " бирикиш жойини кўрсатади, ёки B алмашилган фенол ёки формил билан пиридил, H₂NSO₂, MeSO₂, MeSO, MeS, (C₁-C₆)алкоксикарбонил, циано, аминометил, метокси ёки гидроксидан иборат бўлиши шарт эмас;



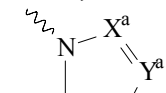
" --- " бирикиш жойини кўрсатади, ва у 4, 5, 6 ёки 7-аъзоли ҳалқа билан алмашилиши шарт эмас; бунда R^x ва R^y H, галоген, (C₁-C₆)алкил, (C₁-C₆)алкокси ёки (C₁-C₆)карбоксиалкилдан иборат;

рат, ёки $O=$ ҳосил қилиб, бирга бирлаштирилган; $X^{III} CH_2$, $CH-OH$, $CH-CO_2(C_1-C_6)$ алкил, O , S , NH ёки $N(C_1-C_6)$ алкилдан иборат, шу шарт биланки, агар бирга бирлаштирилган R^x ва $R^y O=$ ни ҳосил қилсалар, унда $X^{III} CH_2$ дан иборат;

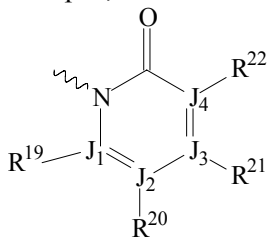


ёки унинг таутомери, бунда $Y^{II} CH_2$, $CH(C_1-C_6)$ алкил ёки N дан иборат, ва $R^{18} H$, (C_1-C_6) алкил, гидроксиметил, $CH_2O-(C_1-C_6)$ алкил, $CONR^2R^{2'}$ ёки $CH_2NR^2R^{2'}$ дан иборат;

таркибида ҳар бири галоген, (C_1-C_6) алкил, гидроксид (C_1-C_6) алкил, $CH_2O-(C_1-C_6)$ алкил ёки галоген (C_1-C_6) алкил билан алмашилиши шарт бўлмаган, ёки



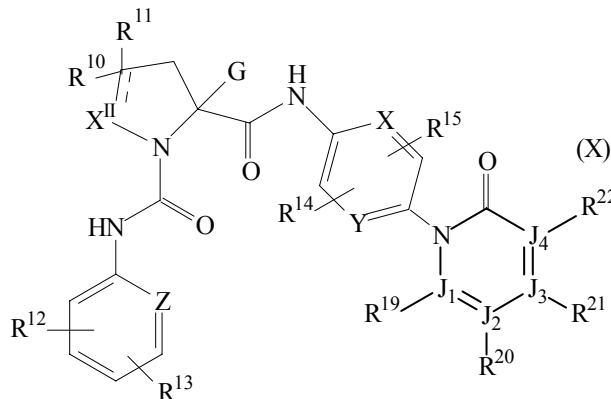
дан иборат имидазолил, пиразолил, триазолил, тетразолил, оксадиазолил, тиadiaзолил, оксазолил, изоксазолил, тиазолил ёки изотиазолилдан танланган камида битта азот атоми бўлган 5-аъзоли гетероарил ҳалқаси, "~~~~" бирикиш жойини кўрсатади; ҳар бир X^a , Y^a ва Z^a мустақил равишда CR^c ёки N дан иборат, бунда $R^c H$ ёки (C_1-C_6) алкилдан иборат; ва $R^{18} H$, (C_1-C_6) алкил, гидроксиметил, $CH_2O-(C_1-C_6)$ алкил ёки NR^3R^4 дан иборат;



"~~~~" бирикиш жойини кўрсатади; ҳар бир J_1 , J_2 , J_3 ва J_4 S дан иборат, ёки ҳар қайси J_1 , J_2 , J_3 ёки J_4 N дан иборат; ва R^{19} , R^{20} , R^{21} ва R^{22} , ҳар бири мустақил равишда H , галоген, гидроксид, NH_2 , $NR^{23}R^{24}$, NO_2 , SH , (C_1-C_6) алкил, галоген (C_1-C_6) алкил, (C_1-C_6) алканоил, (C_1-C_6) алкоксикарбонил ёки (C_1-C_6) алкоксидан иборат, бунда ҳар бир R^{23} ва R^{24} мустақил равишда H , (C_1-C_6) алкил, аралкил, арил, моноциклик гетероарил, алкоксикарбонил, аралкоксикарбонил, $-SO_2$ алкилдан иборат ёки тўйинган ёки тўйинмаган 3-7 аъзоли ҳалқа ҳосил қилиб бирлаштирилган, ёки R^{19} ва R^{20} , R^{20} ва R^{21} , ёки R^{21} ва R^{22} , ўзлари қўшилган углерод атомлари билан бирга 5, 6 ёки 7-аъзоли тўйинган

ёки тўйинмаган циклоалкил ёки гетероциклоалкил ҳалқа, ёки арил ёки гетероарил ҳалқа ҳосил қиладилар; шу шарт биланки, агар ҳар қандай J_1 , J_2 , J_3 ёки J_4 N дан иборат бўлса, унда R^{19} , R^{20} , R^{21} ёки R^{22} , мос равишда, бундай ҳолатда мавжуд эмаслар.

4. X формуласининг бирикмаси



ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи, бунда ---, Z , G , X^{II} , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , X ва Y ларнинг кўрсаткичлари 2-бандда аниқланган; J_1 , J_2 , J_3 ва J_4 C дан иборат ёки J_1 , J_2 , J_3 ва J_4 ларнинг бири N дан иборат; ва ҳар бир R^{19} , R^{20} , R^{21} ва R^{22} мустақил равишда H , галоген, гидроксид, NH_2 , $NR^{23}R^{24}$, NO_2 , SH , (C_1-C_6) алкил, галоген (C_1-C_6) алкил, (C_1-C_6) алканоил, (C_1-C_6) алкоксикарбонил ёки (C_1-C_6) алкоксидан иборат, бунда ҳар бир R^{23} ва R^{24} мустақил равишда H , (C_1-C_6) алкил, аралкил, арил, моноциклик гетероарил, алкоксикарбонил, аралкоксикарбонил, $-SO_2$ алкилдан иборат, ёки R^{23} ва R^{24} 3-7- аъзоли тўйинган ёки тўйинмаган ҳалқа ҳосил қилиб бирлаштирилган, ёки R^{19} ва R^{20} , R^{20} ва R^{21} , ёки R^{21} ва R^{22} , ўзлари қўшилган углерод атомлари билан бирга 5, 6 ёки 7- аъзоли тўйинган ёки тўйинмаган циклоалкил ёки гетероциклик ҳалқа, ёки арил ёки гетероарил ҳалқа ҳосил қиладилар; шу шарт биланки, қачонки ҳар қайси J_1 , J_2 , J_3 ёки J_4 N дан иборат бўлса, унда R^{19} , R^{20} , R^{21} ёки R^{22} бундай ҳолатда мавжуд эмаслар;

алкил, арил, (C_3-C_7) циклоалкил, гетероарил, гетероатом, гетероцикл ва гетероцикло 1-бандда аниқланган кўрсаткичларга эга.

5. 4-банд бўйича 1-[(4-хлор-фенил)-амид]2-[[2-фторо-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-фенил]-амид] (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2-дикарбон кислотасидан иборат бирикма.

6. 4-банд бўйича 1-[(4-хлор-фенил)-амид]5-[[2-фторо-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-фенил]-амид] 5-метил-4,5-дигидро-пиразол-1,5-дикарбон кислотасидан иборат бирикма.

7. 1, 2 ёки 3-бандлар бўйича қуйидагидан иборат бирикма:

ролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-пропокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-пропокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксоазетидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксоазетидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопирролидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксоазепан-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксоазепан-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-этоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-гидрокси-метил-5-оксопирролидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(2,3-диметил-5-оксо-2,5-дигидропиразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-гидрокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(2-гидрокси-метил-пирролидин-1-ил)фенил]амид} 4-гидрокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- [(4-пирролидин-1-ил-фенил)амид] (2R,4R)-4-гидрокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- [(4-пиразол-1-ил-фенил)амид] (2R,4R)-4-гидрокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- [(2-фтор-4-пиразол-1-ил-фенил)амид] (2R,4R)-4-гидрокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- [(4-[1,2,4]триазол-1-ил-фенил)амид] (2R,4R)-4-гидрокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- [(4-[1,2,3]триазол-2-ил-фенил)амид] (2R,4R)-4-гидрокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- [(4-[1,2,3]триазол-1-ил-фенил)амид] (2R,4R)-4-гидрокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2-[(4-ацетиламинофенил)амид] 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-гидрокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(циклопентанкарбониламино)фенил]амид} (2R,4R)-4-гидрокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси; ва
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- [(4-пиримидин-5-ил-фенил)амид] 4-гидрокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси; ёки
 унинг фармацевтик мувофиқ тузи.
 10. 1, 2 ёки 3-бандлар бўйича куйидагилардан иборат бирикма:
 1-(4-хлорфенилкарбамоил)-5-[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенилкарбамоил]пирролидин-3-карбон кислотаси;
 метил эфири 1-(4-хлорфенилкарбамоил)-5-[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенилкарбамоил]-пирролидин-3-карбон кислотаси;
 этил эфири 1-(4-хлорфенилкарбамоил)-5-[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенилкарбамоил]пирролидин-3-карбон кислотаси;
 4-амид 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} пирролидин-1,2,4-трикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} 4-циано-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} 4-(1Н-тетразол-5-ил)-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} 4-аминометил-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} 4-метиламино-метил-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} 4-диметиламино-метил-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} 4-ацетил-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} 4-метиламид-пирролидин-1,2,4-трикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 4-диметиламид 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} пир-

дин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-[(3-фтор-2'-метансульфонилбифенил-4-ил)амид] (2R,4S)-4-метокси-
 пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-[(3-фтор-2'-метансульфонилбифенил-4-ил)амид] (2R,4R)-4-фторпирро-
 лидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-[(3-фтор-2'-метансульфонилбифенил-4-ил)амид] (2R)-4,4-дифторпир-
 ролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2-[(3-фтор-2'-метансульфонилбифенил-4-ил)а-
 мид] 1-[(4-фторфенил)амид] (2R,4R)-4-метокси-
 пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-[(3-фтор-2'-метансульфонилбифенил-4-ил)амид] (2R,4R)-4-ацетилами-
 нопирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-[(3-фтор-2'-метансульфонилбифенил-4-ил)амид] (2R,4R)-4-метансуль-
 фониламинопирролидин-1,2- дикарбон кисло-
 таси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопипе-
 ридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4S)-4-(1H-тетразол-
 5-ил)-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопи-
 перидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4S)-4-метокси-
 пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопи-
 перидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-цианопир-
 ролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопи-
 перидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-(1H-тетра-
 зол-5-ил)-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопи-
 перидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-трифтор-
 метилпирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-[(2'-циано-3-фторбифе-
 нил-4-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-
 1,2- дикарбон кислотаси;
 2-[(2'-аминаметил-3-фторбифенил-4-ил)амид] 1-
 [(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирроли-
 дин-1,2- дикарбон кислотаси;
 метил эфири (2R,4R)-4'- {[1-(4-хлорфенилкарба-
 моил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]амино}-
 3'-фторбифенил-2-карбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(2,5-дигидропиррол-
 1-карбонил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипир-
 ролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-[(4-диметилкарбамоил-
 2-фторфенил)амид] (2R,4R)-4-гидроксипирроли-
 дин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(пирролидин-1-кар-
 бонил)фенил]амид} (2R,4R)-4-гидроксипирроли-
 дин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(пирролидин-1-кар-
 бонил)фенил]амид} пирролидин-1,2- дикарбон

кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(2-метилпирроли-
 дин-1-карбонил)фенил]амид} (2R,4R)-4-гидрок-
 сипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(этилметилкарба-
 моил)фенил]амид} (2R,4R)-4-гидроксипирроли-
 дин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-[(4-диметилкарбамоил-
 фенил)амид] (2R,4R)-4-гидроксипирролидин-1,2-
 дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(2R-метилпирроли-
 дин-1-карбонил)фенил]амид} (2R,4R)-4-гидрок-
 сипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(2S-метилпирроли-
 дин-1-карбонил)фенил]амид} (2R,4R)-4-гидрок-
 сипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(пирроли-
 дин-1-карбонил)фенил]амид} (2R,4R)-4-гидрок-
 сипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(пирролидин-1-кар-
 бонил)-2-пирролидин-1-ил-фенил]амид} (2R,4R)-
 4-гидроксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 метил эфири (2R,4R)-4- {[1-(4-хлорфенилкарбамо-
 ил)-4-гидроксипирролидин-2-карбонил]амино}-
 3-пирролидин-1-илбензой кислотаси;
 2- {[4-(азетидин-1-карбонил)фенил]амид} 1-[(4-
 хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-гидроксипирроли-
 дин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[2-фтор-4-(пир-
 ролидин-1-карбонил)фенил]амид} (2R,4R)-4-гид-
 роксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[4-(пирроли-
 дин-1-карбонил)фенил]амид} (2R,4R)-4-гидрок-
 сипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-[(4-диметилкар-
 бамоил-фенил)амид] (2R,4R)-4-гидроксипирро-
 лидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 метил эфири (2R,4R)-4- {[1-(4-хлорфенилкарба-
 моил)-4-гидроксипирролидин-2-карбонил]ами-
 но}-3-диметиламинобензой кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(пирролидин-1-кар-
 бонил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирроли-
 дин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-[(4-диметилкарбамоил-
 фенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-
 дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(пирролидин-1-кар-
 бонил)фенил]амид} (2R,4R)-4-этоксипирроли-
 дин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-[(4-диметилкарбамоил-
 фенил)амид] (2R,4R)-4-этоксипирролидин-1,2-
 дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(пирроли-
 дин-1-карбонил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-
 пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-изопропил-5,5-диметил-2-оксоимидазолидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-метил-2-оксоимидазолидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[4-(5,5-диметил-2-оксоимидазолидин-1-ил)-2-фторфенил]-амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[4-(3,4-диметил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

2- {[4-(4-хлор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

унинг фармацевтик мувофик тузи.

12. 1, 2 ёки 3-бандлар бўйича куйидагилардан иборат бирикма:

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-хинолин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-оксо-3Н-изохинолин-2-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(1-оксо-1Н-изохинолин-2-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-оксо-5Н-[1,2,4]триазин-4-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(6-оксо-6Н-пиримидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиразин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиримидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-[1,3,5]триазин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- [(6-метил-2-оксо-2Н-[1,3']бипиридинил-6'-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(1-метил-1Н-имидазол-2-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(1-метил-

1Н-пиррол-2-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

5-[(4-хлорфенил)амид] 6- {[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-5-азаспиро-[2,4]гептан-5,6- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-карбонил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-метил-3Н-имидазол-4-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-метил-2Н-пиразол-3-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[5-(2,5-дигидропиррол-1-карбонил)-пиридин-2-ил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-метил-5-оксо-2,5-дигидропиразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-метоксиметил-3-метилпиразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-метоксиметил-5-метилпиразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-этил-3-метилпиразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-изобутил-3-метилпиразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-изопропилпиразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-этилпиразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-изобутилпиразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

метил эфири (2R,4R)-2-(4- {[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-2Н-пиразол-3-карбон кислотаси;

(2R,4R)-2-(4- {[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-2Н-пиразол-3-карбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-метоксиметилпиразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

этил эфири (2R,4R)-5-(4- {[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-2Н-пиразол-3-карбон кислотаси;

соазетидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(7-оксо-7Н-тиено[2,3-с]пиридин-6-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-1-азаспиро[4,5]дец-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2-{[4-(3-бензоил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2-{[4-(3-ацетилсульфамоил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксотиазолидин-3-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(3-метил-2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-3-сульфамоил-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(2,5-диоксо-2,5-дигидропиррол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2-{[4-(3-амино-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-3-фенокси-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(2,2-диметил-5-оксопирролидин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 трет-бутил эфири (2R,4R)-1-(4-{[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]-амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(2,5-диоксопирролидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2-{[4-(3-бензотиазол-2-ил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2-{[4-(3-амино-4,6-диметил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(3-диэтиламинометил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-торфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2-{[4-(3-аминометил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(3-метил-5-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-(4-{[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-ил эфири (2R,4R)-уксус кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(3-(циклопентанкарбониламино)-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2-{[4-(5-амино-3-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-[2-оксо-3-(пиридин-4-илкарбамоил)-2Н-пиридин-1-ил]фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(3,5-дихлор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2-{[4-(3-амино-5-бром-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(3-циано-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(3-циано-2-оксо-5-фенил-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(3-этил-6-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(3-циано-4-диметиламино-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(4-метил-3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(5-нитро-2-оксо-3-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)фенил]-

нил]амино}-3-фторфенил)-6-оксо-1,6-дигидропиридин-2-карбон кислотаси;
 (2R,4R)-[1-(4-{[1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]амино}-фенил)-2,5-диоксоимидазолидин-4-ил]уксус кислотаси
 метил эфири(2R,4R)-1-(4-{[1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-3-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[2-фтор-4-(4-гидрокси-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 (2R,4R)-1-(4-{[1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-6-оксо-1,6-дигидропиридин-2-карбон кислотаси
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-5-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[4-(6-циклопропил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 этил эфири(2R,4R)-1-(4-{[1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-6-оксо-1,6-дигидропиридин-3-карбон кислотаси
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[2-фтор-4-(3-гидрокси-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[4-(3,3-диметил-2-оксоазетидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[2-фтор-4-(7-оксо-7Н-тиено[2,3-с]пиридин-6-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид]2-{[2-фтор-4-(2-оксо-1-азаспиро[4,5]дец-1-ил)фенил]амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2-{[4-(3-бензоил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-метил-5-оксопирролидин-1-ил)фенил]амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-метил-6-оксопирролидин-1-ил)фенил]амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2-{[4-(3-ацетилсульфамоил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксотиазолидин-3-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[2-фтор-4-(3-метил-2-оксопирролидин-1-ил)фенил]амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-3-сульфамоил-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[4-(2,5-диоксо-2,5-дигидропиррол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2-{[4-(3-амино-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-3-фенокси-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[4-(2,2-диметил-5-оксопирролидин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[2-фтор-4-(3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 трет-бутил эфир (2R,4R)-1-(4-{[1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбон кислотаси
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[4-(2,5-диоксопирролидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси
 2-{[4-(3-бензотиазол-2-ил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2-{[4-(3-амино-4,6-диметил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[4-(3-диэтиламинметил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

карбон кислотаси;
2-{{4-(3-аминометил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)-амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(3-метил-5-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}-амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой дикарбон кислотаси;
1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-ил эфири 2R, 4R)-уксус кислотаси;
1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{4-[3-(циклопентанкарбониламино)-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил]-2-фторфенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
2-{{4-(5-амино-3-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)-амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-[2-оксо-3-(пиридин-4-илкарбамоил)-2Н-пиридин-1-ил]фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{4-(3,5-дихлор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
2-{{4-(3-амино-5-бром-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)-амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{4-(3-циано-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{4-(3-циано-2-оксо-5-фенил-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}-амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{4-(3-этил-6-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}-амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{4-(3-циано-4-диметиламино-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(4-метил-3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}-амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(5-нитро-2-оксо-3-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)-фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-

дикарбон кислотаси;
2-{{4-(5-амино-6-оксо-6Н-[3,4']бипиридинил-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)-амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
2-{{4-(5-хлор-3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)-амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
2-{{4-(3-карбамоил-2-оксо-5-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
изобутил эфир (2R,4R)-5-бром-1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбон кислотаси;
2-{{4-(3-хлор-2-оксо-5-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
2-{{4-(3-бром-5-хлор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)-амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
2-{{4-(5-бром-3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)-амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(3-нитро-2-оксо-5-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)-фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(5-метил-3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}-амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
метил эфир (2R,4R)-5-хлор-1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбон кислотаси;
(2R,4R)-5-хлор-1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}-амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбон кислотаси;
2-{{4-(4-бензилокси-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
2-{{4-(4-амино-5-фтор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)-амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(5-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кисло-

сипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид]2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-2-этил-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} 4-метокси-2-метоксиметилпирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} 2-гидроксиметил-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 метил эфир {1-(4-хлорфенилкарбамоил)-2-[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенилкарбамоил]-4-метоксипирролидин-2-ил}-уксус кислотаси;
 {1-(4-хлорфенилкарбамоил)-2-[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенилкарбамоил]-4-метоксипирролидин-2-ил}уксус кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} 4-гидроксиметилпирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 {1-(4-хлорфенилкарбамоил)-5-[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенилкарбамоил]пирролидин-3-ил}уксус кислотаси;
 метил эфир {1-(4-хлорфенилкарбамоил)-5-[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенилкарбамоил]пирролидин-3-ил}уксус кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-этилпирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-изопропилпирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-фтор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-фтор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2- {[4-(3-хлор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2- {[4-(3-хлор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2- {[4-(3-бром-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2- {[4-(3-бром-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-йод-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-йод-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[4-(3-этил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси; ва
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(3-этил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 унинг фармацевтик мувофик тузи.

13. 1, 2 ёки 3-бандлар бўйича қуйидагидан иборат бирикма:

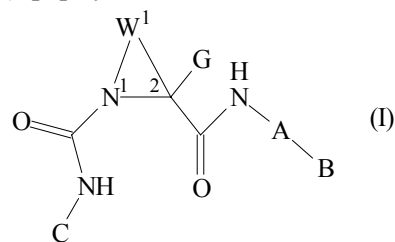
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-этоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- [(2-оксо-2Н-[1,3']бипиридинил-6'-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-метокси-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(3-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-метилимидазол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- [(4-диметилкарбамоил-2-фторфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-метилпирразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 5-[(3-фтор-2'-сульфамилбифенил-4-ил)амид] (2R,4R) 4,5-дигидропирразол-1,5- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- [(2-фтор-4-пирразол-1-ил-фенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(пирролидин-1-карбонил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(3-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-метил-имидазол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- [(2-оксо-2Н-[1,3']бипиридинил-6'-ил)амид] (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-этоксипирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- [(4-диметилкарбамоил-2-фторфенил)амид] (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-метилпиразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 5- [(3-фтор-2'-сульфамил-бифенил-4-ил)амид] 5-метил-4,5-дигидропиразол-1,5- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(4-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 2- {[2-хлор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-метил-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(6-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2- {[2-фтор-4-(4-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;

таси;

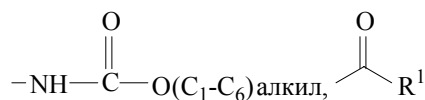
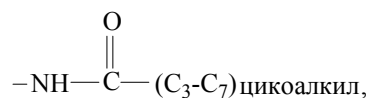
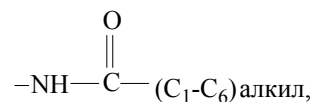
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(2,5-дигидропиррол-1-карбонил)-2-фторфенилаид]} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(2,5-дигидропиррол-1-карбонил)фенилаид]} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(2-метил-5-оксо-пирролидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(2,5-дигидропиррол-1-карбонил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(4-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(2,5-дигидропиррол-1-карбонил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2- дикарбон кислотаси;
 ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи.

14. Ўткир, ўткир ости ва сурункали тромбоз хасталигини олдини олиш ёки даволаш учун, таркибида (I) формулани



бирикманинг терапевтик самарали миқдори ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи бўлган фармацевтик композиция, бунда:

А арил ёки моноциклик гетероарилдан иборат;
 В, ҳар бири галоген, (C₁-C₆)алкил ёки галоген-(C₁-C₆)алкил, О-(C₁-C₆), -CN, галогеналкил, амина, алкиламино, амидино, амидо ёки сульфонамидо билан эҳтимол алмашилиши шарт бўлмаган,



(C₃-C₇)циклоалкил, (C₃-C₇)гетероцикло, (C₄-C₇)циклоалкенил, тўйинмаган (C₄-C₇)гетероцикло, арил ёки гетероарилдан иборат;

С фенил ёки гетероарилдан иборат, бунда фенил ёки гетероарил арил, гетероарил, галоген, гид-

рокси, $-\text{CO}_2\text{R}^2$, $-\text{COR}^2$, $-\text{CONR}^2\text{R}^{2'}$, алкокси, алкил, $-\text{CN}$, галогеналкил, amino, алкиламино, амидино, амидо ёки сульфонамидодан танланган битта ёки бир нечта ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас;

G H, галоген, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкил, галоген $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкил, гидрокси $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкил, $-\text{CH}_2\text{O}(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкил, $-\text{CH}_2\text{CO}_2(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкил, $-\text{CH}_2\text{NR}^2\text{R}^{2'}$ ёки $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкилдан иборат;

W^1 тўйинган ёки тўйинмаган, алмашилган ёки алмашилмаган углеводородли занжирдан ёки 2-6 атомлардан ташкил топган гетероатомларни ўз ичига олган углеводородли занжирдан иборат, бунда W^1 4-8-аъзоли ҳалқани ҳосил қилиш билан бирга 1 ҳолатидаги азот атомини 2 ҳолатдаги углерод атоми билан бирлаштиради;

R^1 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкокси, $(\text{C}_3\text{-C}_7)$ циклоалкил, $(\text{C}_3\text{-C}_7)$ гетероциклоалкил, $(\text{C}_4\text{-C}_7)$ циклоалкенил, $(\text{C}_4\text{-C}_7)$ гетероциклоалкенил, арил, моноциклик гетероарил ёки $-\text{NR}^3\text{R}^4$ дан иборат;

ҳар бир R^2 ва $\text{R}^{2'}$ мустақил равишда H ёки $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкилдан иборат; ва

ҳар бир R^3 ва R^4 мустақил равишда H, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкил, аралкил, арил, моноциклик гетероарил, алкоксикарбонил, аралкоксикарбонил, $-\text{SO}_2$ -алкилдан иборат ёки тўйинмаган 3-7-аъзоли ҳалқа ҳосил қилиб, бирга қўшилган;

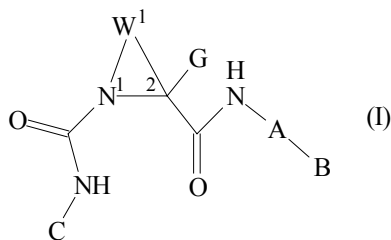
алкил, арил, $(\text{C}_3\text{-C}_7)$ циклоалкил, гетероарил, гетероатом, гетероцикл, гетероцикло, углеводородли занжир ва ўз ичига гетероатомларни олган углеводородли занжир 1-бандда аниқланган кўрсаткичларга эга;

ташувчи, суюлтирувчи ёки эксципиент билан аралашмада.

15. 1-банд бўйича бирикманнинг терапевтик самарали миқдорини шунга зарурат туғилганда сут эмизувчига киритишни ўз ичига олган ўткир, ўткир ости ва сурункали тромбоз хасталигини олдини олиш ёки даволаш усули.

16. 15-банд бўйича усулда ўткир, ўткир ости ва сурункали хасталик вена тромбози, артериялар тромбози, ўпка эмболияси, инфаркт миокарди, мия инфаркти, рестеноз, саратон, стенокардия, диабет, юрак фибрилляцияси ёки юрак хасталигидан иборат.

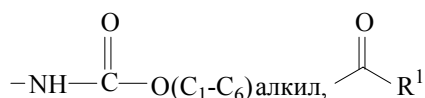
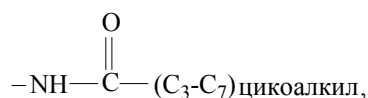
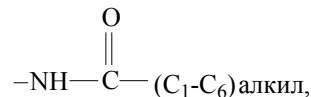
17. I формулани бирикма



ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузини олиш усули, бунда:

A арил ёки моноциклик гетероарилдан иборат;

B ҳар бири галоген, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкил ёки галоген $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкил, $\text{O}(\text{C}_1\text{-C}_6)$, $-\text{CN}$, галогеналкил, amino, алкиламино, амидино, амидо ёки сульфонамидо билан алмашилиши шарт бўлмаган



$(\text{C}_3\text{-C}_7)$ циклоалкил, $(\text{C}_3\text{-C}_7)$ гетероцикло, $(\text{C}_4\text{-C}_7)$ циклоалкенил, тўйинмаган $(\text{C}_4\text{-C}_7)$ гетероцикло, арил ёки гетероарилдан иборат;

C фенил ёки гетероарилдан иборат, бунда фенил ёки гетероарил арил, гетероарил, галоген, гидрокси, $-\text{CO}_2\text{R}^2$, $-\text{COR}^2$, $-\text{CONR}^2\text{R}^{2'}$, алкокси, алкил, $-\text{CN}$, галогеналкил, amino, алкиламино, амидино, амидо ёки сульфонамидодан танланган битта ёки бир нечта ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас;

G H, галоген, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкил, галоген $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкил, гидрокси $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкил, $-\text{CH}_2\text{O}(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкил, $-\text{CH}_2\text{CO}_2(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкил, $-\text{CH}_2\text{NR}^2\text{R}^{2'}$ ёки $-\text{CH}_2\text{CONH}(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкилдан иборат;

W^1 тўйинган ёки тўйинмаган, алмашилган ёки алмашилмаган углеводородли занжирдан ёки 2-6 атомлардан ташкил топган гетероатомларни ўз ичига олган углеводородли занжирдан иборат, бунда W^1 4-8-аъзоли ҳалқани ҳосил қилиш билан бирга 1 ҳолатидаги азот атомини 2 ҳолатдаги углерод атоми билан бирлаштиради;

R^1 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкокси, $(\text{C}_3\text{-C}_7)$ циклоалкил, $(\text{C}_3\text{-C}_7)$ гетероциклоалкил, $(\text{C}_4\text{-C}_7)$ циклоалкенил, арил, моноциклик гетероарил ёки $-\text{NR}^3\text{R}^4$ дан иборат;

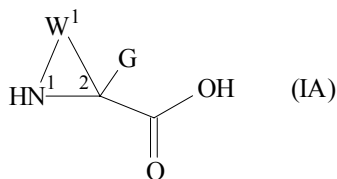
ҳар бир R^2 ва $\text{R}^{2'}$ мустақил равишда H ёки $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкилдан иборат; ва

ҳар бир R^3 ва R^4 мустақил равишда H, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ алкил, аралкил, арил, моноциклик гетероарил, алкоксикарбонил, аралкоксикарбонил, $-\text{SO}_2$ -алкилдан иборат ёки улар тўйинган ёки тўйинмаган 3-7-аъзоли ҳалқа ҳосил қилиб, бирга қўшилган;

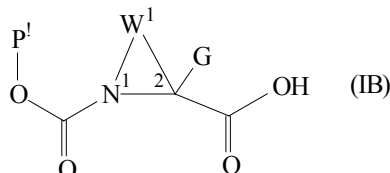
алкил, арил, $(\text{C}_3\text{-C}_7)$ циклоалкил, гетероарил, гетероатом, гетероцикл, гетероцикло, углеводородли занжир ва ўз ичига гетероатомларни олган углеводородли занжир 1-бандда аниқланган кўрсаткичларга эга;

усул ўз ичига қуйидагиларни олган:

(a) IA формула аминокислотасининг



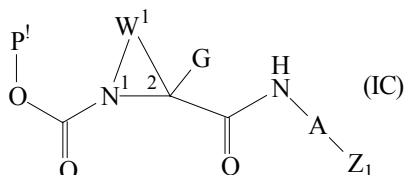
P¹ химоя гуруҳини аминокислота аминогуруҳига алмашилган аминокислота ҳосил қилиш билан бирга бириктириш қобилиятига эга реагент билан ўзаро таъсири, IB формулани олиш билан бирга:



P¹ химоя гуруҳидн иборат, ва W¹ юқорида аниқлангандек;

(b) IB формулани бирикманинг кислотали гуруҳини галогенангидридга айлантириш;

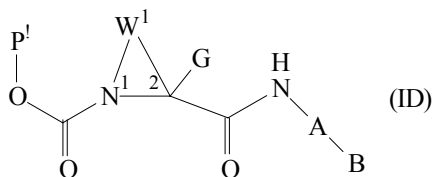
(c) IC формулани бирикма ҳосил қилиб,



галогенангидриднинг галогенанилин ёки галогенамино-гетероцикл билан ўзаро таъсири.

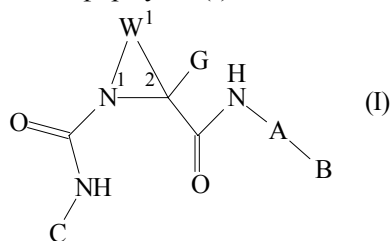
Z₁ галогендан иборат, ва A юқорида аниқлангандек;

(d) ID формулани бирикма ҳосил қилиб, IC формулани бирикманинг H-B бирикма билан ўзаро таъсири



(e) удаление защитной группы соединения ID бирикма химоя гуруҳини кеткизиш ва ушбу ихтиро бўйича бирикмани ҳосил қилиб, олинган кислотали гуруҳнинг C-изоцианат билан ўзаро таъсири.

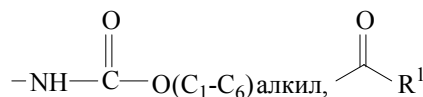
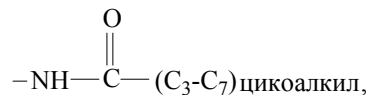
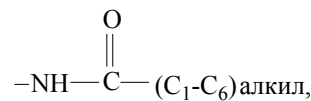
1. Соединение формулы (I)



или его фармацевтически приемлемая соль, где: A представляет собой арил или моноцикличес-

кий гетероарил;

В представляет собой



(C₃-C₇)циклоалкил, (C₃-C₇)гетероцикло, (C₄-C₇)циклоалкенил, ненасыщенный (C₄-C₇)гетероцикло, арил или гетероарил, где каждый может быть необязательно замещен галогеном, (C₁-C₆)алкилом или галоген(C₁-C₆)алкилом, O-(C₁-C₆), -CN, галогеналкилом, амина, алкиламино, амидино, амидо или сульфонамидо;

C представляет собой фенил или гетероарил, где фенил или гетероарил необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из арила, гетероарила, галогена, гидрокси, -CO₂R², -COR², -CONR²R^{2'}, алкокси, алкила, -CN, галогеналкила, амина, алкиламино, амидино, амидо или сульфонамидо;

G представляет собой H, галоген, (C₁-C₆)алкил, галоген(C₁-C₆)алкил, гидрокси(C₁-C₆)алкил, -CH₂O-(C₁-C₆)алкил, -CH₂-CO₂(C₁-C₆)алкил, -CH₂-NR²R^{2'} или -CH₂-CONH(C₁-C₆)алкил;

W¹ представляет собой насыщенную или ненасыщенную, замещенную или незамещенную углеводородную цепь или углеводородную цепь, содержащую гетероатомы, состоящую из 2-6 атомов, где W¹ соединяет атом азота в положении 1 с атомом углерода в положении 2 с образованием 4-8-членного кольца;

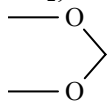
R¹ представляет собой (C₁-C₆)алкокси, (C₃-C₇)циклоалкил, (C₃-C₇)гетероциклоалкил, (C₄-C₇)циклоалкенил, (C₄-C₇)гетероциклоалкенил, арил, моноциклический гетероарил или -NR³R⁴;

каждый R² и R^{2'} независимо представляет собой H или (C₁-C₆)алкил и

каждый R³ и R⁴ независимо представляет собой H, (C₁-C₆)алкил, аралкил, арил, моноциклический гетероарил, алкоксикарбонил, аралкоксикарбонил, -SO₂-алкил или объединены вместе с образованием насыщенного или ненасыщенного 3-7-членного кольца;

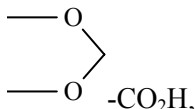
алкил представляет собой линейный или разветвленный углеводород, содержащий от 1 до 11 атомов углерода, незамещенный или необязательно замещенный одним или более заместителями, выбранными из низшего алкокси, низ-

шего тиоалкокси, галогена, нитро, циано, оксо, тио, -OH, -SH, -F, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -CO₂H, -CO₂(C₁-C₆)алкила, -NH₂, -NH(C₁-C₆)алкила,



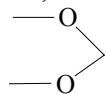
-CONR₈R₉ или N(C₁-C₆алкил)₂;

арил представляет собой ароматическое кольцо, незамещенное или необязательно замещенное от 1 до 4 заместителями, выбранными из низшего алкила, низшего алкокси, низшего тиоалкокси, галогена, нитро, циано, -OH, -SH, -F, -CF₃, -OCF₃, -NO₂,



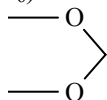
-CO₂(C₁-C₆)алкила, -NH₂, -NH(C₁-C₆)алкила, -CONR⁸R⁹, -SO₂алкила, -SO₂NH₂ и -N(C₁-C₆алкил)₂;

(C₃-C₇)циклоалкил представляет собой циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил и циклогептил, который может быть необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из низшего алкила, низшего алкокси, низшего тиоалкокси, галогена, нитро, циано, оксо, тио,



-OH, -SH, -F, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -CO₂H, -CO₂(C₁-C₆)алкил, -NH₂, -NH(C₁-C₆)алкил, -CONR⁸R⁹ или -N(C₁-C₆алкил)₂;

гетероарил представляет собой ароматическую циклическую или полициклическую систему, содержащую от 1 до 8 гетероатомов, выбранных из N, O и S, которые могут быть незамещенными или замещенными от 1 до 3 заместителями, выбранными из низшего алкокси, низшего тиоалкокси, галогена, нитро, циано, оксо, тио, -OH, -SH, -F, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -CO₂H, -CO₂(C₁-C₆)алкила, -NH₂, -NH(C₁-C₆)алкила,

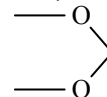


-CONR₈R₉ или N(C₁-C₆алкил)₂;

гетероатом представляет собой кислород, азот или серу, сульфоксил или сульфонил;

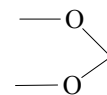
гетероцикл или гетероцикло представляет собой насыщенную или ненасыщенную моноциклическую кольцевую систему, содержащую от 3 до 12 атомов в кольце, или бициклическую гетероциклическую систему, содержащую от 7 до 17 ато-

мов в кольце, которые содержат от одного до четырех гетероатомов, выбранных из N, O и S, и которые необязательно замещены группами, выбранными из амидина, алкилкетона, альдегида, сульфона, сульфоксида и C₁₋₆алкила, и которые замещены заместителями от 1 до 3, выбранными из низшего алкокси, низшего тиоалкокси, галогена, нитро, циано, оксо, тио, -OH, -SH, -F, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -CO₂H, -CO₂(C₁-C₆)алкил, -NH₂, -NH(C₁-C₆)алкила,



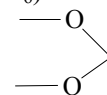
-CONR₈R₉ или N(C₁-C₆алкил)₂;

углеводородная цепь относится к прямой углеводородной цепи из 2-6 атомов углерода, которая необязательно замещена одним или несколькими заместителями, выбранными из низшего алкила, низшего алкокси, низшего тиоалкокси, галогена, нитро, циано, оксо, тио, -OH, -SH, -F, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -CO₂H, -CO₂(C₁-C₆)алкила, -NH₂, -NH(C₁-C₆)алкила,



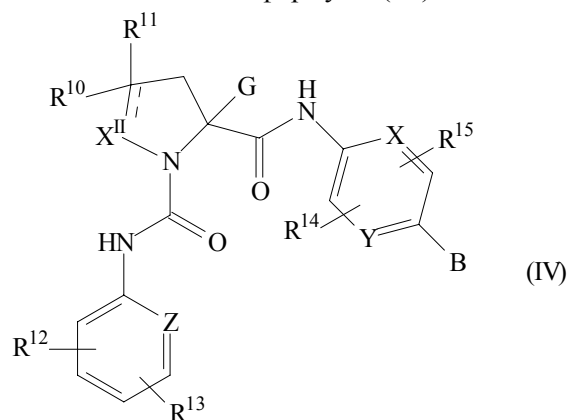
-CONR⁸R⁹ или -N(C₁-C₆алкил)₂; и

углеводородная цепь, содержащая гетероатомы относится к углеводородной цепи, где один или несколько атомов углерода замещены на гетероатом, которая необязательно замещена одним или несколькими заместителями, выбранными из низшего алкила, низшего алкокси, низшего тиоалкокси, галогена, нитро, циано, оксо, тио, -OH, -SH, -F, -CF₃, -OCF₃, -NO₂, -CO₂H, -CO₂(C₁-C₆)алкила, -NH₂, -NH(C₁-C₆)алкила,



-CONR⁸R⁹ или -N(C₁-C₆алкил)₂.

2. Соединение по п. 1 формулы (IV)

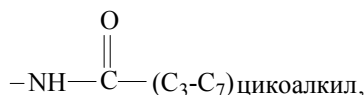
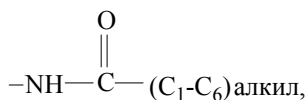


или его фармацевтически приемлемая соль, где «---» отсутствует или представляет собой связь;

Z представляет собой C-H, C-галоген, C-(C₁-C₆)-алкил, C-галоген(C₁-C₆)алкил, C-(C₁-C₆)алкокси или N;

X^{II} представляет собой CH₂, CH, NH или N; каждый R¹⁰ и R¹¹ независимо представляет собой H, -OH, галоген, алкил, галогеналкил, -NR⁸R⁹, -OR², -CN, -CH₂OH, -CH₂-NR³R⁴, арил, моноциклический гетероарил, алкиларил, -CH=O, -CH₂OR², -COR², -CO₂R² или -CONR³R⁴, или объединенные вместе образуют =O, =NOR², =C(C₁-C₆алкил)₂ или =CR²H при условии, что если «---» представляет собой связь, то R¹¹ отсутствует, а X^{II} представляет собой CH или N и R¹⁰ представляет собой H, -OH, галоген, алкил, галогеналкил, -NR⁸R⁹, -OR², -CN, -CH₂OH, -CH₂-NR³R⁴, арил, моноциклический гетероарил, алкиларил, -CH=O, -CH₂OR², -COR², -CO₂R² или -CONR³R⁴;

V представляет собой



(C₃-C₇)циклоалкил, (C₃-C₇)гетероциклоалкил, (C₄-C₇)циклоалкенил, (C₄-C₇)гетероциклоалкенил, арил или гетероарил, где R¹ представляет собой (C₁-C₆)алкокси, (C₃-C₇)циклоалкил, (C₃-C₇)гетероциклоалкил, (C₄-C₇)циклоалкенил, (C₄-C₇)гетероциклоалкенил, арил, моноциклический гетероарил или -NR³R₄;

G представляет собой H, галоген, (C₁-C₆)алкил, галоген(C₁-C₆)алкил, гидрокси(C₁-C₆)алкил, -CH₂O-(C₁-C₆)алкил, -CH₂-CO₂(C₁-C₆)алкил, -CH₂-CONH₂ или -CH₂-CONH(C₁-C₆)алкил; каждый R² и R² независимо представляет собой H или (C₁-C₆)алкил и

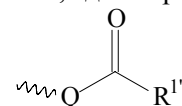
R³ и R⁴ независимо представляют собой H, (C₁-C₆)алкил, аралкил, арил, моноциклический гетероарил, алкоксикарбонил, аралкоксикарбонил, -SO₂алкил или объединены вместе с образованием насыщенного или ненасыщенного 5-7-членного кольца;

каждый R¹² и R¹³ независимо представляет собой H, галоген, (C₁-C₆)алкил или галоген(C₁-C₆)алкил или (C₁-C₆)алкокси;

каждый R¹⁴ и R¹⁵ независимо представляет собой H, галоген, алкил, или галогеналкил, или NR⁸R⁹,

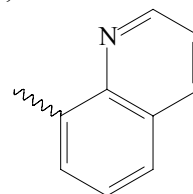
где R⁸ и R⁹ такие, как определено для R³ и R⁴; каждый X и Y представляет собой C или один из X и Y представляет собой C, а другой представляет собой N при условии, что если один из X или Y представляет собой N, то R¹⁴ или R¹⁵ отсутствуют в этом положении; алкил, арил, (C₃-C₇)циклоалкил, гетероарил, гетероатом, гетероцикл и гетероцикло имеют значения, как определено в п. 1.

3. Соединение по п. 2, где В представляет собой

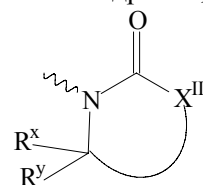


" --- " указывает место присоединения,

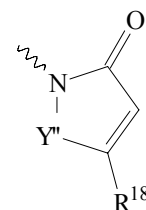
Q представляет собой NH и где R^{1'} представляет собой -O-(C₁-C₆) или NR^{3'}R^{4'}, где R^{3'} и R^{4'} независимо представляют собой H, (C₁-C₆)алкил или объединены с образованием необязательно замещенного насыщенного или ненасыщенного 5-7-членного кольца;



" --- " указывает место присоединения или В необязательно представляет собой замещенный фенил или пиридил с формилом, H₂NSO₂, MeSO₂, MeSO, MeS, (C₁-C₆)алкоксикарбонил, циано, аминметил, метокси или гидрокси;

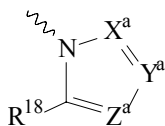


" --- " указывает место присоединения, и который необязательно замещен 4, 5, 6 или 7-членным кольцом; где R^x и R^y представляют собой H, галоген, (C₁-C₆)алкил, (C₁-C₆)алкокси или (C₁-C₆)карбоксиялкил или объединены вместе с образованием O=; X^{III} представляет собой CH₂, CH-OH, CH-CO₂(C₁-C₆)алкил, O, S, NH или N(C₁-C₆)алкил при условии, что если R^x и R^y, объединенные вместе образуют O=, то X^{III} представляет собой CH₂;

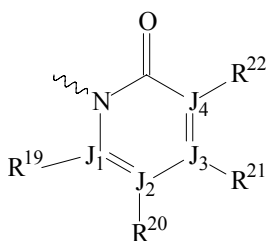


или его таутомер, где Y^{II} представляет собой CH_2 , $CH(C_1-C_6)$ алкил или N , и R^{18} представляет собой H , (C_1-C_6) алкил, гидроксиметил, $CH_2O-(C_1-C_6)$ алкил, $CONR^2R^{2'}$ или $CH_2NR^2R^{2'}$;

5-членное гетероарильное кольцо, содержащее по крайней мере один атом азота, выбранное из имидазолила, пиразолила, триазолила, тетразолила, оксадиазолила, тиadiaзолила, оксазолила, изоксазолила, триазолила или изотиазолила, каждое может быть необязательно замещено галогеном, (C_1-C_6) алкилом, гидрокси (C_1-C_6) алкилом, $CH_2O-(C_1-C_6)$ алкилом или галоген (C_1-C_6) алкилом или представляет собой

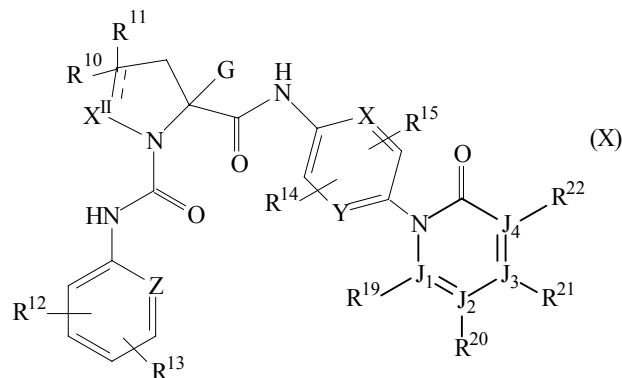


" \sim " указывает место присоединения; каждый X^a , Y^a и Z^a независимо представляет собой CR^c или N , где R^c представляет собой H или (C_1-C_6) алкил и R^{18} представляет собой H , (C_1-C_6) алкил, гидроксиметил, $CH_2O-(C_1-C_6)$ алкил или NR^3R^4 ;



" \sim " указывает место присоединения; каждый J_1 , J_2 , J_3 и J_4 представляет собой C или любой J_1 , J_2 , J_3 или J_4 представляет собой N ; и R^{19} , R^{20} , R^{21} и R^{22} каждый независимо представляют собой H , галоген, гидрокси, NH_2 , $NR^{23}R^{24}$, NO_2 , SH , (C_1-C_6) алкил, галоген (C_1-C_6) алкил, (C_1-C_6) алканоил, (C_1-C_6) алкоксикарбонил или (C_1-C_6) алкокси, где каждый R^{23} и R^{24} независимо представляет собой H , (C_1-C_6) алкил, аралкил, арил, моноциклический гетероарил, алкоксикарбонил, аралкоксикарбонил, $-SO_2$ алкил или объединены с образованием насыщенного или ненасыщенного 3-7-членного кольца, или R^{19} и R^{20} , R^{20} и R^{21} или R^{21} и R^{22} вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют 5, 6 или 7-членное насыщенное или ненасыщенное циклоалкильное или гетероциклоалкильное кольцо, или арильное или гетероарильное кольцо при условии, что если любой J_1 , J_2 , J_3 или J_4 представляет собой N , то R^{19} , R^{20} , R^{21} или R^{22} соответственно отсутствуют в этом положении.

4. Соединение формулы (X)



или его фармацевтически приемлемая соль, где значения ---, Z , G , X^{II} , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , X и Y определены в п. 2;

J_1 , J_2 , J_3 и J_4 представляют собой C или один из J_1 , J_2 , J_3 и J_4 представляет собой N ; и каждый R^{19} , R^{20} , R^{21} и R^{22} независимо представляет собой H , галоген, гидрокси, NH_2 , $NR^{23}R^{24}$, NO_2 , SH , (C_1-C_6) алкил, галоген (C_1-C_6) алкил, (C_1-C_6) алканоил, (C_1-C_6) алкоксикарбонил или (C_1-C_6) алкокси, где каждый R^{23} и R^{24} независимо представляет собой H , (C_1-C_6) алкил, аралкил, арил, моноциклический гетероарил, алкоксикарбонил, аралкоксикарбонил, $-SO_2$ алкил, или R^{23} и R^{24} объединены с образованием насыщенного или ненасыщенного 3-7-членного кольца, или R^{19} и R^{20} , R^{20} и R^{21} , или R^{21} и R^{22} вместе с атомами углерода, к которым они присоединены, образуют 5, 6 или 7-членное насыщенное или ненасыщенное циклоалкильное или гетероциклоалкильное кольцо, или арильное или гетероарильное кольцо;

при условии, что когда любой из J_1 , J_2 , J_3 или J_4 представляет собой N , то R^{19} , R^{20} , R^{21} или R^{22} отсутствуют в этом положении;

алкил, арил, (C_3-C_7) циклоалкил, гетероарил, гетероатом, гетероцикл и гетероцикло имеют значения, как определено в п. 1.

5. Соединение по п. 4, которое представляет собой (1-[(4-хлор-фенил)-амид] 2-{[2-фторо-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-фенил]-амид}) (2R,4R)-4-метокси-пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты.

6. Соединение по п. 4, которое представляет собой 1-[(4-хлор-фенил)-амид] 5-{[2-фторо-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-фенил]-амид} 5-метил-4,5-дигидро-пиразол-1,5-дикарбоновой кислоты.

7. Соединение по пп. 1, 2 или 3, которое представляет собой:

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-[(3-фтор-2'-сульфамилбифенил-4-ил)амид] пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-[(3-фтор-2'-сульфамойл-

фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] 4-метокси-
пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
2- {[4-(2-аминометил-5-оксопирролидин-1-ил)-2-
фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] 4-ме-
токси-пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
2- {[4-(2-карбамоил-5-оксопирролидин-1-ил)-2-
фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] 4-ме-
токси-пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
2- {[4-(2-карбамоил-5-оксопирролидин-1-ил)-2-
фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] 4-ме-
токси-пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
2- {[4-(2,2-бис-гидроксиметил-5-оксопирролидин-
1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид]
4-метокси-пирролидин-1,2-дикарбоновой кисло-
ты;
3-(4- {[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метокси-
пирролидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-2-ок-
соимидазолидин-4-карбоновую кислоту;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(3,3-диметил-2,5-
диоксопирролидин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 4-
метокси-пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3,3,4-три-
метил-2,5-диоксопирролидин-1-ил)фенил]амид}
4-метокси-пирролидин-1,2-дикарбоновой кисло-
ты;
1-(4- {[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метокси-
пирролидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-5-ок-
сопирролидин-2,2-дикарбоновую кислоту;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-метил-5-
оксопирролидин-1-ил)фенил]амид} 4-метокси-
пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-метил-6-
оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} 4-метокси-
пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-гидрок-
си-2-оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} 4-метокси-
пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-метил-
2,6-диоксотетрагидропиримидин-1-ил)фенил]-
амид} 4-метокси-пирролидин-1,2-дикарбоновой
кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-оксотет-
рагидропиримидин-1-ил)фенил]амид} 4-метокси-
пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-метил-2-
оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} 4-метокси-
пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(2,5-диоксопипера-
зин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 4-метокси-
пирро-
лидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-гидрок-
си-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} 4-ме-
токси-пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-метокси-
2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} 4-метокси-
пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(6-метил-2-
оксо-4-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)фенил]-
амид} 4-метокси-пирролидин-1,2-дикарбоновой
кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(2,6-диоксопипери-
дин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 4-метокси-
пирро-
лидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-(4- {[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метокси-
пирро-
лидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-2-ок-
сопиперидин-3-карбоновую кислоту;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(5,5-дигидрокси-2,
4,6-триоксотетрагидропиримидин-1-ил)-2-фтор-
фенил]амид} 4-метокси-пирролидин-1,2-дикарбо-
новой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2,4,6-триок-
сотетрагидропиримидин-1-ил)фенил]амид} 4-
метокси-
пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(4,4-диметил-2,6-
диоксопиперидин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 4-
метокси-
пирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(2-гидрок-
си-4-оксоазетидин-1-ил)фенил]амид} 4-метокси-
пирро-
лидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
2- {[4-(ацетилметиламино)-2-фторфенил]амид} 1-
[(4-хлорфенил)амид] 4-метокси-пирролидин-1,2-
дикарбоновой кислоты;
4-(4- {[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метокси-
пирро-
лидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-1Н-
пиррол-3-карбоновую кислоту;
2-(4- {[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метокси-
пирро-
лидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-2Н-
пиразол-3-карбоновую кислоту;
1-(4- {[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метокси-
пирро-
лидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-1Н-
имидазол-2-карбоновую кислоту;
1-(4- {[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метокси-
пирро-
лидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-1Н-
пиррол-2-карбоновую кислоту;
3-(4- {[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метокси-
пирро-
лидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-1Н-
пиррол-2-карбоновую кислоту;
3-(4- {[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метокси-
пирро-
лидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)фу-
ран-2-карбоновую кислоту;
3-(4- {[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метокси-
пирро-
лидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)тио-
фен-2-карбоновую кислоту;
4-(4- {[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метокси-
пирро-
лидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-
фуран-3-карбоновую кислоту;
4-(4- {[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метокси-
пирро-
лидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)тио-
фен-3-карбоновую кислоту;
1-[(4-хлорфенил)амид] 5-[(3-фтор-2'-метансуль-
фонилбифенил-4-ил)амид] 4,5-дигидропиразол-
1,5-дикарбоновой кислоты;

амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[2-фтор-4-(3,5,5-триметил-2-оксоимидазолидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[2-фтор-4-(3-изопропил-5,5-диметил-2-оксоимидазолидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[2-фтор-4-(5-метил-2-оксоимидазолидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[4-(5,5-диметил-2-оксоимидазолидин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{[4-(3,4-диметил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{[4-(4-хлор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

или его фармацевтически приемлемая соль.

12. Соединение по пп. 1, 2 или 3, которое представляет собой:

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-хинолин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(3-оксо-3Н-изохинолин-2-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(1-оксо-1Н-изохинолин-2-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(5-оксо-5Н-[1,2,4]триазин-4-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(6-оксо-6Н-пиримидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиразин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиримидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-[1,3,5]триазин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-[(6-метил-2-оксо-2Н-[1,3,3']бипиридинил-6'-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(1-метил-1Н-имидазол-2-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(1-метил-1Н-пиррол-2-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

5-[(4-хлорфенил)амид] 6-{[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-5-азаспиро[2,4]гептан-5,6-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-карбонил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(3-метил-3Н-имидазол-4-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-метил-2Н-пиразол-3-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[5-(2,5-дигидропиррол-1-карбонил)-пиридин-2-ил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(3-метил-5-оксо-2,5-дигидропирразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(5-метоксиметил-3-метилпирразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(3-метоксиметил-5-метилпирразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(5-этил-3-метилпирразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(5-изобутил-3-метилпирразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(5-изопропилпирразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(5-этилпирразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(5-изобутилпирразол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

метиловый эфир (2R,4R)-2-(4-{[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]-амино}-3-фторфенил)-2Н-пирразол-3-карбоновой кислоты;

(2R,4R)-2-(4-{[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-2Н-пирразол-3-карбоновую кислоту;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(5-метокси-

трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид)
(2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой
кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(6-циклопропил-2-
оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,
4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кис-
лоты;

этиловый эфир (2R,4R)-1-(4-{[1-(4-хлорфенил-
карбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]-
амино}-3-фторфенил)-6-оксо-1,6-дигидропири-
дин-3-карбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(3,3-диметил-2-ок-
соазетидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-меток-
сипирролидин-1,2-дикарбоновую кислоту;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(7-оксо-7Н-
тиено[2,3-с]пиридин-6-ил)фенил]амид} (2R,4R)-
4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кисло-
ты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-1-
азаспиро[4,5]дец-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-
метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{[4-(3-бензоил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-
фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,
4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кис-
лоты;

2-{[4-(3-ацетилсульфамоил-2-оксо-2Н-пиридин-
1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид]
(2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой
кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-1-
азаспиро[4,5]дец-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-меток-
сипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(3-метил-2-
оксопиперидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-ме-
токсипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-3-
сульфамоил-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,
4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кис-
лоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(2,5-диоксо-2,5-ди-
гидропиррол-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-меток-
сипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{[4-(3-амино-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фтор-
фенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-
метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(2-оксо-3-фе-
нокси-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-
метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(2,2-диметил-5-ок-
сопирролидин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-
4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кисло-
ты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(3-нитро-2-
оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-
метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

трет-бутиловый эфир (2R,4R)-1-(4-{[1-(4-хлорфе-
нилкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбо-
нил]амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидро-
пиридин-3-карбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(2,5-диоксопирро-
лидин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипир-
ролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{[4-(3-бензотиазол-2-ил-2-оксо-2Н-пиридин-1-
ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид]
(2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой
кислоты;

2-{[4-(3-амино-4,6-диметил-2-оксо-2Н-пиридин-
1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид]
(2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой
кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(3-диэтиламино-
метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]-
амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикар-
боновой кислоты;

2-{[4-(3-аминометил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-
2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,
4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кис-
лоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[2-фтор-4-(3-метил-5-
нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,
4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кис-
лоты;

1-(4-{[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метоксипир-
ролидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-2-ок-
со-1,2-дигидропиридин-3-иловый эфир (2R,4R)-
уксусной кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-({[4-(3-(циклопентан-
карбониламино)-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-
фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирроли-
дин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{[4-(5-амино-3-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-
ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид]
(2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой
кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-({2-фтор-4-[2-оксо-3-
(пиридин-4-илкарбамоил)-2Н-пиридин-1-ил]фе-
нил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-ди-
карбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(3,5-дихлор-2-оксо-
2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-
4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кисло-
ты;

2-{[4-(3-амино-5-бром-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-
2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,
4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кис-
лоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(3-циано-2-оксо-
2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-
метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{[4-(3-циано-2-оксо-5-

фенил-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(3-этил-6-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[4-(3-циано-4-диметиламино-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(4-метил-3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-нитро-2-оксо-3-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2- {[4-(5-амино-6-оксо-6Н-[3,4']бипиридинил-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2- {[4-(5-хлор-3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2- {[4-(3-карбамоил-2-оксо-5-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

изобутиловый эфир (2R,4R)-5-бром-1-(4-{[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбоновой кислоты;

2- {[4-(3-хлор-2-оксо-5-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2- {[4-(3-бром-5-хлор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2- {[4-(5-бром-3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(3-нитро-2-оксо-5-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(5-метил-3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

метилловый эфир (2R,4R)-5-хлор-1-(4-{[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбоновой кислоты;

(2R,4R)-5-хлор-1-(4-{[1-(4-хлорфенилкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил]амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбоновую кислоту;

2- {[4-(4-бензилокси-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

(2- {[4-(4-амино-5-фтор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(6-метил-3-оксо-3Н-изохинолин-2-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(4-метил-5-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил]амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2- {[4-(5-ацетиламино-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2- {[4-(4-амино-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(6-оксо-6Н-[3,4']бипиридинил-1-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2- {[4-(4-бром-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(4-оксо-4Н-фуоро[3,2-с]пиридин-5-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(1-оксо-1Н-[2,6]нафтиридин-2-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2- {[4-(5-бром-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил]амид} 1-[(4-хлорфенил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(4-оксо-4Н-тиено[3,2-с]пиридин-5-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(4-хлорфенил)амид] 2- {[2-фтор-4-(4-оксо-1,4-дигидроимидазо[4,5-с]пиридин-5-ил)фенил]амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{{4-(5-хлор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(5-фтор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

(2R, 4R)-1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}амино}-3-фторфенил)-6-оксо-1,6-дигидропиридин-3-карбоновую кислоту;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(6-гидрокси-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновую кислоту;

(2R, 4R)-1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбоновую кислоту;

метилловый эфир (2R, 4R)-1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}амино}-3-фторфенил)-6-оксо-1,6-дигидропиридин-2-карбоновой кислоты;

(2R, 4R)-[1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}амино}-фенил)-2,5-диоксоимидазолидин-4-ил]уксусную кислоту;

метилловый эфир (2R, 4R)-1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбоновой кислоты;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(2-оксо-3-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(4-гидрокси-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

(2R, 4R)-1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}амино}-3-фторфенил)-6-оксо-1,6-дигидропиридин-2-карбоновую кислоту;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(2-оксо-5-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{4-(6-циклопропил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

этиловый эфир (2R, 4R)-1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}амино}-3-фторфенил)-6-оксо-1,6-дигидропиридин-3-карбоновой кислоты;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(3-гидрокси-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{4-(3,3-диметил-2-оксоазетидин-1-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(7-оксо-7Н-тиено[2,3-с]пиридин-6-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(2-оксо-1-азаспиро[4,5]дец-1-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{{4-(3-бензоил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(2-метил-5-оксопирролидин-1-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(2-метил-6-оксопиперидин-1-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{{4-(3-ацетилсульфамоил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(2-оксотиазолидин-3-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(3-метил-2-оксопиперидин-1-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{2-фтор-4-(2-оксо-3-сульфамоил-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{4-(2,5-диоксо-2,5-дигидропиррол-1-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{{4-(3-амино-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-{{(5-хлорпиридин-2-ил)амид} 2-{{4-(2,2-диметил-5-оксопирролидин-1-ил)-2-фторфенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой

кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

трет-бутиловый эфир (2R,4R)-1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{4-(2,5-диоксопирролидин-1-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{{4-(3-бензотиазол-2-ил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{{4-(3-амино-4,6-диметил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{4-(3-диэтиламинметил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{{4-(3-аминометил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(3-метил-5-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-иловый эфир (2R,4R)-уксусной кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-({4-[3-(циклопентанкарбониламино)-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил]-2-фторфенил}амид) (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{{4-(5-амино-3-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-({2-фтор-4-[2-оксо-3-(пиридин-4-илкарбамоил)-2Н-пиридин-1-ил]фенил}амид) (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{4-(3,5-дихлор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{{4-(3-амино-5-бром-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{4-(3-циано-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} (2R, 4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{4-(3-циано-2-оксо-5-фенил-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{4-(3-этил-6-метил-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{4-(3-циано-4-диметиламино-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(4-метил-3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(5-нитро-2-оксо-3-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{{4-(5-амино-6-оксо-6Н-[3,4']бипиридинил-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{{4-(5-хлор-3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{{4-(3-карбамоил-2-оксо-5-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

изобутиловый эфир (2R,4R)-5-бром-1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбоновой кислоты;

2-{{4-(3-хлор-2-оксо-5-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

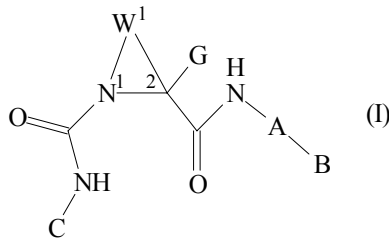
2-{{4-(3-бром-5-хлор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

2-{{4-(5-бром-3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(3-нитро-2-оксо-5-трифторметил-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

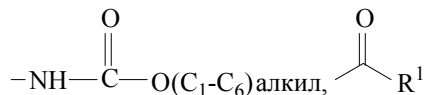
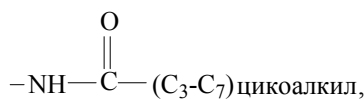
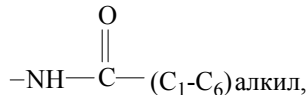
1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(5-метил-3-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
метилловый эфир (2R,4R)-5-хлор-1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбоновой кислоты;
(2R,4R)-5-хлор-1-(4-{{1-(5-хлорпиридин-2-илкарбамоил)-4-метоксипирролидин-2-карбонил}амино}-3-фторфенил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-3-карбоновую кислоту;
2-{{4-(4-бензилокси-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
2-{{4-(4-амино-5-фтор-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(5-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(6-метил-3-оксо-3Н-изохинолин-2-ил)фенил}амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(4-метил-5-нитро-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
2-{{4-(5-ацетиламино-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(1-оксо-1Н-изохинолин-2-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
2-{{4-(4-амино-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(6-оксо-6Н-[3,4']бипиридинил-1-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(3-оксо-3Н-изохинолин-2-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
2-{{4-(4-бром-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;

1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(4-оксо-4Н-фуоро[3,2-с]пиридин-5-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(1-оксо-1Н-[2,6]нафтиридин-2-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
2-{{4-(5-бром-2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)-2-фторфенил}амид} 1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(4-оксо-4Н-тиено[3,2-с]пиридин-5-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 2-{{2-фтор-4-(4-оксо-1,4-дигидроимидазо[4,5-с]пиридин-5-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 5-{{2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} 4,5-дигидропиразол-1,5-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 5-{{2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} 3-гидроксиметил-4,5-дигидропиразол-1,5-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 5-{{2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} 5-метил-4,5-дигидропиразол-1,5-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 5-{{2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} 3-метоксиметил-4,5-дигидропиразол-1,5-дикарбоновой кислоты;
1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 5-{{2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} 4,5-дигидропиразол-1,5-дикарбоновой кислоты;
1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 5-{{2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} 3-гидроксиметил-4,5-дигидропиразол-1,5-дикарбоновой кислоты;
1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 5-{{2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} 5-метил-4,5-дигидропиразол-1,5-дикарбоновой кислоты;
1-[(5-хлорпиридин-2-ил)амид] 5-{{2-фтор-4-(2-оксо-2Н-пиридин-1-ил)фенил}амид} 3-метоксиметил-4,5-дигидропиразол-1,5-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 5-{{4-(2-метилтиазол-4-ил)фенил}амид} 4,5-дигидропиразол-1,5-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2-{{2-фтор-4-(2-оксопиперидин-1-ил)фенил}амид} (2R,4R)-4-метокси-2-метилпирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;
1-[(4-хлорфенил)амид] 2-[(3,4,5,6-тетрагидро-2Н-[1,4']бипиридинил-4-илметил)амид] (2R,4R)-4-метоксипирролидин-1,2-дикарбоновой кислоты;



или его фармацевтически приемлемую соль, где:
А представляет собой арил или моноциклический гетероарил;

В представляет собой



(C₃-C₇)циклоалкил, (C₃-C₇)гетероцикло, (C₄-C₇)циклоалкенил, ненасыщенный (C₄-C₇)гетероцикло, арил или гетероарил, где каждый может быть необязательно замещен галогеном, (C₁-C₆)алкилом или галоген(C₁-C₆)алкилом, O-(C₁-C₆), -CN, галогеналкилом, amino, алкиламино, амидино, амидо или сульфонамидо;

С представляет собой фенил или гетероарил, где фенил или гетероарил необязательно замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из арила, гетероарила, галогена, гидрокси, -CO₂R², -COR², -CONR²R^{2'}, алкокси, алкила, -CN, галогеналкила, amino, алкиламино, амидино, амидо или сульфонамидо;

G представляет собой H, галоген, (C₁-C₆)алкил, галоген(C₁-C₆)алкил, гидрокси(C₁-C₆)алкил, -CH₂O-(C₁-C₆)алкил, -CH₂-CO₂(C₁-C₆)алкил, -CH₂-NR²R^{2'} или -CH₂-CONH(C₁-C₆)алкил;

W¹ представляет собой насыщенную или ненасыщенную, замещенную или незамещенную углеводородную цепь или углеводородную цепь, содержащую гетероатомы, состоящую из 2-6 атомов, где W¹ соединяет атом азота в положении 1 с атомом углерода в положении 2 с образованием 4-8-членного кольца;

R¹ представляет собой (C₁-C₆)алкокси, (C₃-C₇)циклоалкил, (C₃-C₇)гетероциклоалкил, (C₄-C₇)циклоалкенил, (C₄-C₇)гетероциклоалкенил, арил, моноциклический гетероарил или -NR³R⁴; каждый R² и R^{2'} независимо представляет собой H или (C₁-C₆)алкил; и каждый R³ и R⁴ независимо представляет собой H, (C₁-C₆)алкил, аралкил, арил, моноцикличес-

кий гетероарил, алкоксикарбонил, аралкоксикарбонил, -SO₂-алкил или объединены вместе с образованием насыщенного или ненасыщенного 3-7-членного кольца;

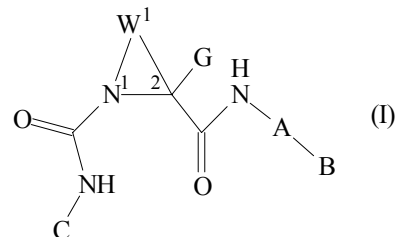
алкил, арил, (C₃-C₇)циклоалкил, гетероарил, гетероатом, гетероцикл, гетероцикло, углеводородная цепь и углеводородная цепь, содержащая гетероатомы имеют значения как определено в п. 1;

в смеси с носителем, разбавителем или эксципиентом.

15. Способ профилактики или лечения острого, подострого и хронического тромбозного заболевания, который включает в себя введение млекопитающему при необходимости такого введения терапевтически эффективного количества соединения по п. 1.

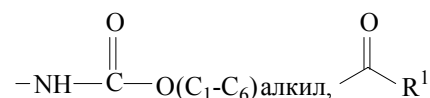
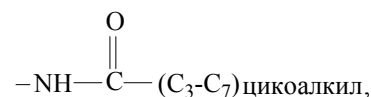
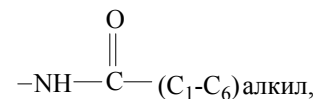
16. Способ по п. 15, где острое, подострое и хроническое заболевание представляет собой тромбоз вен, тромбоз артерий, эмболию легких, инфаркт миокарда, инфаркт мозга, рестеноз, рак, стенокардию, диабет, фибрилляцию предсердий или сердечную недостаточность.

17. Способ получения соединения формулы (I)



или его фармацевтически приемлемой соли, где:
А представляет собой арил или моноциклический гетероарил;

В представляет собой



(C₃-C₇)циклоалкил, (C₃-C₇)гетероцикло, (C₄-C₇)циклоалкенил, ненасыщенный (C₄-C₇)гетероцикло, арил или гетероарил, где каждый может быть необязательно замещен галогеном, (C₁-C₆)алкилом или галоген(C₁-C₆)алкилом, O-(C₁-C₆), -CN, галогеналкилом, amino, алкиламино, амидино, амидо или сульфонамидо;

С представляет собой фенил или гетероарил, где фенил или гетероарил необязательно замещен од-

ним или несколькими заместителями, выбранными из арила, гетероарила, галогена, гидрокси, $-CO_2R^2$, $-COR^2$, $-CONR^2R^{2'}$, алкокси, алкила, $-CN$, галогеналкила, amino, алкиламино, амидино, амидо или сульфонамидо;

G представляет собой H, галоген, (C_1-C_6) алкил, галоген (C_1-C_6) алкил, гидрокси (C_1-C_6) алкил, $-CH_2O-(C_1-C_6)$ алкил, $-CH_2CO_2(C_1-C_6)$ алкил, $-CH_2-NR^2R^{2'}$ или $-CH_2-CONH(C_1-C_6)$ алкил;

W^1 представляет собой насыщенную или ненасыщенную, замещенную или незамещенную углеводородную цепь или углеводородную цепь, содержащую гетероатомы, состоящую из 2-6 атомов, где W^1 соединяет атом азота в положении 1 с атомом углерода в положении 2 с образованием 4-8-членного кольца;

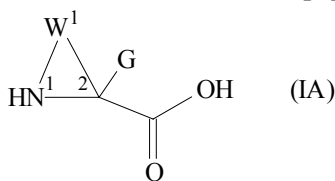
R^1 представляет собой (C_1-C_6) алкокси, (C_3-C_7) циклоалкил, (C_3-C_7) гетероциклоалкил, (C_4-C_7) циклоалкенил, (C_4-C_7) гетероциклоалкенил, арил, моноциклический гетероарил или $-NR^3R^4$;

каждый R^2 и $R^{2'}$ независимо представляет собой H или (C_1-C_6) алкил и

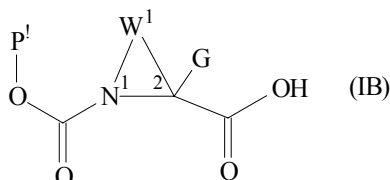
каждый R^3 и R^4 независимо представляет собой H, (C_1-C_6) алкил, аралкил, арил, моноциклический гетероарил, алкоксикарбонил, аралкоксикарбонил, $-SO_2$ -алкил или объединены вместе с образованием насыщенного или ненасыщенного 3-7-членного кольца;

алкил, арил, (C_3-C_7) циклоалкил, гетероарил, гетероатом, гетероцикл, гетероцикло, углеводородная цепь и углеводородная цепь, содержащая гетероатомы, имеют значения как определено в п. 1; который включает в себя

(а) взаимодействие аминокислоты формулы (IA)



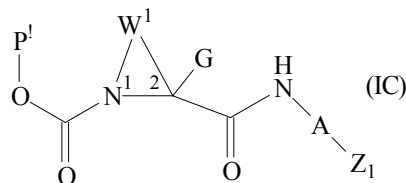
с реагентом, способным присоединять защитную группу P1 к аминогруппе аминокислоты с образованием замещенной аминокислоты, с получением формулы (IB):



P^1 представляет собой защитную группу, и W^1 такой же, как определено выше;

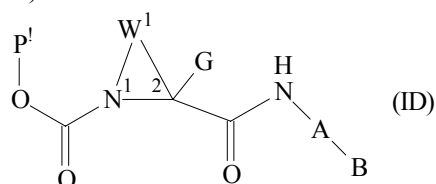
(b) преобразование кислотной группы соединения формулы (IB) в галогенангидрид;

(c) взаимодействие галогенангидрида с галогенанилином или галогенамино-гетероциклом с образованием соединения формулы (IC)



Z_1 представляет собой галоген и A такой, как определено выше;

(d) взаимодействие соединения формулы (IC) с соединением H-B с получением соединения формулы (ID)



(e) удаление защитной группы соединения ID и взаимодействие полученной кислотной группы с C-изоцианатом с образованием соединения по данному изобретению.

С бўлими

КИМЁ ВА МЕТАЛЛУРГИЯ

Раздел С

ХИМИЯ И МЕТАЛЛУРГИЯ

С 07

(11) IAP 03631

(13) С

(51) 8 С 07 D 401/00, А 61 К 31/4523, А 61 Р 29/00

(21) IAP 2005 0425

(22) 23.04.2004

(31)(32)(33) MI2003A000972, 15.05.2003, IT

(71)(73) Азиенде Химише Рионите Анжелини Франческо А.С.Р.А.Ф. С.п.А., IT

(72) АЛИСИ, Мариа, Алессандра; КАЗЗОЛЛА, Никола; ФУРЛОТТИ, Гвидо; ГУГЛИЕЛМОТТИ, Анджело; ПОЛЕНЦАНИ, Лоренцо; IT

(85) 14.12.2005

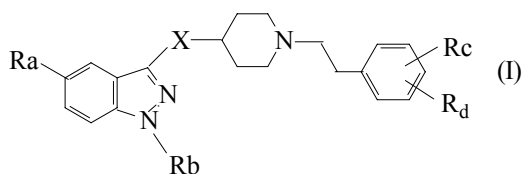
(86) PCT/EP 2004/004390, 23.04.2004

(87) WO 2004/101548, 25.11.2004

(54) Аналгетик фаолликка эга булган индазоллар

Индазолы, обладающие анальгетической активностью

(57) 1. Қуйидаги формулани бирикма:



бу ерда

X C(O)NHCH₂ ёки NHC(O) ни билдиради;

R_a H, NH₂C(O), CH₃C(O)NH, CH₃SO₂, CH₃SO₂NH, чизикли ёки тармоқланган C₁-C₃-алкил, чизикли ёки тармоқланган C₁-C₃-алкокси ёки галогенни билдиради;

R_b H, чизикли ёки тармоқланган C₁-C₆-алкилни; шарт бўлмаган ҳолда 1 ёки 2 та галоген атомлари, C₁-C₃-алкил гуруҳи ёки C₁-C₃-алкоксигуруҳи билан алмашинган арил(C₁-C₃)алкилни билдиради;

ва унда

а) X C(O)NHCH₂ ни билдирганида,

R_c гидрокси, аминогуруҳи, ди(C₁-C₃)алкиламиногуруҳи, три(C₁-C₃)алкиламмониометил, нитрогуруҳи, трифторметил, нитрил, CH₃C(O)NH, CH₃SO₂NH, CH₃SO₂, R'R''NSO₂ ни билдиради, бу ерда R' ва R'' H, ёки чизикли ёки тармоқланган C₁-C₆-алкил билдирадilar,

R_d H, гидрокси, аминогуруҳи, ди(C₁-C₃)алкиламиногуруҳи, три(C₁-C₃)алкиламмониометил, нитрогуруҳи, трифторметил, нитрил, CH₃C(O)NH, CH₃SO₂NH, CH₃SO₂, R'R''NSO₂ ни билдиради, бу ерда R' ва R'' юқорида кўрсатиб ўтилган қийматларга эга,

бирок шу шарт биланки, R_a ва R_d ларнинг ҳар иккаласи H ни ва R_b изопротилни билдирганида, у ҳолда R_c гидроксини билдирмайди;

б) X NHC(O) билдирганида,

бир хил ёки турли хил бўлиши мумкин бўлган R_c ва R_d лар H, гидрокси, C₁-C₃-алкокси, галоген, аминогуруҳи, ди(C₁-C₃)алкиламиногуруҳи, три(C₁-C₃)алкиламмониометил, нитрогуруҳи, трифторметил, нитрил, CH₃C(O)NH, CH₃SO₂NH, CH₃SO₂, R'R''NSO₂ ни билдиради, бу ерда R' ва R'' юқорида кўрсатиб ўтилган қийматларга эга, ва унинг фармацевтик мақбул органик ва ноорганик кислоталарининг аддитив тузлари.

2. 1-банд бўйича бирикма шу билан фарқланади, R_a H ёки C₁-C₃-алкилни билдиради.

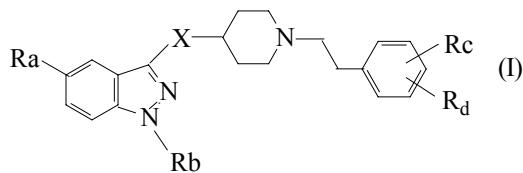
3. 1- ёки 2-банд бўйича бирикма шу билан фарқланади, R_b H ёки C₁-C₃-алкилни билдиради.

4. 1-3-бандларнинг исталгани бўйича бирикма шу билан фарқланади, R_c H, NO₂, NH₂, OH ёки C₁-C₃-алкоксини билдиради.

5. 1-4-бандларнинг исталгани бўйича шу билан фарқланади, R_d H ни билдиради.

6. 1-5-бандларнинг исталгани бўйича бирикма кислотасининг аддитив тузи шу билан фарқланади, кислотани оксалат кислотаси, малеин кислотаси, метансульфоқислота, паратолуолсульфоқислота, қахрабо кислотаси, лимон кислотаси, вино кислотаси, сут кислотаси, хлорид кислотаси, фосфат кислотаси ва сульфат кислотасини ичига киритган гуруҳдан танлаб олинади.

7. Сурункали оғриқни даволаш учун (I) формулани бирикманинг самарали микдорини:



бу ерда

X C(O)NHCH₂ ёки NHC(O) ни билдиради;

R_a H, NH₂C(O), CH₃C(O)NH, CH₃SO₂, CH₃SO₂NH, чизикли ёки тармоқланган C₁-C₃-алкил, чизикли ёки тармоқланган C₁-C₃-алкокси ёки галогенни билдиради;

R_b H, чизикли ёки тармоқланган C₁-C₆-алкилни; шарт бўлмаган ҳолда 1 ёки 2 та галоген атомлари, C₁-C₃-алкил гуруҳи ёки C₁-C₃-алкоксигуруҳи билан алмашинган арил(C₁-C₃)алкилни билдиради;

ва унда

а) X C(O)NHCH₂ ни билдирганида,

R_c гидрокси, аминогуруҳи, ди(C₁-C₃)алкиламиногуруҳи, три(C₁-C₃)алкиламмониометил, нитрогуруҳи, трифторметил, нитрил, CH₃C(O)NH, CH₃SO₂NH, CH₃SO₂, R'R''NSO₂ ни билдиради, бу ерда R' ва R'' H, ёки чизикли ёки тармоқланган C₁-C₆-алкил билдирадilar,

R_d H, гидрокси, аминогуруҳи, ди(C₁-C₃)алкиламиногуруҳи, три(C₁-C₃)алкиламмониометил, нитрогуруҳи, трифторметил, нитрил, CH₃C(O)NH, CH₃SO₂NH, CH₃SO₂, R'R''NSO₂ ни билдиради, бу ерда R' ва R'' юқорида кўрсатиб ўтилган қийматларга эга,

бирок шу шарт биланки, R_a ва R_d ларнинг ҳар иккаласи H ни ва R_b изопротилни билдирганида, у ҳолда R_c гидроксини билдирмайди;

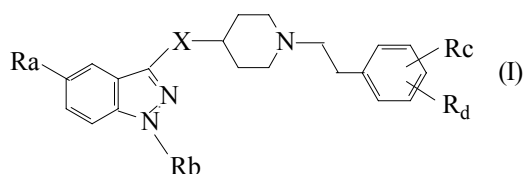
б) X NHC(O) билдирганида,

бир хил ёки турли хил бўлиши мумкин бўлган R_c ва R_d лар H, гидрокси, C₁-C₃-алкокси, галоген, аминогуруҳи, ди(C₁-C₃)алкиламиногуруҳи, три(C₁-C₃)алкиламмониометил, нитрогуруҳи, трифторметил, нитрил, CH₃C(O)NH, CH₃SO₂NH, CH₃SO₂, R'R''NSO₂ ни билдиради, бу ерда R' ва R'' юқорида кўрсатиб ўтилган қийматларга эга, ёки унинг органик ёки ноорганик кислотасининг фармацевтик мақбул аддитив тузини, ва камида

битта фармацевтик макбул инерт ингредиентини ичига олган фармацевтик композиция.

8. 7-банд бўйича фармацевтик композиция шу билан фарқланадиги, у аввалги 1-6-бандларнинг исталгани бўйича бирикмани ичига олади.

1. Соединение формулы



где X означает $C(O)NHCH_2$, или $NHC(O)$; R_a означает H, $NH_2C(O)$, $CH_3C(O)NH$, CH_3SO_2 , CH_3SO_2NH , линейный или разветвленный C_1-C_3 алкил, линейный или разветвленный C_1-C_3 алкокси или галоген;

R_b означает H, линейный или разветвленный C_1-C_6 алкил; арил(C_1-C_3)алкил, необязательно замещенный 1 или 2 атомами галогена, C_1-C_3 алкильной группой или C_1-C_3 алкоксигруппой; и в которой

а) когда X означает $C(O)NHCH_2$,

R_c означает гидроксид, аминогруппу, ди(C_1-C_3)-алкиламиногруппу, три(C_1-C_3)алкиламмонийметил, нитрогруппу, трифторметил, нитрил, $CH_3C(O)NH$, CH_3SO_2NH , CH_3SO_2 , $R'R''NSO_2$, где R' и R'' означают H, или линейный или разветвленный C_1-C_6 алкил,

R_d означает H, гидроксид, аминогруппу, ди(C_1-C_3)-алкиламиногруппу, три(C_1-C_3)алкиламмонийметил, нитрогруппу, трифторметил, нитрил, $CH_3C(O)NH$, CH_3SO_2NH , CH_3SO_2 , $R'R''NSO_2$, где R' и R'' имеют значения, указанные выше, при условии, однако, что когда R_a и R_d , оба, означают H и R_b означает изопропил, тогда R_c не означает гидроксид;

б) когда X означает $NHC(O)$,

R_c и R_d , которые могут быть одинаковыми или различными, означают H, гидроксид, C_1-C_3 алкокси, галоген, аминогруппу, ди(C_1-C_3)алкиламиногруппу, три(C_1-C_3)алкиламмонийметил, нитрогруппу, трифторметил, нитрил, $CH_3C(O)NH$, CH_3SO_2NH , CH_3SO_2 , $R'R''NSO_2$, где R' и R'' имеют значения, указанные выше, и его аддитивные соли фармацевтически приемлемых органических и неорганических кислот.

2. Соединение по п. 1, отличающееся тем, что R_a означает H или C_1-C_3 алкил.

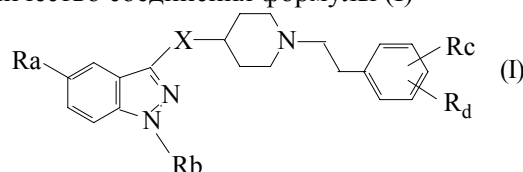
3. Соединение по п. 1 или 2, отличающееся тем, что R_b означает H или C_1-C_3 алкил.

4. Соединение по любому из пп. 1-3, отличающееся тем, что R_c означает H, NO_2 , NH_2 , OH или C_1-C_3 алкокси.

5. Соединение по любому из пп. 1-4, отличающееся тем, что R_d означает H.

6. Аддитивная соль кислоты соединения по любому из пп. 1-5, отличающаяся тем, что кислоту выбирают из группы, включающей щавелевую кислоту, малеиновую кислоту, метансульфокислоту, паратолуолсульфокислоту, янтарную кислоту, лимонную кислоту, винную кислоту, молочную кислоту, соляную кислоту, фосфорную кислоту и серную кислоту.

7. Фармацевтическая композиция для лечения хронической боли, содержащая эффективное количество соединения формулы (I)



где X означает $C(O)NHCH_2$ или $NHC(O)$;

R_a означает H, $NH_2C(O)$, $CH_3C(O)NH$, CH_3SO_2 , CH_3SO_2NH , линейный или разветвленный C_1-C_3 алкил, линейный или разветвленный C_1-C_3 алкокси или галоген;

R_b означает H, линейный или разветвленный C_1-C_6 алкил; арил(C_1-C_3)алкил, необязательно замещенный 1 или 2 атомами галогена, C_1-C_3 алкильной группой или C_1-C_3 алкоксигруппой; и в которой

а) когда X означает $C(O)NHCH_2$,

R_c означает гидроксид, аминогруппу, ди(C_1-C_3)-алкиламиногруппу, три(C_1-C_3)алкиламмонийметил, нитрогруппу, трифторметил, нитрил, $CH_3C(O)NH$, CH_3SO_2NH , CH_3SO_2 , $R'R''NSO_2$, где R' и R'' означают H, или линейный или разветвленный C_1-C_6 алкил,

R_d означает H, гидроксид, аминогруппу, ди(C_1-C_3)-алкиламиногруппу, три(C_1-C_3)алкиламмонийметил, нитрогруппу, трифторметил, нитрил, $CH_3C(O)NH$, CH_3SO_2NH , CH_3SO_2 , $R'R''NSO_2$, где R' и R'' имеют значения, указанные выше, при условии, однако, что когда R_a и R_d , оба, означают H и R_b означает изопропил, тогда R_c не означает гидроксид;

б) когда X означает $NHC(O)$,

R_c и R_d , которые могут быть одинаковыми или различными, означают H, гидроксид, C_1-C_3 алкокси, галоген, аминогруппу, ди(C_1-C_3)алкиламиногруппу, три(C_1-C_3)алкиламмонийметил, нитрогруппу, трифторметил, нитрил, $CH_3C(O)NH$, CH_3SO_2NH , CH_3SO_2 , $R'R''NSO_2$, где R' и R'' имеют значения, указанные выше,

или его фармацевтически приемлемой аддитивной соли органической или неорганической кислоты и по меньшей мере один фармацевтически приемлемый инертный ингредиент.

8. Фармацевтическая композиция по п. 7, отличаясь тем, что она содержит соединение по любому из предыдущих пп. 1-6.

(11) IAP 03632

(13) C

(51) 8 C 07 D 401/00, C 07 D 235/00, C 07 D 215/00, A 61 K 31/415, A 61 P 35/00

(21) IAP 2005 0040

(22) 14.08.2003

(31)(32)(33) 60/406,524, 28.08.2002; 60/417,047, 08.10.2002, US

(71)(73) ПФАЙЗЕР ПРОДАКТС ИНК., US

(72) КАТ, Джон, Чарлз; ЛИССИКАТОС, Джо-зеф, Питер; УОНГ, Хьюйфен, Фэйе, US

(85) 08.02.2005

(86) PCT/IB 03/003634, 14.08.2003

(87) WO 04/020431, 11.03.2004

(54) Антипролифератив агентлар сифатида фойдали бўлган бензимидазолнинг янги хосилалари

Новые производные бензимидазола, полезные в качестве антипролиферативных агентов

(57) 1. Бирикма, куйидагилардан иборат гуруҳдан танланган:

(±)-1-{2-[5-(тетрагидрофуран-3-илокси)-бензимидазол-1-ил]-хинолин-8-ил}-пиперидин-4-иламин;

(+)-1-{2-[5-(тетрагидрофуран-3-илокси)-бензимидазол-1-ил]-хинолин-8-ил}-пиперидин-4-иламин;

(-)-1-{2-[5-(тетрагидрофуран-3-илокси)-бензимидазол-1-ил]-хинолин-8-ил}-пиперидин-4-иламин;

1-{2-[5-(3-метил-оксетан-3-илметокси)-бензимидазол-1-ил]-хинолин-8-ил}-пиперидин-4-иламин;

1-{2-[5-(тетрагидропиран-4-илокси)-бензимидазол-1-ил]-хинолин-8-ил}-пиперидин-4-иламин;

ва

юқорида кўрсатилган бирикмаларнинг фармацевтик мувофиқ тузлари, гидратлари ва сольватларидан.

2. 1-банд бўйича бирикма куйидагидан иборат:

(±)-1-{2-[5-(тетрагидрофуран-3-илокси)-бензимидазол-1-ил]-хинолин-8-ил}-пиперидин-4-иламин,

ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи, гидрат

ёки сольват.

3. 1-банд бўйича бирикма куйидагидан иборат:

(+)-1-{2-[5-(тетрагидрофуран-3-илокси)-бензимидазол-1-ил]-хинолин-8-ил}-пиперидин-4-иламин,

ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи, гидрат

ёки сольват.

4. 1-банд бўйича бирикма куйидагидан иборат:

(-)-1-{2-[5-(тетрагидрофуран-3-илокси)-бензимидазол-1-ил]-хинолин-8-ил}-пиперидин-4-иламин,

ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи, гидрат

ёки сольват.

ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи, гидрат

ёки сольват.

5. 1-банд бўйича бирикма куйидагидан иборат:

1-{2-[5-(3-метил-оксетан-3-илметокси)-

бензимидазол-1-ил]-хинолин-8-ил}-пиперидин-

4-иламин, ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи,

гидрат ёки сольват.

6. 1-банд бўйича бирикма куйидагидан иборат:

1-{2-[5-(тетрагидропиран-4-илокси)-бензимида-

зол-1-ил]-хинолин-8-ил}-пиперидин-4-иламин,

ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи, гидрат

ёки сольват.

7. 1-6-бандларнинг ҳар қайсиси бўйича бирик-

мада, белгиланган туз бензолсульфонат тузидан

иборат.

8. Таркибида 1-7-бандларнинг ҳар қайсиси бўйи-

ча бирикма, ёки унинг фармацевтик мувофиқ

тузи, гидрат ёки сольват ва фармацевтик мувофиқ

ташувчи бўлган хужайранинг аномал ўсишини

даволаш учун фармацевтик композиция, бунда

бирикма, ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи,

гидрат ёки сольват хужайранинг аномал ўсиши-

ни даволаш учун самарали бўлган миқдорда иш-

тирок этади.

9. 1-7-бандларнинг ҳар қайсисида аниқланган

бирикма, ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи,

гидрати ёки сольватининг хужайранинг аномал

ўсишини даволашда самарали миқдорини сут

эмизувчига киритишни ўз ичига олган хужай-

ранинг аномал ўсишини даволаш усули.

10. Митоз ингибиторлари, алкилланувчи агент-

лар, антиметаболитлар, интеркаляцияланувчи

антибиотиклар, ўсиш омили ингибиторлари, ху-

жайра цикли ингибиторлари, ферментлар, топо-

изомераза ингибиторлари, биологик жавоб моди-

фикаторлари, антигормонлар, ангиогенеза ва ан-

тиандрогенлар ингибиторларидан ташкил топган

гуруҳдан танланган шишга қарши агент билан

комбинациядаги 1-7-бандларнинг ҳар қайсисида

аниқланган бирикма, ёки унинг фармацевтик

мувофиқ тузи, гидрати ёки сольватининг терапев-

тик самарали миқдорини сут эмизувчига кири-

тишни ўз ичига олган, ушбу сут эмизувчида гипер-

пролифератив хасталикни даволаш усули.

1. Соединение, выбранное из группы, состоящей из:

(+)-1-{2-[5-(тетрагидрофуран-3-илокси)-бензими-

дазол-1-ил]-хинолин-8-ил}-пиперидин-4-иламина;

(+)-1-{2-[5-(тетрагидрофуран-3-илокси)-бензими-

дазол-1-ил]-хинолин-8-ил}-пиперидин-4-илами-

на;

(-)-1-{2-[5-(тетрагидрофуран-3-илокси)-бензими-

дазол-1-ил]-хинолин-8-ил}-пиперидин-4-иламина;

1- $\{2-[5-(3\text{-метил-оксетан-3-илметокси})\text{-бензимидазол-1-ил}]\text{-хинолин-8-ил}\}$ -пиперидин-4-иламина;

1- $\{2-[5-(\text{тетрагидропиран-4-илокси})\text{-бензимидазол-1-ил}]\text{-хинолин-8-ил}\}$ -пиперидин-4-иламина;

и фармацевтически приемлемых солей, гидратов и сольватов указанных выше соединений.

2. Соединение по п. 1, где указанное соединение представляет собой:
(+)-1- $\{2-[5-(\text{тетрагидрофуран-3-илокси})\text{-бензимидазол-1-ил}]\text{-хинолин-8-ил}\}$ -пиперидин-4-иламин, или его фармацевтически приемлемые соль, гидрат или сольват.

3. Соединение по п. 1, где указанное соединение представляет собой:
(+)-1- $\{2-[5-(\text{тетрагидрофуран-3-илокси})\text{-бензимидазол-1-ил}]\text{-хинолин-8-ил}\}$ -пиперидин-4-иламин, или его фармацевтически приемлемые соль, гидрат или сольват.

4. Соединение по п. 1, где указанное соединение представляет собой:
(-)-1- $\{2-[5-(\text{тетрагидрофуран-3-илокси})\text{-бензимидазол-1-ил}]\text{-хинолин-8-ил}\}$ -пиперидин-4-иламин, или его фармацевтически приемлемые соль, гидрат или сольват.

5. Соединение по п. 1, где указанное соединение представляет собой:
1- $\{2-[5-(3\text{-метил-оксетан-3-илметокси})\text{-бензимидазол-1-ил}]\text{-хинолин-8-ил}\}$ -пиперидин-4-иламин, или его фармацевтически приемлемые соль, гидрат или сольват.

6. Соединение по п. 1, где указанное соединение представляет собой:
1- $\{2-[5-(\text{тетрагидропиран-4-илокси})\text{-бензимидазол-1-ил}]\text{-хинолин-8-ил}\}$ -пиперидин-4-иламин, или его фармацевтически приемлемые соль, гидрат или сольват.

7. Соединение по любому из пп. 1-6, где указанная соль представляет собой бензолсульфонатную соль.

8. Фармацевтическая композиция для лечения аномального клеточного роста, содержащая соединение, как оно определено в любом из пп. 1-7, или его фармацевтически приемлемые соль, гидрат или сольват, и фармацевтически приемлемый носитель, где соединение или его фармацевтически приемлемые соль, гидрат или сольват присутствуют в количестве, которое эффективно в лечении аномального клеточного роста.

9. Способ лечения аномального клеточного роста у млекопитающего, включающий введение указанному млекопитающему такого количества соединения, как оно определено в любом из пп.

1-7, или его фармацевтически приемлемой соли, гидрата или сольвата, которое эффективно в лечении аномального клеточного роста.

10. Способ лечения гиперпролиферативного расстройства у млекопитающего, который включает введение указанному млекопитающему терапевтически эффективного количества соединения, как оно определено в любом из пп. 1-7, или его фармацевтически приемлемой соли, гидрата или сольвата в комбинации с противоопухолевым агентом, выбранным из группы, состоящей из ингибиторов митоза, алкилирующих агентов, антиметаболитов, интеркалирующих антибиотиков, ингибиторов фактора роста, ингибиторов клеточного цикла, ферментов, ингибиторов топоизомеразы, модификаторов биологического ответа, антигормонов, ингибиторов ангиогенеза и антиандрогенов.

(11) IAP 03633

(13) C

(51) 8 C 07 D 401/00, C 07 D 471/00, C 07 D 513/00, C 07 D 453/00, C 07 D 495/00, C 07 D 487/00, A 61 K 31/4523, A 61 P 25/00

(21) IAP 2005 0194

(22) 23.10.2003

(31)(32)(33) 102 50 080.0, 25.10.2002, DE

(71)(73) БЭРИНГЕР ИНГЕЛЬХАЙМ ФАРМА ГМБХ энд КО. КГ, DE

(72) РУДОЛЬФ, Клаус; МЮЛЛЕР, Штефан Георг; ШТЕНКАМП, Дирк; ЛЮСТЕНБЕРГЕР; Филип, ДРЕЙЕР, Александер; БАУЭР, Экхарт; ШИНДЛЕР, Маркус; АРНДТ, Кирштен; ДО-ОДС, Хенри; DE

(85) 25.05.2005

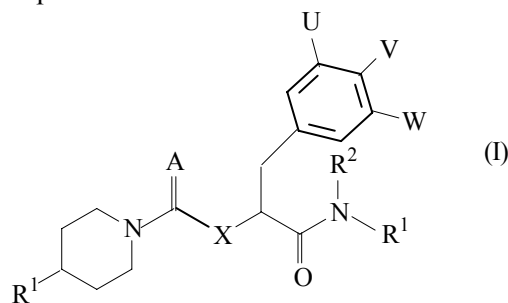
(86) PCT/EP 2003/011762, 23.10.2003

(87) WO 04/037810, 06.05.2004

(54) Танланган CGRP-антагонистлар, уларни олиш усули ва шунингдек, уларни доривор воситалар сифатида қўллаш

Выбранные CGRP-антагонисты, способ их получения, а также их применение в качестве лекарственных средств

(57) 1. (I) умумий формулаинг CGRP-антагонистлари



унда А кислород ёки олтингугурт атоми, фенилсульфонилиминогуруҳи ёки цианиминогуруҳини ифодалайди,

X кислород ёки олтингугурт атоми, C₁-C₆алкил гуруҳи билан алмашилиши шарт бўлмаган иминогоуруҳни ёки C₁-C₆алкилгуруҳи билан алмашилиши шарт бўлмаган метилен гуруҳини ифодалайди,

U C₁-C₆алкил, C₂-C₆алкенил ёки C₂-C₆алкинил гуруҳини ифодалайди, унда ҳар бир метилен гуруҳи 1-2 фтор атоми билан алмашилиши мумкин, ҳар бир метилгуруҳи эса, 1-3 фтор атоми билан алмашилиши мумкин,

V хлор ёки бром атоми, амина-, метиламино- ёки гидроксигуруҳни ифодалайди,

W водород, фтор, хлор, бром ёки йода атоми, дифтор- ёки трифторметил гуруҳини ифодалайди,

R¹ обозначает тўйинган ёки бир марта ёки икки марта тўйинмаган 5-7-аъзоли аза-, диаза-, триаза-, оксаза-, тиаза-, тиadiaза- ёки S,S-диоксидотиadiaзагетероциклни ифодалайди,

бунда юқорида кўрсатилган гетероцикллар углерод ёки азот атоми орқали бириктирилган, азот атоми билан қўшилган битта ёки иккита карбонил ёки тиокарбонил гуруҳини ўз ичига олади, алкил гуруҳи азот атомидан бири бўйича алмашилиши мумкин ва алкил, фенил, фенилметил, нафтил, бифенилил, пиридинил, диазинил, фурил, тиенил, пирролил, 1,3-оксазолил, 1,3-тиазолил, изоксазолил, пиразолил, 1-метилпиразолил, имидазолил ва 1-метилимидазолил гуруҳидан танланган идентик ёки турлича ўринбосарлар билан битта ёки иккита углерод атоми бўйича алмашилиши мумкин, юқорида кўрсатилган тўйинмаган гетероцикллардан бирининг иккиланган олефин боғланиши эса, алкилгуруҳи билан азот атоми бўйича алмашилиши шарт бўлмаган фенил, нафтил, пиридин, диазин, 1,3-оксазол, тиенил, фуран, тиазол, пиррол, N-метилпиррол ёки хиолин ҳалқа билан, 1H-хиолин-2-он ҳалқа ёки имидазол ёки N-метилимидазол ҳалқа билан конденсацияланган, ёки юқорида кўрсатилган тўйинмаган гетероцикллардан бирининг иккиланган олефин боғланиши фенил ҳалқаси конденсацияланиши мумкин,

бунда R¹ нинг таркибида бўлган фенил, пиридинил, диазинил, фурил, тиенил, пирролил, 1,3-оксазолил, 1,3-тиазолил, изоксазолил, пиразолил, 1-метилпиразолил, имидазолил ёки 1-метилимидазолилгуруҳлар, шунингдек бензол, тиен, пиридин ва диазин ҳалқаси билан кондексацияланган гетероцикллар қўшимча равишда фтор, хлор, бром ва йод, алкилгуруҳи, алкоксигуруҳи, нитрогуруҳи, алкилтиогуруҳи, алкилсульфинилгуруҳи, алкилсульфонилгуруҳи, алкилсульфо-ниламиногоуруҳи, фенилгуруҳи, дифторметил

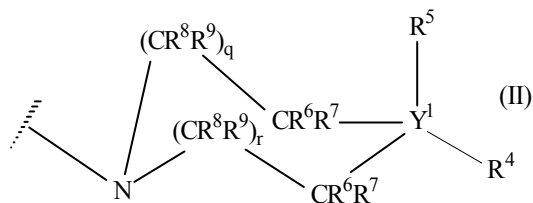
гуруҳи, трифторметилгуруҳи, алкоксикарбонилгуруҳи, карбоксигуруҳи, гидроксигуруҳи, аминогоуруҳи, алкиламиногоуруҳи, диалкиламиногоуруҳи, ацетилгуруҳи, ацетиламиногоуруҳи, пропиониламиногоуруҳи, аминакарбонилгуруҳи, алкиламинокарбонил гуруҳи, диалкиламинокарбонил гуруҳи, (4-морфолинил)карбонилгуруҳи, (1-пирролидинил)карбонилгуруҳи, (1-пиперидинил)карбонилгуруҳи, (гексагидро-1-азепинил)карбонилгуруҳи, (4-метил-1-пиперазинил)карбонил гуруҳи, метилендиоксигуруҳи, аминакарбониламиногоуруҳи, алканоилгуруҳи, цианогруҳи, дифторметоксигуруҳи, трифторметоксигуруҳи, трифторметилтиогуруҳи, трифторметилсульфинилгуруҳи ва трифторметилсульфонилгуруҳи атомларидан танланган бир хил ёки турлича ўринбосарлар билан углерод скелетида бир, -икки, ёки уч алмашилишлари мумкин,

R² водород атомини, фенилметил гуруҳини ёки ω-ҳолатда циклогексилгуруҳи, фенилгуруҳи, пиридинил гуруҳи, диазинилгуруҳи, гидроксигуруҳи, аминогоуруҳи, алкиламиногоуруҳи, диалкиламино гуруҳи, карбоксигуруҳи, алкоксикарбонилгуруҳи, аминакарбонилгуруҳи, аминакарбониламиногоуруҳи, ацетиламиногоуруҳи, 1-пирролидинил гуруҳи, 1-пиперидинилгуруҳи, 4-(1-пиперидинил)-1-пиперидинилгуруҳи, 4-морфолинил гуруҳи, гексагидро-1H-1-азепинил гуруҳи, [бис(2-гидроксиэтил)]аминогоуруҳи, 4-алкил-1-пиперазинил гуруҳи ёки 4-(ω-гидрокси-C₂-C₇алкил)-1-пиперазинилгуруҳи билан алмашилиши мумкин бўлган C₂-C₇алкилгуруҳини, фенил ёки пиридинил гуруҳини ифодалайди,

бунда юқорида кўрсатилган гетероциклик қолдиқлар ва фенил гуруҳлари қўшимча равишда фтор, хлор, бром ва йод, метил гуруҳи, алкокси гуруҳи, дифторметилгуруҳи, трифторметил гуруҳи, гидроксигуруҳи, амина гуруҳи, C₁-C₃алкиламиногоуруҳи, ди(C₁-C₃алкил)амино гуруҳи, ацетиламиногоуруҳи, аминакарбонил гуруҳи, цианогруҳи, метилсульфонилокси гуруҳи, дифторметоксигуруҳи, трифторметоксигуруҳи, трифторметилтиогуруҳи, трифторметилсульфинилгуруҳи, трифторметилсульфонилгуруҳи, амина-C₁-C₃алкилгуруҳи, C₁-C₃алкиламино-C₁-C₃алкилгуруҳи ва ди(C₁-C₃алкил)амино-C₁-C₃алкилгуруҳи атомларидан танланган бир хил ёки турлича ўринбосарлар билан углерод скелетида бир, -икки, ёки уч алмашилишлари мумкин,

R³ водород атоми ёки фенил ёки пиридинил гуруҳи билан алмашилиши шарт бўлмаган C₁-C₃-алкилгуруҳини ифодалайди, бунда ушбу C₁-C₃-алкил гуруҳи R² да иштирок этувчи алкилгуруҳи билан ёки R² да иштирок этувчи фенил ёки пиридил ҳалқаси ва ҳалқа ҳосил қилиб, ўзлари

қўшилган азот атоми билан бирикиши мумкин, ёки R^2 ва R^3 ораларига жойлаштирилган азот атоми билан биргаликда (II) умумий формула қолдирганини ҳосил қиладилар



бунда

Y^1 углерод атомини ифодалайди, ёки қачонки, R^5 электронларнинг эркин электронларини ҳосил қилса, азот атомини ҳам ифодалайди,

q ва r , қачонки, Y^1 углерод атомидан иборат бўлса, 0, 1 ёки 2ни ифодалайдилар ёки

q ва r , қачонки Y^1 азот атомидан иборат бўлса, 0, 1 ёки 2ни ифодалайдилар,

R^4 водород атоми, аминогуруҳ, алкиламиногуруҳ, циклоалкиламиногуруҳ, диалкиламиногуруҳ, N -(циклоалкил)алкиламиногуруҳ, дициклоалкиламиногуруҳ, гидроксигуруҳ, алкилгуруҳ, циклоалкил гуруҳ, амино- C_2 - C_7 алкилгуруҳ, алкиламино- C_2 - C_7 алкилгуруҳ, диалкиламино- C_2 - C_7 алкилгуруҳ, аминоиминометилгуруҳ, алкилкарбонилгуруҳ, алкилсульфонилгуруҳ, алкилкарбониламиногуруҳ, алкилсульфониламиногуруҳ, N -алкилкарбонил- N -алкиламино, N -алкилсульфонил- N -алкиламиногуруҳ, аминакарбониламиногуруҳ, алкиламинокарбониламиногуруҳ, диалкиламинокарбониламиногуруҳ, циклоалкиламинокарбониламиногуруҳ, дициклоалкиламинокарбониламиногуруҳ, фениламинокарбониламиногуруҳ, аминакарбонилалкил гуруҳ, алкиламинокарбонилалкилгуруҳ, диалкиламинокарбонилалкилгуруҳ, аминакарбониламиноалкилгуруҳ, алкоксикарбонилгуруҳ, алкоксикарбонилалкилгуруҳ ёки карбоксиалкилгуруҳни ифодалайди, ёки қачонки, Y^1 азот атомидан иборат бўлмаса, карбоксигуруҳ, аминометилгуруҳ, алкиламинометилгуруҳ ёки диалкиламинометилгуруҳни ҳам ифодалайди ёки фенил, фенил- C_1 - C_3 алкил, пиридинил, диазинил, 1-нафтил, 2-нафтил, пиридинилкарбонил ёки фенилкарбонил гуруҳини ифодалайди, бунда уларинг ҳар бири фтор, хлор, бром ва йод, алкилгуруҳ, алкоксигуруҳ, метилсульфонилоксигуруҳ, дифторметилгуруҳ, трифторметилгуруҳ, гидроксигуруҳ, аминогуруҳ, ацетиламиногуруҳ, аминакарбонилгуруҳ, аминакарбониламиногуруҳ, аминакарбониламинометилгуруҳ, цианогруҳ, карбоксигуруҳ, алкоксикарбонилгуруҳ, карбоксиалкил гуруҳ, алкоксикарбонилалкилгуруҳ, алканоилгуруҳ, ω -(диал-

киламино)алканоилгуруҳ, ω -(диалкиламино)алкилгуруҳ, ω -(диалкиламино)гидроксикарбонилгуруҳ, ω -(карбокси)алканоилгуруҳ, дифторметоксигуруҳ, трифторметоксигуруҳ, трифторметилтиогуруҳ, трифторметилсульфинилгуруҳ ва трифторметилсульфонил, тўйинган ёки бир-ёки кўп марта тўйинмаган 4-10-аъзоли азациклоалкил гуруҳ, 5-10-аъзоли оксаза-, тиаза-, диаза- ёки триазациклоалкил гуруҳ, 6-10-аъзоли азабицикло-ёки диазабициклоалкил гуруҳ, 1-алкил-4-пиперидинилкарбонил ёки 4-алкил-1-пиперазинилкарбонилгуруҳ, 1-алкил-4-пиперидиниламиногуруҳ, 1-алкил-4-пиперидиниламинокарбонилгуруҳ ёки 1-алкил-4-пиперидиниламиносульфонил гуруҳ атомларидан танланган бир хил ёки турлича ўринбосарлар билан углерод скелетида бир-, икки, ёки учалмашилган бўлиши мумкин, бунда юқорида кўрсатилган моно- ва бициклик гетероцикллар азот ёки углерод атоми орқали бириктирилган,

юқорида кўрсатилган моно- ва бициклик гетероцикллардаги метилен гуруҳи карбонил ёки сульфони гуруҳлари билан алмаштирилиши мумкин,

юқорида кўрсатилган моно- ва бициклик гетероциклларда азот, кислород ёки олтингугурт атоми билан бевосита боғланмаган метилен гуруҳи битта ёки иккита фтор атоми билан алмашилиши мумкин,

юқорида кўрсатилган моно- ва бициклик гетероцикллар, шунингдек 1-алкил-4-пиперидинилкарбонил ва 4-алкил-1-пиперазинилкарбонил гуруҳи C_1 - C_7 алкилгуруҳи билан ҳалқада битта ёки кўп алмашилишлари мумкин ва/ёки бензилгуруҳи, алканоилгуруҳи, диалкиламиногуруҳи, фенилкарбонилгуруҳи, пиридинилкарбонил гуруҳи, карбоксигуруҳи, карбоксиалканоил гуруҳи, карбоксиалкилгуруҳи, алкоксикарбонилалкилгуруҳи, алкоксикарбонилгуруҳи, аминакарбонилгуруҳи, алкиламинокарбонилгуруҳи, алкилсульфонилгуруҳи, циклоалкилгуруҳи ёки циклоалкилалкил гуруҳи ёки ҳалқада алмашилиши шарт бўлмаган алкил, циклоалкилкарбонил, азациклоалкилкарбонил, диазациклоалкилкарбонил ёки оксазациклоалкилкарбонилгуруҳи билан ҳалқада биралмашилган,

бунда ушбу ўринбосарлар таркибидаги алициклик фрагментлар имеют 3-10 ҳалқали аъзоларга эга, гетероалициклик фрагментлар эса, 4-10 ҳалқали аъзоларга эга ва

юқорида қайд этилган қолдиқлардаги фенил ва пиридинил қолдиқлар ўз навбатида фтор, хлор, бром ва йод, алкилгуруҳи, алкоксигуруҳи, метилсульфонилоксигуруҳи, дифторметилгуруҳи, трифторметилгуруҳи, гидроксигуруҳи, амин-

гуруҳи, ацетиламиногуруҳи, аминокарбонил гуруҳи, аминокарбониламиногуруҳи, аминокарбониламинометилгуруҳи, цианогруҳи, карбоксигуруҳи, алкоксикарбонилгуруҳи, карбоксиалкилгуруҳи, алкоксикарбонилалкилгуруҳи, алканоилгуруҳи, ω -(диалкиламино)алканоилгуруҳи, ω -(карбокси)алканоилгуруҳи, дифторметоксигуруҳи, трифторметоксигуруҳи, трифторметилтиогуруҳи, трифторметилсульфинил гуруҳи ва трифторметилсульфонилгуруҳи атомларидан танланган бир хил ёки турли хил ўринбосарлар билан бир-, икки, ёки уч алмашилишлари мумкин,

R^5 водород атомини,

C_1 - C_4 алкил қолдиғини билдиради, бунда тармоқланмаган алкил қолдиғи ω -ҳолатида фенил гуруҳи, пиридинил гуруҳи, диазинил гуруҳи, аминокуруҳи, алкиламиногуруҳи, диалкиламиногуруҳи, 1-пирролидинилгуруҳи, 1-пиперидинил гуруҳи, 4-метил-1-пиперазинил гуруҳи, 4-морфолинил гуруҳи ёки гексагидро-1Н-1-азепинил гуруҳи билан алмашилиши мумкин,

алкоксикарбонил гуруҳи, цианогруҳи ёки аминокарбонил гуруҳини билдиради ёки эса, қачонки, Y^1 азот атомидан иборат бўлса, унда бир жуфт эркин электронларни ҳам англатади, ёки қачонки, Y^1 азот атомидан иборат бўлмаса, унда фтор атомини ҳам билдиради ёки

R^4 ва R^5 биргаликда қачонки, Y^1 углерод атомидан иборат бўлса, 4-7-аззоли циклоалифатик ҳалқани билдириб, ушбу ҳалқада битта ёки иккита метилен гуруҳлари -NH- ёки -N(алкил)- гуруҳига алмаштирилиши мумкин ва бир ёки иккита бошқа метиленгуруҳлари битта, мос равишда иккита карбонилгуруҳига алмаштирилиши мумкин, бунда юқорида қайд этилган R^4 гуруҳидаги азот атомига қўшилган водород атоми химоя гуруҳига алмаштирилиши мумкин,

R^6 ва R^7 бир хил ёки турли кўрсаткичларга эга бўлишлари мумкин ва уларнинг ҳар бири водород атоми, C_1 - C_3 алкилгуруҳи ёки диалкиламиногуруҳини билдиради, ёки қачонки, Y^1 азот атомидан иборат бўлмаса, фтор атомини ҳам билдиради ва

R^8 ва R^9 бир хил ёки турли кўрсаткичларга эга бўлишлари мумкин ва уларнинг ҳар бири водород атоми, C_1 - C_3 алкил гуруҳи, карбоксигуруҳи ёки C_1 - C_3 алкоксикарбонил гуруҳини билдиради, бунда ҳамма юқорида қайд этилган алкил гуруҳлари ва алкоксигуруҳлари, шунингдек бошқа юқорида қайд этилган қолдикларда иштирок этувчи алкил гуруҳлар, бошқа нарса кўрсатилмаган бўлса, 1дан 7гача углерод атомларини ўз ичига олади ва тармоқланган ва тармоқланмаган бўлишлари мумкин, бунда ҳар бир метиленгуру-

ҳи 1-2 фтор атомлари билан алмашилишлари мумкин, ҳар бир метилгуруҳи эса, 1-3 фтор атомлари билан алмашилишлари мумкин, бунда барча юқорида қайд этилган циклоалкил гуруҳлари, шунингдек бошқа юқорида қайд этилган қолдикларда иштирок этувчи циклоалкилгуруҳлар, бошқа нарса кўрсатилмаган бўлса, 3дан 10гача углерод атомларини ўз ичига олади, бунда ҳар бир метилен гуруҳи 1-2 фтор атомлари билан алмашилишлари мумкин ва

барча юқорида қайд этилган ароматик ва гетероароматик қолдиклар қўшимча равишда фтор, хлор ва бром, цианогруҳ ва гидроксигуруҳ атомларидан танланган бир хил ёки турлича ўринбосарлар билан бир-, икки- ёки учалмашилишлари мумкин,

уларнинг таутомерлари, уларнинг диастереомерлари, уларнинг энантиомерлари, уларнинг гидратлари, уларнинг аралашмалари ва уларнинг тузлари, шунингдек тузларнинг гидратлари.

2. 1-банд бўйича (I) умумий формуланинг бирикмалари, унда

A, U, V, W, X, R^2 ва R^3 1-бандда қайд этилган кўрсаткичларга эга,

R^1 эса, бир марта ёки икки марта тўйинмаган 5-7-аззоли аза-, диаза-, триаза- ёки тиазагетероцикли билдиради,

бунда барча юқорида қайд этилган гетероцикллар углерод ёки азот атоми орқали бириктирилган, азот атоми билан қўшилган битта ёки иккита карбонил гуруҳини ўз ичига олади, ва биттадан углерод атоми бўйича фенил, пиридинил, диазинил, тиенил, пирролил, 1,3-тиазолил, изоксазолил, пиразолил ёки 1-метилпиразолил гуруҳи билан алмашилишлари мумкин, юқорида қайд этилган гетероцикллардан бирининг олефинли иккиланган боғланиши эса, фенил, нафтил, пиридин, диазин, тиенил ёки хинолинли ҳалқа ёки битта метил гуруҳининг азот атоми бўйича алмашилиши шарт бўлмаган 1Н-хинолин-2-онли ҳалқа билан конденсацияланган,

бунда R^1 нинг таркибидаги фенил, пиридинил, диазинил, тиенил, пирролил, 1,3-тиазолил, изоксазолил, пиразолил ёки 1-метилпиразолилгуруҳлари, шунингдек бензолли, пиридинли ва диазинли ҳалқа билан конденсацияланган гетероцикллар қўшимча равишда фтор, хлор, бром ва йод атомлари, алкилгуруҳи, алкоксигуруҳи, нитрогуруҳи, дифторметилгуруҳи, трифторметил гуруҳи, гидроксигуруҳи, аминугуруҳи, алкиламиногуруҳи, диалкиламиногуруҳи, ацетиламиногуруҳи, ацетилгуруҳи, цианогруҳи, дифторметоксигуруҳи ва трифторметоксигуруҳидан танланган бир хил ёки турлича ўринбосарлар билан углерод скелетида бир, икки-, ёки учалмашилишлари мумкин,

бунда ҳамма юқорида қайд этилган алкилгурухлари, шунингдек бошқа юқорида қайд этилган қолдиқларда иштирок этувчи алкилгурухлар, бошқа нарса кўрсатилмаган бўлса, 1дан 7 гача углерод атомларини ўз ичига олади ва тармоқланган ва тармоқланмаган бўлишлари мумкин, бунда ҳар бир метиленгуруҳи 1-2 фтор атомлари билан алмашилишлари мумкин, ҳар бир метилгуруҳи эса, 1-3 фтор атомлари билан алмашилишлари мумкин ва

юқорида қайд этилган ароматик ва гетероароматик қолдиқлар қўшимча равишда фтор, хлор ва бром атомлари, цианогруҳи ва гидроксигруҳидан танланган бир хил ёки турлича ўринбосарлар билан бир-, икки, ёки учалмашилишлари мумкин, уларнинг таутомерлари, уларнинг диастереомерлари, уларнинг энантиомерлари, уларнинг аралашмалари ва уларнинг тузлари.

3. 1-банд бўйича (I) умумий формуланинг бирикмалари

A, U, V, W, X, R² ва R³ 1-бандда қайд этилган кўрсаткичларга эга,

R¹ эса, бир қарра тўйинмаган 5-7-аъзоли диазаёки триазагетероциклни билдиради,

бунда юқорида қайд этилган гетероцикллар азот атоми орқали бириктирилган, азот атоми билан қўшилган карбонилгуруҳини ўз ичига олади, ва қўшимча равишда биттадан углерод атоми бўйича фенилгуруҳи билан алмашилишлари мумкин, юқорида қайд этилган гетероцикллардан бирининг олефинли иккиланган боғланиши эса, фенил, тиенил ёки хинолинли ҳалқа билан конденсацияланган бўлиши мумкин,

бунда R¹ таркибидаги фенилгуруҳлари, шунингдек бензолли ҳалқа билан конденсацияланган гетероцикллар қўшимча равишда фтор, хлор, бром ва йод, метилгуруҳи, метоксигуруҳи, нитрогуруҳи, дифторметил гуруҳи, трифторметил гуруҳи, гидроксигуруҳи, аминогруҳи, алкиламиногруҳи, диалкиламиногруҳи, ацетиламиногруҳи, ацетилгуруҳи, цианогруҳи, дифторметоксигуруҳи ва трифторметоксигуруҳи атомларидан танланган бир хил ёки турлича ўринбосарлар билан углерод скелетида бир-, икки- ёки учалмашилган бўлиб, асосан, бироқ, фтор, хлор ёки бром атоми, метилгуруҳи ёки метоксигуруҳи билан алмашилмаганлар ёки биралмашилгандирлар,

бунда ҳамма юқорида қайд этилган алкилгуруҳлари, шунингдек бошқа юқорида қайд этилган қолдиқларда иштирок этувчи алкилгуруҳлар, бошқа нарса кўрсатилмаган бўлса, 1 дан 7 гача углерод атомларини ўз ичига олади ва тармоқланган ва тармоқланмаган бўлишлари мумкин,

юқорида қайд этилган ароматик ва гетероароматик қолдиқлар қўшимча равишда фтор, хлор ва бром атомлари, цианогруҳи ва гидроксигруҳидан танланган бир хил ёки турлича ўринбосарлар билан бир-, икки, ёки учалмашилишлари мумкин,

уларнинг таутомерлари, уларнинг диастереомерлари, уларнинг энантиомерлари, уларнинг аралашмалари ва уларнинг тузлари.

4. 1-банд бўйича (I) умумий формуланинг бирикмалари

A, U, V, W, X, R² ва R³ 1-бандда қайд этилган кўрсаткичларга эга,

R¹ 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-илли, 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-илли, 4-(5-оксо-3-фенил-4,5-дигидро-1,2,4-триазол-1-ил)пиперидин-1-илли, 4-(2-оксо-1,2-дигидроимидазо[4,5-с]хинолин-3-ил)пиперидин-1-илли, 4-(2-оксо-1,2-дигидро-4Н-тиено[3,4-d]пиримидин-3-ил)пиперидин-1-илли, 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-тиено[3,2-d]пиримидин-3-ил)пиперидин-1-илли, 4-(5-оксо-4,5,7,8-тетрагидро-2-тиа-4,6-диазазулен-6-ил)пиперидин-1-илли, 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидротииено[3,2-d]-1,3-диазепин-3-ил)пиперидин-1-илли, 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидротииено[2,3-d]-1,3-диазепин-3-ил)пиперидин-1-илли или 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-тиено[2,3-d]пиримидин-3-ил)пиперидин-1-илли гуруҳни билдиради, бунда юқорида қайд этилган моно- ва бициклик гетероцикллар қўшимча равишда углерод скелетида метоксигуруҳ билан биралмашилиши мумкин,

бунда юқорида қайд этилган ароматик ва гетероароматик қолдиқлар қўшимча равишда фтор, хлор ва бром атомлари, цианогруҳи ва гидроксигруҳидан танланган бир хил ёки турлича ўринбосарлар билан бир-, икки, ёки учалмашилишлари мумкин,

уларнинг таутомерлари, уларнинг диастереомерлари, уларнинг энантиомерлари, уларнинг аралашмалари ва уларнинг тузлари.

5. 1-банд бўйича (I) умумий формуланинг бирикмалари, унда

A, U, V, W, X, R² ва R³ 1-бандда қайд этилган кўрсаткичларга эга,

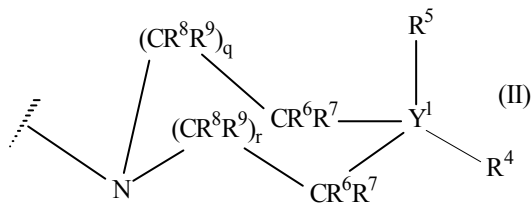
R² водород атомини ёки

фенилметилли гуруҳни ёки, ω-ҳолатида фенил гуруҳи, пиридинилгуруҳи, гидроксигуруҳи, аминогруҳи, алкиламиногруҳи, диалкиламиногруҳи, карбоксигуруҳи, алкоксикарбонил гуруҳи, аминакарбонилгуруҳи, аминакарбониламиногруҳи, ацетиламиногруҳи, 1-пирролидинил гуруҳи, 1-пиперидинилгуруҳи, 4-морфолинил гуруҳи ёки [бис(2-гидроксиэтил)]аминогруҳи билан

алмашилиши мумкин бўлган C₂-C₇алкилли гуруҳни билдиради,

бунда юқорида қайд этилган гетероциклик қолдиқлар ва фенилгуруҳлари қўшимча равишда фтор, хлор, бром ва йод, метилгуруҳи, алкоксигуруҳи, дифторметил гуруҳи, трифторметил гуруҳи, гидроксигуруҳи, аминугуруҳи, C₁-C₃алкиламинугуруҳи, ди(C₁-C₃алкил)аминугуруҳи, ацетиламинугуруҳи, аминарбонил гуруҳи, цианогуруҳи, дифторметоксигуруҳи, трифторметоксигуруҳи, амино-C₁-C₃алкил гуруҳи, C₁-C₃алкиламино-C₁-C₃алкилгуруҳи ва ди(C₁-C₃алкил)амино-C₁-C₃алкил гуруҳи атомларидан танланган бир хил ёки турлича ўринбосарлар билан углерод скелетида бир-, икки, ёки учалмашилишлари мумкин,

R³ водорода атоми ёки C₁-C₃алкиллигуруҳни билдиради, бунда ушбу C₁-C₃алкилгуруҳи 5-7-аъзоли ҳалқа ҳосил қилиб, R² да иштирок этувчи алкилгуруҳи ёки R² да иштирок этувчи фенил ёки пиридил ҳалқаси ва ўзлари қўшилган азот атоми билан бириктирилиши мумкин, ёки R² ва R³ ораларига жойлаштирилган азот атоми билан биргаликда (II) умумий формула қолдигини ҳосил қиладилар,



бунда Y¹ углерод атомини ифодалайди, ёки қачонки, R⁵ бир жуфт эркин электронларини ҳосил қилса, азот атомини ҳам ифодалайди,

q ва r, қачонки, Y¹ углерод атомидан иборат бўлса, 0 ёки 1 ни ифодалайдилар ёки

q ва r, қачонки Y¹ азот атомидан иборат бўлса, 1 ёки 2 ни ифодалайдилар,

R⁴ водород атомини, гидроксигуруҳни, аминугуруҳни, алкиламинугуруҳни, C₃-C₆циклоалкиламинугуруҳни, N-(C₃-C₆циклоалкил)алкиламинугуруҳни, диалкиламинугуруҳни, алкилли гуруҳни, трифторметилли гуруҳни, C₃-C₆циклоалкилли гуруҳни, диалкиламино-C₂-C₇алкилли гуруҳни, карбоксиалкилли гуруҳни, алкоксикарбонилалкиллигуруҳни, алкилсульфонилли гуруҳни, алкилсульфониламинугуруҳни ёки N-(алкилсульфонил)алкиламинугуруҳни билдиради, ёки қачонки, Y¹ азот атомидан иборат бўлмаса, шунингдек карбоксигуруҳни ёки диалкиламинометиллигуруҳни билдиради ёки уларнинг ҳар бири фтор, хлор ёки бром атоми, трифторметилкарбонил гуруҳи, метилгуруҳи ёки метоксигуруҳи билан алмашилиши мумкин бўлган фенилли, фенил-C₁-C₃алкилли, пиридинилли или ди-

азинилли гуруҳни, тўйинган ёки бир- ёки кўп марта тўйинмаган 4-7-аъзоли азацicloалкилли гуруҳни, 5-7-аъзоли оксаза-, диаза- ёки триазацicloалкилли гуруҳни, 7-9-аъзоли азабицикло-ёки диазабициклоалкиллигуруҳни, 1-алкил-4-пиперидиниламинугуруҳни ёки 1-алкил-4-пиперидиниламиносульфонилли гуруҳни билдиради, бунда юқорида кўрсатилган моно- ва бициклик гетероцикллар азот ёки углерод атоми орқали бириктирилган,

юқорида кўрсатилган моно- ва бициклик гетероцикллардаги метиленгуруҳи карбонил ёки сульфонили гуруҳлари билан алмаштирилиши мумкин,

юқорида кўрсатилган моно- ва бициклик гетероциклларда азот, кислород ёки олтингугурт атоми билан бевосита боғланмаган метиленгуруҳи битта ёки иккита фтор атоми билан алмашилиши мумкин,

юқорида кўрсатилган моно- ва бициклик гетероцикллар ҳар бир метилен гуруҳи 1-2 фтор атомлари билан алмашилиши мумкин бўлган, ҳар бир метилгуруҳи эса, 1-3 фтор атомлари алмашилиши мумкин бўлган битта ёки иккита C₁-C₃алкил гуруҳлари билан алмашилишлари мумкин, ва/ёки C₃-C₆циклоалкил-C₁-C₃алкилгуруҳи, бензилгуруҳи, C₁-C₄алканоилгуруҳи, ди(C₁-C₃алкил)аминугуруҳи, C₁-C₃алкилсульфонил гуруҳи, алкоксикарбонилгуруҳи, бензилоксикарбонил гуруҳи, алкоксикарбонилалкил гуруҳи, карбоксигуруҳи ёки карбоксиалкил гуруҳи билан алмашилишлари мумкин,

R⁵ водород атоми, C₁-C₃алкилли гуруҳни ёки алкоксикарбонилли гуруҳни билдиради, ёки қачонки Y¹ азот атомидан иборат бўлса, унда шунингдек бир жуфт эркин электронларни билдиради ёки

R⁴ ва R⁵ биргаликда, қачонки Y¹ углерод атомидан иборат бўлса, 5-6-аъзоли циклоалифатик ҳалқани билдирадилар, ушбу ҳалқада битта ёки иккита метилен гуруҳи -NH- или -N(метил)- гуруҳи билан алмаштирилишлари мумкин, битта ёки иккита бошқа метилен гуруҳи эса, битта, мос равишда иккита карбонил гуруҳига алмаштирилишлари мумкин,

R⁶ ва R⁷ бир хил ёки турли кўрсаткичларга эга бўлишлари мумкин, ва уларнинг ҳар бири водород атоми, C₁-C₃алкиллигуруҳни ёки ди(C₁-C₃алкил)аминугуруҳни билдиради ва

R⁸ ва R⁹ бир хил ёки турли кўрсаткичларга эга бўлишлари мумкин, ва уларнинг ҳар бири водород атоми, C₁-C₃алкиллигуруҳни, карбоксигуруҳни ёки C₁-C₃алкоксикарбониллигуруҳни билдиради,

бунда ҳамма юқорида қайд этилган алкил гуруҳлари, шунингдек бошқа юқорида қайд этилган

ни или 4-(2,2,2-трифторэтил)пиперазин-1-илли гуруҳни билдиради,

R^5 водород атоми, метилли гуруҳни билдиради, ёки эса, қачонки, Y^1 азот атомидан иборат бўлса, бир жуфт эркин электронларни ҳам билдиради ёки

R^4 ва R^5 биргаликда, Y^1 углерод атомидан иборат бўлганда, означают 1-метилпиперидин-4-илиден, циклогексилден ёки имидазолидин-2,4-дион-5-илиден гуруҳни билдиради,

R^6 ва R^7 ларнинг ҳар бири водород атоми ёки диметиламиногуруҳни билдиради ва

R^8 ва R^9 ларнинг ҳар бири водород атоми, карбоксигуруҳни ёки этоксикарбонилли гуруҳни билдиради,

бунда ҳамма юқорида қайд этилган алкил гуруҳлари, шунингдек бошқа қолдиқларда иштирок этувчи алкил гуруҳлар, бошқа нарса кўрсатилмаган бўлса, 1 дан 7 гача углерод атомларини ўз ичига олади ва тармоқланган ва тармоқланмаган бўлишлари мумкин, юқорида қайд этилган ароматик ва гетероароматик қолдиқлар эса, қўшимча равишда фтор, хлор ва бром атомлари, цианогуруҳи ва гидроксигуруҳидан танланган бир хил ёки турлича ўринбосарлар билан бир-, икки, ёки учалмашилишлари мумкин,

уларнинг таутомерлари, уларнинг диастереомерлари, уларнинг энантиомерлари, уларнинг аралашмалари ва уларнинг тузлари.

7. 1-банд бўйича (I) умумий формуланинг бирикмалари, унда

A кислород атомини, цианиминогуруҳни ёки фенилсульфонилиминогуруҳни билдиради,

X кислород атомини, иминогуруҳни ёки метилен гуруҳни билдиради,

U тармоқланмаган C_1 - C_6 алкилли, C_2 - C_6 алкенилли ёки ҳар бир метилен гуруҳи 1-2 фтор атоми билан алмашилиши мумкин бўлган, метил гуруҳи эса, 1-3 фтор атоми билан алмашилиши мумкин бўлган C_2 - C_6 алкинилли гуруҳни билдиради,

V аминогуруҳни ёки гидроксигуруҳни билдиради,

W водород, хлор ёки бром атоми ёки трифторметилли гуруҳни билдиради,

R^1 бир марта тўйинмаган 5-7-аъзоли диаза- ёки триазагетероциклни билдиради,

бунда юқорида қайд этилган гетероцикллар азот атоми орқали бириктирилган, азот атоми билан бириккан карбонилли гуруҳни ўз ичига олади, ва қўшимча равишда битта углерод атомидан фенил гуруҳи билан алмашилишлари мумкин, юқорида қайд этилган тўйинмаган гетероцикллардан бирининг иккиланган олефинли боғланиши фенилли, тиенилли ёки хинолинли ҳалқа билан конденсацияланиши мумкин,

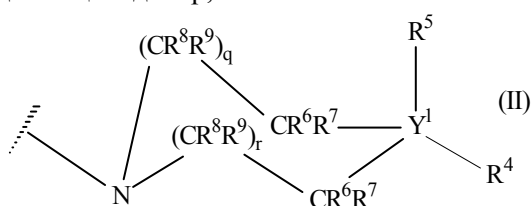
бунда R^1 таркибидаги фенилгуруҳлари, шунингдек бензол билан конденсацияланган гетероцикллар фтор, хлор, бром ва йод атомлари, метил гуруҳи, метоксигуруҳи, нитрогуруҳи, дифторметил гуруҳи, трифторметил гуруҳи, гидроксигуруҳи, аминогуруҳи, алкиламиногуруҳи, диалкиламиногуруҳи, ацетиламиногуруҳи, ацетил гуруҳи, цианогуруҳи, дифторметоксигуруҳи ва трифторметоксигуруҳидан танланган бир хил ёки турлича ўринбосарлар билан углерод скелетида бир-, икки, ёки учалмашилишлари мумкин, асосан, бироқ, фтор, хлор ёки бром атоми, метил гуруҳи ёки метоксигуруҳи билан алмашилмаган ёки биралмашилгандирлар,

R^2 водород атоми ёки фенилметилли гуруҳни ёки фенил гуруҳи, пиридинил гуруҳи, гидроксигуруҳи, аминогуруҳи, алкиламиногуруҳи, диалкиламиногуруҳи, алкоксикарбонил гуруҳи, карбоксигуруҳи, аминакарбонил гуруҳи, аминакарбониламиногуруҳи, ацетиламиногуруҳи, 1-пирролидинил гуруҳи, 1-пиперидинил гуруҳи, 4-морфолинил гуруҳи ёки [бис-(2-гидроксиэтил)]аминогуруҳи билан ҳолатда алмашилиши мумкин бўлган C_2 - C_7 алкилли гуруҳни билдиради,

бунда юқорида қайд этилган гетероциклик қолдиқлар ва фенил гуруҳлари қўшимча равишда фтор, хлор, бром ва йод атомлари, метил гуруҳи, алкоксигуруҳи, дифторметилгуруҳи, трифторметилгуруҳи, гидроксигуруҳи, аминогуруҳи, C_1 - C_3 алкиламиногуруҳи, ди(C_1 - C_3 алкил)аминогуруҳи, ацетиламиногуруҳи, аминакарбонил гуруҳи, цианогуруҳи, дифторметоксигуруҳи, трифторметоксигуруҳи, амина- C_1 - C_3 алкил гуруҳи, C_1 - C_3 алкиламино- C_1 - C_3 алкилгуруҳи ва ди(C_1 - C_3 алкил)амино- C_1 - C_3 алкилгуруҳидан танланган бир хил ёки турлича ўринбосарлар билан углерод скелетида бир-, икки, ёки учалмашилишлари мумкин,

R^3 водорода атоми ёки C_1 - C_3 алкилли гуруҳни билдиради, бунда ушбу C_1 - C_3 алкилгуруҳи 5-7-аъзоли ҳалқа ҳосил қилиб, R^2 да иштирок этувчи алкил гуруҳи ёки R^2 да иштирок этувчи фенилли ёки пиридилли ҳалқа ва ўзлари қўшилган азот атоми билан бирикиши мумкин, ёки

R^2 ва R^3 ораларига жойлаштирилган азот атоми билан биргаликда (II) умумий формула қолдиғини ҳосил қиладилар,



бунда Y^1 углерод атомини ифодалайди, ёки қачонки, R^5 бир жуфт эркин электронларини ҳосил қилса, азот атомини ҳам ифодалайди,

q ва r , қачонки, Y^1 углерод атомидан иборат бўлса, 0, ёки 1 рақамни ифодалайдилар ёки

q ва r , қачонки Y^1 азот атомидан иборат бўлса, 1 ёки 2 рақамни ифодалайдилар,

R^4 водород атоми, гидроксигуруҳни, аминогуруҳни, алкиламиногуруҳни, C_3 - C_6 циклоалкиламиногуруҳни, N -(C_3 - C_6 циклоалкил)алкиламиногуруҳни, диалкиламиногуруҳни, алкилли гуруҳни, трифторметилли гуруҳни, C_3 - C_6 циклоалкилли гуруҳни, диалкиламино- C_2 - C_7 алкилли гуруҳни, карбоксиалкилли гуруҳни, алкоксикарбонилалкилли гуруҳни, алкилсульфонилли гуруҳни, алкилсульфониламиногуруҳни ёки N -(алкилсульфонил)алкиламиногуруҳни билдиради, ёки эса, Y^1 азот атомидан иборат бўлмаса, карбоксигуруҳни ёки диалкиламинотетилли гуруҳни ҳам билдиради ёки, ҳар бири фтор, хлор ёки бром атоми, трифторметилкарбонил гуруҳи, метил гуруҳи ёки метоксигуруҳи билан алмашилиши мумкин бўлган, фенилли, фенил- C_1 - C_3 алкилли, пиридинилли ёки диазинилли гуруҳни, тўйинган ёки бир- ёки кўп марта тўйинмаган 4-7-аъзоли азацклоалкилли гуруҳни, 5-7-аъзоли оксаза-, диаза- ёки триазацклоалкилли гуруҳни, 7-9-аъзоли азабицкло- ёки диазабицклоалкилли гуруҳни, 1-алкил-4-пиперидиниламиногуруҳни ёки 1-алкил-4-пиперидиниланосульфонилли гуруҳни билдиради,

бунда юқорида кўрсатилган моно- ва бициклик гетероцикллар азот ёки углерод атоми орқали бириктирилган,

юқорида кўрсатилган моно- ва бициклик гетероцикллардаги метилен гуруҳи карбонил ёки сульфонили гуруҳлари билан алмаштирилиши мумкин,

юқорида кўрсатилган моно- ва бициклик гетероциклларда азот, кислород ёки олтингургурт атоми билан бевосита боғланмаган метилен гуруҳи битта ёки иккита фтор атоми билан алмашилиши мумкин,

юқорида кўрсатилган моно- ва бициклик гетероцикллар ҳар бир метиленгуруҳи 1-2 фтор атомлари билан алмашилиши мумкин бўлган, ҳар бир метил гуруҳи эса, 1-3 фтор атомлари алмашилиши мумкин бўлган битта ёки иккита C_1 - C_3 алкилгуруҳлари билан алмашилишлари мумкин, ва/ёки C_3 - C_6 циклоалкил- C_1 - C_3 алкилгуруҳи, бензил гуруҳи, C_1 - C_4 алканоилгуруҳи, ди(C_1 - C_3 алкил)аминогуруҳи, C_1 - C_3 алкилсульфонил гуруҳи, алкоксикарбонилгуруҳи, бензилоксикарбонилгуруҳи, алкоксикарбонилалкилгуруҳи, карбоксигуруҳи ёки карбоксиалкил гуруҳи билан алмашилишлари мумкин,

R^5 водород атоми, C_1 - C_3 алкилли гуруҳни ёки алкоксикарбонилли гуруҳни билдиради, ёки қачонки Y^1 азот атомидан иборат бўлса, унда бир жуфт эркин электронларни ҳам билдиради ёки

R^4 ва R^5 биргаликда, қачонки Y^1 углерод атомидан иборат бўлса, 5-6-аъзоли циклоалифатик ҳалқани билдирадилар, ушбу ҳалқада битта ёки иккита метиленгуруҳи -NH- или -N(метил)- гуруҳи билан алмаштирилишлари мумкин, битта ёки иккита бошқа метиленгуруҳи эса, битта, мос равишда иккита карбонилгуруҳига алмаштирилишлари мумкин,

R^6 ва R^7 бир хил ёки турли кўрсаткичларга эга бўлишлари мумкин, ва уларнинг ҳар бири водород атоми, C_1 - C_3 алкиллигуруҳни ёки ди(C_1 - C_3 алкил)аминогуруҳни билдиради ва

R^8 ва R^9 бир хил ёки турли кўрсаткичларга эга бўлишлари мумкин, ва уларнинг ҳар бири водород атоми, C_1 - C_3 алкилли гуруҳни, карбоксигуруҳни ёки C_1 - C_3 алкоксикарбонилли гуруҳни билдиради,

бунда ҳамма юқорида қайд этилган алкил гуруҳлари, шунингдек бошқа юқорида қайд этилган қолдиқларда иштирок этувчи алкил гуруҳлар, бошқа нарса кўрсатилмаган бўлса, 1 дан 7 гача углерод атомларини ўз ичига олади ва тармоқланган ва тармоқланмаган бўлишлари мумкин, юқорида қайд этилган ароматик ва гетероароматик қолдиқлар эса, кўшимча равишда фтор, хлор ва бром атомлари, цианогуруҳи ва гидроксигуруҳидан танланган бир хил ёки турлича ўринбосарлар билан бир-, икки, ёки учалмашилишлари мумкин,

уларнинг таутомерлари, уларнинг диастереомерлари, уларнинг энантиомерлари, уларнинг арашмалари ва уларнинг тузлари.

8. 1-банд бўйича (I) умумий формуланинг бирикмалари, унда

A кислород атомини билдиради,

X кислород атомини, иминогуруҳни ёки метилен гуруҳни билдиради,

U ҳар бир метилен гуруҳи 1-2 фтор атоми билан алмашилиши мумкин бўлган, метил гуруҳи эса, 1-3 фтор атоми билан алмашилиши мумкин бўлган метилли, этилли, C_2 - C_4 алкенилли ёки C_2 - C_{40} алкинилли гуруҳни билдиради,

V аминогуруҳни ёки гидроксигуруҳни билдиради,

W водород, хлор ёки бром атоми ёки трифторметилли гуруҳни билдиради,

R^1 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-илли, 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2H-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-илли, 4-(5-оксо-3-фенил-4,5-дигидро-1,2,4-триазол-1-ил)пиперидин-1-илли, 4-(2-оксо-1,2-дигидроимидазо[4,5-c]хинолин-3-ил)пиперидин-1-илли, 4-(2-ок-

со-1,2-дигидро-4Н-тиено[3,4-d]пиримидин-3-ил)-пиперидин-1-илли, 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-тиено[3,2-d]пиримидин-3-ил)пиперидин-1-илли, 4-(5-оксо-4,5,7,8-тетрагидро-2-гиа-4,6-диазазулен-6-ил)пиперидин-1-илли, 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидротииено[3,2-d]-1,3-дiazепин-3-ил)пиперидин-1-илли, 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидротииено[2,3-d]-1,3-дiazепин-3-ил)пиперидин-1-илли ёки 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-тиено[2,3-d]пиримидин-3-ил)пиперидин-1-илли гуруҳни билдиради,

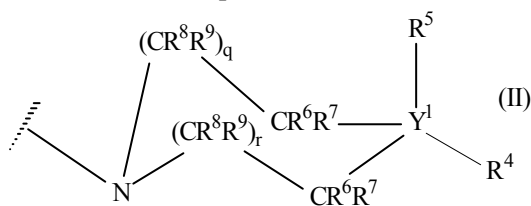
бунда юкорида кўрсатилган моно- ва бициклик гетероциклар кўшимча равишда углерод скелетида метоксигуруҳи билан биралмашилиши мумкин,

R^2 фенилметилли гуруҳни ёки ω -ҳолатида фенил гуруҳи, аминогуруҳи, алкиламиногуруҳи ёки диалкиламиногуруҳи билан алмашилиши мумкин бўлган C_2 - C_7 алкилли гуруҳни билдиради, бунда юкорида кўрсатилган фенилгуруҳи может быть замещена амино- C_1 - C_3 алкил гуруҳи, C_1 - C_3 алкиламино- C_1 - C_3 алкилгуруҳи ёки ди(C_1 - C_3 алкил)-амино- C_1 - C_3 алкилгуруҳи билан алмашилиши мумкин,

R^3 водород атоми ёки C_1 - C_3 алкилли гуруҳни билдиради,

R^2 ва R^3 ўзлари кўшилган азот атоми билан бирга, 7-диметиламинометил-1,2,4,5-тетрагидро-3-бензазепин-3-илли ёки 2-амино-4,5,7,8-тетрагидротиазоло[4,5-d]азепин-6-илли гуруҳни билдиради ёки

R^2 ва R^3 ораларига жойлаштирилган азот атоми билан биргалликда (II) умумий формула қолдиргани ҳосил қиладилар,



бунда Y^1 углерод атомини ифодалайди, ёки қачонки, R^5 бир жуфт эркин электронларини ҳосил қилса, азот атомини ҳам ифодалайди,

q ва r , Y^1 углерод атомидан иборат бўлганда, 0, ёки 1 рақамни ифодалайдилар ёки

q ва r , Y^1 азот атомидан иборат бўлганда, 1 ёки 2 рақамни ифодалайдилар,

R^4 водород атоми,

ҳар бири фтор, хлор ёки бром атоми, трифторметилкарбонил гуруҳи, метил гуруҳи ёки метоксигуруҳи билан алмашилиши мумкин бўлган фенилли, бензилли или пиридинилли гуруҳни, гидроксигуруҳни, карбоксигуруҳни, метилли гуруҳни, трифторметилли гуруҳни, н-пропилли гуруҳни, фенилли гуруҳни, п-толилли гуруҳни, п-трифторметилкарбонилфенилли гуруҳни, п-(3-

диметиламинопропил)фенилли гуруҳни, аминогуруҳни, бензилли гуруҳни, трет-бутиламиногуруҳни, диметиламиногуруҳни, диэтиламиногуруҳни, диэтиламинометилли гуруҳни, 2-диметиламиноэтилли гуруҳни, 2-диэтиламиноэтилли гуруҳни, 5-аминопентилли гуруҳни, метоксикарбонилли гуруҳни, метоксикарбонилметилли гуруҳни, пергидроазепин-1-илли гуруҳни, 4-метилпергидро-1,4-дiazепин-1-илли гуруҳни, 1-метил-1-пиперидинил-4-илли гуруҳни, 4-пиперазин-1-илли гуруҳни, 4-ацетилпиперазин-1-илли гуруҳни, 4-циклопропилметилпиперазин-1-илли гуруҳни, пирролидин-1-илли гуруҳни, 4-этилпиперазин-1-илли гуруҳни, 4-изопропилпиперазин-1-илли гуруҳни, пиперидин-1-илли гуруҳни, пиперидин-4-илли гуруҳни, морфолин-4-илли гуруҳни, 4,4-дифтор-1-пиперидин-1-илли гуруҳни, 1-метил-1-азабицикло[3.2.1]окт-4-илли гуруҳни, 4-метилпиперазин-1-илли гуруҳни, 4-этилпиперазин-1-илли гуруҳни, 1-метилпиперидин-1-илли гуруҳни, 4-карбоксиметилпиперазин-1-илли гуруҳни, 1-карбоксиметилпиперидин-4-илли гуруҳни, 4-бензилоксикарбонилпиперазин-1-илли гуруҳни, 1-этоксикарбонилметилпиперидин-4-илли гуруҳни, азетидин-1-илли гуруҳни, 5-метил-2,5-дiazабицикло[2.2.1]гепт-2-илли гуруҳни, 1-бензилпиперидин-4-илли гуруҳни, 4-бензилпиперазин-1-илли гуруҳни, 4-диметиламинометил-1-фенилли гуруҳни, 2,2,2-трифторэтилпиперазин-1-илли гуруҳни, 1-метилсульфонилпиперидин-4-илли гуруҳни, пиперидин-1-илметилли гуруҳни, 1-метилпиперидин-4-иламиногуруҳни, метилсульфониламиногуруҳни, N-метилсульфонил-N-метиламиногуруҳни, N-(циклопентил)метиламиногуруҳни, 1,1-диоксо- λ^6 -изотиазолидин-2-илли гуруҳни, 2-оксопергидро-1,3-оксазин-3-илли гуруҳни, циклогексилли гуруҳни, 2-оксоимидазол-идин-1-илли гуруҳни, 2-метилимидазол-1-илли гуруҳни, 4-метилимидазол-1-илли гуруҳни, 4-тиазол-2-илли гуруҳни, 2,4-диметилимидазол-1-илли гуруҳни, 4-имидазол-1-илли гуруҳни, 1,2,4-триазол-1-илли гуруҳни, 1-азабицикло[2.2.2]окт-3-илли гуруҳни, 1-метилпиперидин-4-илметилсульфонилли гуруҳни, 1Н-имидазол-4-илли гуруҳни, 4-этоксикарбонилметилпиперазин-1-илли гуруҳни, 1-этоксикарбонилпиперидин-4-илли гуруҳни, 4-трет-бутоксикарбонилметилпиперазин-1-илли гуруҳни, 1-(2,2,2-трифторэтил)пиперидин-4-илли гуруҳни, 4-метилсульфонилпиперазин-1-илли гуруҳни, 2-карбокси-4-метилпиперазин-1-илли гуруҳни, 3-карбокси-4-метилпиперазин-1-илли гуруҳни, 2-этоксикарбонил-4-метилпиперазин-1-илли гуруҳни, 3-этоксикарбонил-4-метилпиперазин-1-илли гуруҳни ёки 4-(2,2,2-трифторэтил)пиперазин-1-илли гуруҳни билдиради,

R⁵ водород атоми, метилли гуруҳни билдиради, ёки Y¹ азот атомидан иборат бўлганда, бир жуфт эркин электронларни билдиради ёки R⁴ ва R⁵ биргаликда, Y¹ углерод атомидан иборат бўлганда, 1-метилпиперидин-4-илиден, циклогексилиден ёки имидазолидин-2,4-дион-5-илиден гуруҳни билдиради, R⁶ ва R⁷ ларнинг ҳар бири водород атоми ёки диметиламиногуруҳни билдиради ва R⁸ ва R⁹ ларнинг ҳар бири водород атоми, карбоксигуруҳни ёки этоксикарбонилли гуруҳни билдиради,

бунда ҳамма юкорида қайд этилган алкил гуруҳлари, шунингдек бошқа юкорида қайд этилган қолдиқларда иштирок этувчи алкилгуруҳлар, бошқа нарса кўрсатилмаган бўлса, 1 дан 7 гача углерод атомларини ўз ичига олади ва тармоқланган ва тармоқланмаган бўлишлари мумкин, юкорида қайд этилган ароматик ва гетероароматик қолдиқлар эса, қўшимча равишда фтор, хлор ва бром атомлари, цианогруҳи ва гидроксигруҳидан танланган бир хил ёки турлича ўринбосарлар билан бир-, икки, ёки учалмашилишлари мумкин,

уларнинг диастереомерлари, уларнинг энантиомерлари, ва уларнинг тузлари.

9. 1-банд бўйича (I) умумий формуланинг ўз ичига қуйидагиларни олган гуруҳдан танланган бирикмалари:

(1) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(2) 2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(1'-метил-[4,4']бипиперидинил-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(3) 2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(4) 2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(5) 2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пиридин-4-илпиперазин-1-ил)-бутан-1,4-дион,

(6) 2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(7) [4-(1'-{2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]уксус кислотаси,

(8) метиловый эфир (1'-{2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил) уксус кислотаси,

(9) (1'-{2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил) уксус кислотаси,

(10) [(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-2-оксоэтил]-амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбон кислотаси,

(11) [(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-(4-диметиламинопиперидин-1-ил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбон кислотаси,

(12) [(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-оксо-2-(4-пиридин-4-илпиперазин-1-ил)-этил]амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбон кислотаси,

(13) [(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-(1'-метил-4,4'-бипиперидинил-1-ил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбон кислотаси,

(14) бензиловый эфир 4-[1-((R)-3-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилфенил)-2-{[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино}пропионил)пиперидин-4-ил]-пиперазин-1-карбон кислотаси,

(15) этиловый эфир [1'-((R)-3-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилфенил)-2-{[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино}пропионил)-4,4'-бипиперидинил-1-ил]уксус кислотаси,

(16) {(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-2-оксоэтил}амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбон кислотаси,

(17) {(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-2-оксоэтил}амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбон кислотаси,

(18) [(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-(4-азетидин-1-ил)пиперидин-1-ил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбон кислотаси,

(19) {(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-[4-(5-метил-2,5-диазабикло[2.2.1]гепт-2-ил)пиперидин-1-ил]-2-оксоэтил}амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбон кислотаси,

(20) [(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-оксо-2-(4-пиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил)-этил]амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенз-

- (47) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-этилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (48) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(1-этилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (49) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(3,4,5,6-тетрагидро-2Н-4,4'-бипиридинил-1-ил)бутан-1,4-дион,
- (50) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пиридин-4-илпиперазин-1-ил)бутан-1,4-дион,
- (51) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(3-пергидроазепин-1-илазетидин-1-ил)бутан-1,4-дион,
- (52) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(1-бензилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (53) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-бензилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (54) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(7-диметиламинометил-1,2,4,5-тетрагидро-3-бенздиазепин-3-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (55) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-диметиламинометилфенил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (56) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-{4-[4-(2,2,2-трифторэтил)пиперазин-1-ил]пиперидин-1-ил}бутан-1,4-дион,
- (57) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(1'-метансульфонил-4,4'-бипиперидинил-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (58) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(9-метил-3,9-диазаспиро[5.5]ундец-3-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (59) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пиперидин-1-илметилпиперидин-1-ил)бутан-1,4-дион,
- (60) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(2-диметиламиноэтил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (61) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-N-метил-N-[2-(1-метилпиперидин-4-ил)этил]-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирамид,
- (62) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-N-метил-N-(1-метилпиперидин-4-илметил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирамид,
- (63) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-пиперидин-1-илбутан-1,4-дион,
- (64) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пропилпиперидин-1-ил)бутан-1,4-дион,
- (65) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(4-бензилпиперидин-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (66) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(2-диэтиламиноэтил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (67) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(3-азаспиро[5.5]ундец-3-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (68) N-(1-((S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил)пиперидин-4-ил)-N-метилметансульфонамид,
- (69) N-(1-((S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил)пиперидин-4-ил)метансульфонамид,
- (70) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(циклопентилметиламино)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (71) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(4-метилпиперидин-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (72) метиловый эфир (1-((S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил)пиперидин-4-ил)уксус кислоты,

- (73) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(4-гидроксипиперидин-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (74) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-трифторметилпиперидин-1-ил)бутан-1,4-дион,
- (75) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(1,1-диоксо-1,6-изотиазолидин-2-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (76) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(2-оксопергидро-1,3-оксазин-3-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (77) метиловый эфир 1-{(S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-карбоновой кислоты,
- (78) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(4-циклогексилпиперидин-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (79) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(4-трет-бутиламинопиперидин-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (80) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-фенилпиперидин-1-ил)бутан-1,4-дион,
- (81) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-п-толилпиперидин-1-ил)бутан-1,4-дион,
- (82) 8-{(S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-1,3,8-триазаспиро[4.5]декан-2,4-дион,
- (83) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(2-оксоимидазолидин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (84) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(4-амино-4-метилпиперидин-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (85) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (86) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(2-амино-4,5,7,8-тетрагидротиазоло[4,5-d]-азепин-6-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (87) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(2-метилимидазол-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (88) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилимидазол-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (89) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-тиазол-2-илпиперазин-1-ил)бутан-1,4-дион,
- (90) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(2,4-диметилимидазол-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (91) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(4-имидазол-1-ил)пиперидин-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (92) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-1,2,4-триазол-1-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (93) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(1-азабицикло[2.2.2]окт-3-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (94) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-пиперазин-1-ил)бутан-1,4-дион,
- (95) (1-метилпиперидин-4-ил)амид 4-{(S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперазин-1-сульфон кислотаси,
- (96) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-N-(5-аминопентил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирамид,
- (97) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-N-(3-аминометилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирамид,
- (98) 1-{(S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4- карбон кислотаси,
- (99) (1-{(S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)уксус кислотаси,

- (100) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(8-метил-8-азабицикло[3.2.1]окт-3-ил)-пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (101) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (102) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(1Н-имидазол-4-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (103) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-{4-[4-(2,2,2-трифторацетил)фенил]пиперазин-1-ил} бутан-1,4-дион,
- (104) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (105) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(5-оксо-3-фенил-4,5-дигидро-1,2,4-триазол-1-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (106) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2-дигидроимидазо[4,5-с]хинолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (107) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2-дигидро-4Н-тиено[3,4-d]пиримидин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (108) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(5-метил-2,5-диазобицикло[2.2.1]гепт-2-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (109) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпергидро-1,4-диазепин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (110) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-1-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пергидро-1,4-диазепин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (111) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-1-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (112) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-1-[4-(1-азабицикло[2.2.2]окт-3-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (113) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (114) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пергидроазепин-1-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (115) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-1-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (116) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (117) {(R)-1-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-2-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-2-оксоэтил}амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,
- (118) {(R)-1-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-2-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-2-оксоэтил}амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,
- (119) [(R)-1-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-2-1,4'-бипиперидинил-1'-ил-2-оксоэтил]-амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,
- (120) [(R)-1-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-2-оксо-2-(4-пиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-этил]амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,
- (121) (R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-2-оксоэтиловый эфир 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,
- (122) [2-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-1-(4-бром-3-метилбензил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,
- (123) [1-(4-бром-3-метилбензил)-2-(1'-метил-[4,4']бипиперидинил-1-ил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,
- (124) {1-(4-бром-3-метилбензил)-2-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-2-оксоэтил}амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,
- (125) {1-(4-бром-3-метилбензил)-2-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-2-оксоэтил}амид

4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,
 (126) этиловый эфир {4-[1-(3-(4-бром-3-метилфенил)-2- {[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино} пропионил)пиперидин-4-ил]пиперазин-1-ил}уксус кислотаси,
 (127) этиловый эфир [1'-(3-(4-бром-3-метилфенил)-2- {[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино} пропионил)-[4,4']бипиперидинил-1-ил]уксус кислотаси,
 (128) этиловый эфир {4-[4-(3-(4-бром-3-метилфенил)-2- {[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино} пропионил)пиперазин-1-ил]пиперидин-1-ил}уксус кислотаси,
 (129) {4-[1-(3-(4-бром-3-метилфенил)-2- {[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино} пропионил)пиперидин-4-ил]-пиперазин-1-ил}уксус кислотаси,
 (130) [1'-(3-(4-бром-3-метилфенил)-2- {[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино} пропионил)-[4,4']бипиперидинил-1-ил}уксус кислотаси,
 (131) {4-[4-(3-(4-бром-3-метилфенил)-2- {[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино} пропионил)пиперазин-1-ил]пиперидин-1-ил}уксус кислотаси,
 (132) 2-(4-бром-3-метилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
 (133) 2-(4-бром-3-метилбензил)-1-(1'-метил-[4,4']-бипиперидинил-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
 (134) 1-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-2-(4-бром-3-метилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
 (135) 2-(4-бром-3-метилбензил)-1-[4-[4-(3-диметиламинопропил)фенил]пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
 (136) [4-(1-{2-(4-бром-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил}уксус кислотаси,
 (137) метиловый эфир (1'-{2-(4-бром-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксус кислотаси,
 (138) (1'-{2-(4-бром-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксус кислотаси,
 (139) {1-(4-хлор-3-метилбензил)-2-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-2-оксоэтил}амид

4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбон кислотаси,
 (140) [2-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-1-(4-хлор-3-метилбензил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,
 (141) {1-(4-хлор-3-метилбензил)-2-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-2-оксоэтил}амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,
 (142) [1-(4-хлор-3-метилбензил)-2-(1'-метил-[4,4']бипиперидинил-1-ил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,
 (143) этиловый эфир [1'-(3-(4-хлор-3-метилфенил)-2- {[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино} пропионил)-[4,4']бипиперидинил-1-ил]уксус кислотаси,
 (144) трет-бутиловый эфир {4-[1-(3-(4-хлор-3-метилфенил)-2- {[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино} пропионил)пиперидин-4-ил]пиперазин-1-ил}уксус кислотаси,
 (145) {1-(4-хлор-3-метилбензил)-2-оксо-2-[1'-(2,2,2-трифторэтил)-[4,4']бипиперидинил-1-ил]этил}-амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)-пиперидин-1- карбон кислотаси,
 (146) (1-(4-хлор-3-метилбензил)-2-оксо-2-{4-[4-(2,2,2-трифторэтил)пиперазин-1-ил]пиперидин-1-ил}этил)амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,
 (147) [1'-(3-(4-хлор-3-метилфенил)-2- {[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино} пропионил)-[4,4']бипиперидинил-1-ил]уксус кислотаси,
 (148) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-[4-(4-этилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
 (149) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-(1'-метил-[4,4']-бипиперидинил-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
 (150) 1-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
 (151) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
 (152) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
 (153) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-[4-(4-метан-

- сульфонилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (154) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-[4-(4-изопропилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (155) этиловый эфир 1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-2- карбон кислотаси,
- (156) этиловый эфир 1-(1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)-4-метилпиперазин-2- карбон кислотаси,
- (157) этиловый эфир 4-(1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)-1-метилпиперазин-2- карбон кислотаси,
- (158) этиловый эфир 4-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-1-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-2- карбон кислотаси,
- (159) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-[1'-(2,2,2-трифторэтил)-[4,4']бипиперидинил-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (160) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-{4-[4-(2,2,2-трифторэтил)пиперазин-1-ил]пиперидин-1-ил} бутан-1,4-дион,
- (161) [4-(1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]уксусную кислоту,
- (162) метиловый эфир (1'-(2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксус кислотаси,
- (163) (1'-(2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксус кислотаси,
- (164) 1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-2- карбон кислотаси,
- (165) 1-(1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)-4-метилпиперазин-2- карбон кислотаси,
- (166) 4-(1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)-1-метилпиперазин-2- карбон кислотаси,
- (167) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (168) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (169) [4-(1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(5-оксо-3-фенил-4,5-дигидро-1,2,4-триазол-1-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]уксус кислотаси,
- (170) метиловый эфир (1'-(2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(5-оксо-3-фенил-4,5-дигидро-1,2,4-триазол-1-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-4,4'-бипиперидинил-1-ил)уксус кислотаси,
- (171) (1'-(2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(5-оксо-3-фенил-4,5-дигидро-1,2,4-триазол-1-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-4,4'-бипиперидинил-1-ил)уксус кислотаси,
- (172) 2-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (173) 2-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-1-(1'-метил-[4,4']бипиперидинил-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (174) 2-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пиридин-4-ил)пиперазин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (175) 2-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-1-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (176) [4-(1-{2-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]уксус кислотаси,
- (177) метиловый эфир (1'-(2-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксус кислотаси,
- (178) (1'-(2-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксус кислотаси,
- (179) {1-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-2-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-2-оксоэтил}амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,
- (180) [2-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-1-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,
- (181) {1-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-2-[4-(1-

метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-2-оксо-этил}амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,

(182) [1-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-2-(1'-метил-[4,4']бипиперидинил-1-ил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,

(183) [1-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-2-оксо-2-(4-пиридин-4-илпиперазин-1-ил)этил]амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1- карбон кислотаси,

(184) 2-(4-хлор-3-трифторметилбензил)-1-(1'-метил-[4,4']бипиперидинил-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(185) 2-(4-хлор-3-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(186) 1-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-2-(4-хлор-3-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(187) [4-(1-{2-(4-хлор-3-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]уксус кислотаси,

(188) метиловый эфир (1'-{2-(4-хлор-3-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксус кислотаси,

(189) (1'-{2-(4-хлор-3-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксус кислотаси,

(190) 2-(4-хлор-3-трифторметилбензил)-1-(1'-метил-[4,4']бипиперидинил-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

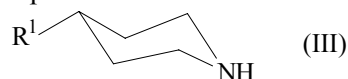
уларнинг энантиомерлари, уларнингх диастереомерлари ва уларнинг тузлари.

10. Юқоридаги бандларнинг бири бўйича бирикма ноорганик ёки органик кислоталар ва асослар билан физиологик мувофиқ туздан иборат.

11. CGRP-ингибирловчи фаоллика эга, таркибда самарали микдорда 1-9 -бандларнинг ҳар қайсиси бўйича бирикма ёки 10-банд бўйича физиологик мувофиқ туз мавжуд, шунингдек битта ёки бир нечта инерт ташувчи ва/ёки суюлтирувчи бўлиши шарт бўлмаган дори воситаси.

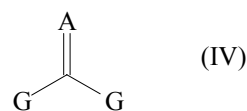
12. 11-банд бўйича дори воситасини олиш усули шу билан ф а р қ л а н а д и к и, 1-10-бандлар бўйича бирикма нокимё йўли билан битта ёки бир нечта инерт ташувчи ва/ёки суюлтирувчи билан бирлаштирилади.

13. 1-9-бандларнинг ҳар қайсиси бўйича (I) умумий формула бирикмаларини олиш усули шу билан ф а р қ л а н а д и к и, ушбу гуруҳлар эркин карбоксилли функцияни ўз ичига олмаслик шarti билан, X кислород атомини ёки NH гуруҳни билдирадиган, R¹-R³ эса, 1-бандда кўрсатилган кўрсаткичларга эга, (I) умумий формула бирикмаларини олиш учун, R¹ 1-бандда кўрсатилган кўрсаткичларга эга (III) умумий формула пиперидинлари

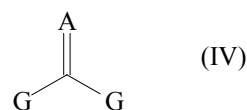


қуйидагилар билан ўзаро таъсирга дучор қилинади :

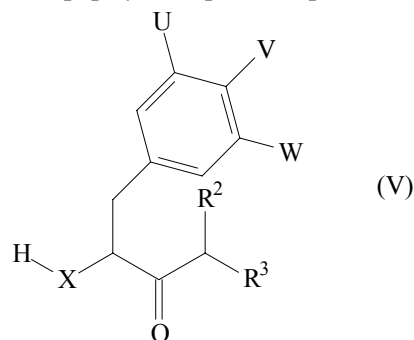
(I) (IV) умумий формула кўмир кислотасининг хосилалари билан



бунда А 1-бандда кўрсатилган кўрсаткичларга эга, G эса, феноксигуруҳ, 1Н-имидазол-1-илли гуруҳ, 1-Н-1,2,4-триазол-1- илли гуруҳ, трихлорметоксигуруҳ ёки 2,5-диоксопирролидин-1-илоксигуруҳ каби нуклеофоб гуруҳни билдиради, шу шарт биланки, X –NHгуруҳдан иборат, ёки (II) (IV) умумий формула кўмир кислотасининг хосилалари билан



бунда А кислород атомини билдиради, а G эса, феноксигуруҳ, 1Н-имидазол-1-илли гуруҳ, 1-Н-1,2,4-триазол-1-илли гуруҳ, трихлорметоксигуруҳ ёки 2,5-диоксопирролидин-1-илоксигуруҳ каби нуклеофоб гуруҳни билдиради, бунда иккала G бир хил ёки турлича бўлиши мумкин, шу шарт биланки, X кислород атомидан иборат, ва (V) умумий формула бирикмалари билан



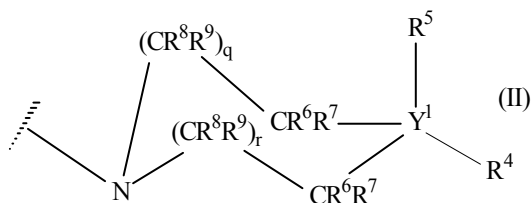
бунда X кислород атоми ёки -NH гуруҳни билдиради, U, V, W, R² ва R³ эса 1-бандда кўрсатилган кўрсаткичларга эга, шу шарт биланки, R² ва R³ таркибига эркин карбоксилли функцияни ва/

алкильной группы 1Н-хиолин-2-оновым кольцом или с имидазольным или N-метилимидазольным кольцом или же каждая из двух олефиновых двойных связей одного из вышеуказанных ненасыщенных гетероциклов может быть сконденсирована с фенильным кольцом, причем содержащиеся в R^1 фенильные, пиридинильные, диазинильные, фурильные, тиенильные, пирролильные, 1,3-оксазолильные, 1,3-тиазолильные, изоксазолильные, пиразолильные, 1-метилпиразолильные, имидазолильные или 1-метилимидазолильные группы, а также сконденсированные с бензольным, тиеновым, пиридиновым и диазиновым кольцом гетероциклы дополнительно могут быть одно-, дву- или тризамещены в углеродном скелете идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора, брома и йода, алкильной группы, алкоксигруппы, нитрогруппы, алкилтиогруппы, алкилсульфинильной группы, алкилсульфонильной группы, алкилсульфонаминогруппы, фенильной группы, дифторметильной группы, трифторметильной группы, алкоксикарбонильной группы, карбоксигруппы, гидроксигруппы, аминогруппы, алкиламиногруппы, диалкиламиногруппы, ацетильной группы, ацетиламиногруппы, пропиониламиногруппы, аминокарбонильной группы, алкиламинокарбонильной группы, диалкиламинокарбонильной группы, (4-морфолинил)карбонильной группы, (1-пирролидинил)карбонильной группы, (1-пиперидинил)карбонильной группы, (гексагидро-1-азепинил)карбонильной группы, (4-метил-1-пиперазинил)карбонильной группы, метилendioксигруппы, аминокарбониламиногруппы, алканоильной группы, цианогруппы, дифторметоксигруппы, трифторметоксигруппы, трифторметилтиогруппы, трифторметилсульфинильной группы и трифторметилсульфонильной группы, R^2 обозначает атом водорода, фенилметильную группу или C_2 - C_7 алкильную группу, которая в ω -положении может быть замещена циклогексильной группой, фенильной группой, пиридинильной группой, диазинильной группой, гидроксигруппой, аминогруппой, алкиламиногруппой, диалкиламиногруппой, карбоксигруппой, алкоксикарбонильной группой, аминокарбонильной группой, аминокарбонил-аминогруппой, ацетиламиногруппой, 1-пирролидинильной группой, 1-пиперидинильной группой, 4-(1-пиперидинил)-1-пиперидинильной группой, 4-морфолинийной группой, гексагидро-1Н-1-азепинильной группой, [бис(2-гидроксизтил)]аминогруппой, 4-алкил-1-пиперазинильной группой или 4-(ω -гидрокси- C_2 - C_7 алкил)-1-пиперазинильной группой,

фенильную или пиридинильную группу, при этом вышеуказанные гетероциклические остатки и фенильные группы дополнительно могут быть одно-, дву- либо тризамещены в углеродном скелете идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора, брома и йода, метильной группы, алкоксигруппы, дифторметильной группы, трифторметильной группы, гидроксигруппы, аминогруппы, C_1 - C_3 алкиламиногруппы, ди(C_1 - C_3 алкил)аминогруппы, ацетиламиногруппы, аминокарбонильной группы, цианогруппы, метилсульфонилоксигруппы, дифторметоксигруппы, трифторметоксигруппы, трифторметилтиогруппы, трифторметилсульфинильной группы, трифторметилсульфонильной группы, амина- C_1 - C_3 алкильной группы, C_1 - C_3 алкиламино- C_1 - C_3 алкильной группы и ди(C_1 - C_3 алкил)амино- C_1 - C_3 алкильной группы,

R^3 обозначает атом водорода или необязательно замещенную фенильной или пиридинильной группой C_1 - C_3 алкильную группу, при этом указанная C_1 - C_3 алкильная группа может быть соединена с присутствующей в R^2 алкильной группой или присутствующим в R^2 фенильным или пиридинильным кольцом и атомом азота, к которому они присоединены, с образованием кольца, или

R^2 и R^3 совместно с заключенным между ними атомом азота образуют остаток общей формулы (II)



в которой Y^1 обозначает атом углерода, или же когда R^5 представляет собой свободную пару электронов, обозначает также атом азота, q и r , когда Y^1 представляет собой атом углерода, обозначают число 0, 1 или 2 либо q и r , когда Y^1 представляет собой атом азота, обозначают число 1 или 2, R^4 обозначает атом водорода, аминогруппу, алкиламиногруппу, циклоалкиламиногруппу, диалкиламиногруппу, N-(циклоалкил)алкиламиногруппу, дициклоалкиламиногруппу, гидроксигруппу, алкильную группу, циклоалкильную группу, амина- C_2 - C_7 алкильную группу, алкиламина- C_2 - C_7 алкильную группу, диалкиламино- C_2 - C_7 алкильную группу, аминоиминотильную группу, алкилкарбонильную группу, алкилсульфонильную группу, алкилкарбониламиногруппу,

алкилсульфониламиногруппу, N-алкилкарбонил-N-алкиламиногруппу, N-алкилсульфонил-N-алкиламиногруппу, аминокарбониламиногруппу, алкиламинокарбониламиногруппу, диалкиламинокарбониламиногруппу, циклоалкиламинокарбониламиногруппу, дициклоалкиламинокарбониламиногруппу, фениламинокарбониламиногруппу, аминокарбонилалкильную группу, алкиламинокарбонилалкильную группу, диалкиламинокарбонилалкильную группу, аминокарбониламиноалкильную группу, алкоксикарбонильную группу, алкоксикарбонилалкильную группу или карбоксиалкильную группу, или же когда Y^1 не представляет собой атом азота, обозначает также карбоксигруппу, аминотетильную группу, алкиламинометильную группу или диалкиламинометильную группу либо обозначает фенильную, фенил- C_1 - C_3 алкильную, пиридинильную, диазинильную, 1-нафтильную, 2-нафтильную, пиридинилкарбонильную или фенилкарбонильную группу, каждая из которых может быть одно-, дву- или трехзамещена в углеродном скелете идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора, брома и йода, алкильной группы, алкоксигруппы, метилсульфонилоксигруппы, дифторметильной группы, трифторметильной группы, гидроксигруппы, аминогруппы, ацетиламиногруппы, аминокарбонильной группы, аминокарбониламиногруппы, аминокарбониламинометильной группы, цианогруппы, карбоксигруппы, алкоксикарбонильной группы, карбоксиалкильной группы, алкоксикарбонилалкильной группы, алканоильной группы, ω -(диалкиламино)алканоильной группы, ω -(диалкиламино)алкильной группы, ω -(диалкиламино)гидроксиалкильной группы, ω -(карбокси)алканоильной группы, дифторметоксигруппы, трифторметоксигруппы, трифторметилтиогруппы, трифторметилсульфинильной группы и трифторметилсульфонильной группы, насыщенную или одно- либо многократно ненасыщенную 4-10-членную азадициклоалкильную группу, 5-10-членную оксаза-, тиаза-, диаза- или триазадициклоалкильную группу, 6-10-членную азабицикло- или диазабициклоалкильную группу, 1-алкил-4-пиперидинилкарбонильную либо 4-алкил-1-пиперазинилкарбонильную группу, 1-алкил-4-пиперидиниламиногруппу, 1-алкил-4-пиперидиниламинокарбонильную группу или 1-алкил-4-пиперидиниламиносульфонильную группу, при этом вышеуказанные моно- и бициклические гетероциклы присоединены через атом азота или углерода,

метиленовая группа в вышеуказанных моно- и бициклических гетероциклах может быть заменена на карбонильную или сульфонильную группу, в вышеуказанных моно- и бициклических гетероциклах не связанная непосредственно с атомом азота, кислорода или серы метиленовая группа может быть замещена одним или двумя атомами фтора, вышеуказанные моно- и бициклические гетероциклы, а также 1-алкил-4-пиперидинилкарбонильная и 4-алкил-1-пиперазинилкарбонильная группа могут быть одно- либо многозамещены в кольце C_1 - C_7 алкильной группой и/или однозамещены в кольце бензильной группой, алканоильной группой, диалкиламиногруппой, фенилкарбонильной группой, пиридинилкарбонильной группой, карбоксигруппой, карбоксиалканоильной группой, карбоксиалкильной группой, алкоксикарбонилалкильной группой, алкоксикарбонильной группой, аминокарбонильной группой, алкиламинокарбонильной группой, алкилсульфонильной группой, циклоалкильной группой или циклоалкилалкильной группой либо необязательно замещенной в кольце алкилом циклоалкилкарбонильной, азадициклоалкилкарбонильной, диазадициклоалкилкарбонильной или оксазадициклоалкилкарбонильной группой, причем содержащиеся в этих заместителях алициклические фрагменты имеют по 3-10 кольцевых членов, а гетероалициклические фрагменты имеют по 4-10 кольцевых членов и содержащиеся в вышеуказанных остатках фенильные и пиридинильные остатки в свою очередь могут быть одно-, дву- или тризамещены идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора, брома и йода, алкильной группы, алкоксигруппы, метилсульфонилоксигруппы, дифторметильной группы, трифторметильной группы, гидроксигруппы, аминогруппы, ацетиламиногруппы, аминокарбонильной группы, аминокарбониламиногруппы, аминокарбониламинометильной группы, цианогруппы, карбоксигруппы, алкоксикарбонильной группы, карбоксиалкильной группы, алкоксикарбонилалкильной группы, алканоильной группы, ω -(диалкиламино)алканоильной группы, ω -(карбокси)алканоильной группы, дифторметоксигруппы, трифторметоксигруппы, трифторметилтиогруппы, трифторметилсульфинильной группы и трифторметилсульфонильной группы, R^5 обозначает атом водорода, C_1 - C_4 алкильный остаток, при этом неразветвленный алкильный остаток может быть замещен в

ω-положении фенильной группой, пиридинильной группой, диазинильной группой, аминогруппой, алкиламиногруппой, диалкиламиногруппой, 1-пирролидинильной группой, 1-пиперидинильной группой, 4-метил-1-пиперазинильной группой, 4-морфолинийной группой или гексагидро-1Н-1-азепинильной группой, алкоксикарбонильную группу, цианогруппу или аминокарбонильную группу, или же когда Y^1 представляет собой атом азота, обозначает также свободную пару электронов, либо когда Y^1 не представляет собой атом азота, обозначает также атом фтора или

R^4 и R^5 совместно, когда Y^1 представляет собой атом углерода, обозначают 4-7-членное циклоалкифатическое кольцо, в котором одна или две метиленовые группы могут быть заменены на группу -NH- или -N(алкил)- и одна или две другие метиленовые группы могут быть заменены на одну, соответственно две карбонильные группы, при этом присоединенный к атому азота в вышеуказанной группе R^4 атом водорода может быть заменен на защитную группу,

R^6 и R^7 могут иметь идентичные или различные значения и каждый из них обозначает атом водорода, C_1 - C_3 алкильную группу или диалкиламиногруппу, или же когда Y^1 не представляет собой атом азота, обозначает также атом фтора и R^8 и R^9 могут иметь идентичные или различные значения и каждый из них обозначает атом водорода или C_1 - C_3 алкильную группу, карбоксигруппу или C_1 - C_3 алкоксикарбонильную группу, при этом все вышеуказанные алкильные группы и алкоксигруппы, а также присутствующие в других вышеуказанных остатках алкильные группы содержат, если не указано иное, от 1 до 7 атомов углерода и могут быть неразветвленными или разветвленными, причем каждая метиленовая группа может быть замещена 1-2 атомами фтора, а каждая метильная группа может быть замещена 1-3 атомами фтора,

все вышеуказанные циклоалкильные группы, а также присутствующие в других вышеуказанных остатках циклоалкильные группы могут содержать, если не указано иное, от 3 до 10 атомов углерода, причем каждая метиленовая группа может быть замещена 1-2 атомами фтора и все вышеуказанные ароматические и гетероароматические остатки дополнительно могут быть одно-, дву- либо тризамещены идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора и брома, цианогруппы и гидроксигруппы,

их таутомеры, их диастереомеры, их энантиомеры, их гидраты, их смеси и их соли, а также гидраты солей.

2. Соединения общей формулы (I) по п. 1, в которой

A, U, V, W, X, R^2 и R^3 имеют указанные в п. 1 значения, а

R^1 обозначает однократно или двукратно ненасыщенный 5-7-членный аза-, диаза-, триаза- или тиазагетероцикл,

при этом вышеуказанные гетероциклы присоединены через атом углерода или азота, содержат одну или две карбонильные группы, смежные с атомом азота, и могут быть замещены по атому углерода фенильной, пиридинильной, диазинильной, тиенильной, пирролильной, 1,3-тиазолильной, изоксазолильной, пиразолильной или 1-метилпиразолильной группой, а олефиновая двойная связь одного из вышеуказанных ненасыщенных гетероциклов может быть сконденсирована с фенильным, нафтильным, пиридиновым, диазиновым, тиенильным или хинолиновым кольцом или с необязательно замещенным по атому азота метильной группой 1Н-хинолин-2-оновым кольцом,

причем содержащиеся в R^1 фенильные, пиридинильные, диазинильные, тиенильные, пирролильные, 1,3-тиазолильные, изоксазолильные, пиразолильные или 1-метилпиразолильные группы, а также сконденсированные с бензольным, пиридиновым и диазиновым кольцом гетероциклы дополнительно могут быть одно-, дву- либо тризамещены в углеродном скелете идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора, брома и йода, алкильной группы, алкоксигруппы, нитрогруппы, дифторметильной группы, трифторметильной группы, гидроксигруппы, аминогруппы, алкиламиногруппы, диалкиламиногруппы, ацетиламиногруппы, ацетильной группы, цианогруппы, дифторметоксигруппы и трифторметоксигруппы, при этом все вышеуказанные алкильные группы или присутствующие в вышеуказанных остатках алкильные группы содержат, если не указано иное, от 1 до 7 атомов углерода и могут быть разветвленными или неразветвленными, причем каждая метиленовая группа может быть замещена 1-2 атомами фтора, а каждая метильная группа может быть замещена 1-3 атомами фтора и вышеуказанные ароматические и гетероароматические остатки дополнительно могут быть одно-, дву- либо тризамещены идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора и брома, цианогруппы и гидроксигруппы, их таутомеры, их диастереомеры, их энантиомеры, их смеси и их соли.

3. Соединения общей формулы (I) по п. 1, в которой

A, U, V, W, X, R² и R³ имеют указанные в п. 1 значения, а

R¹ обозначает однократно ненасыщенный 5-7-членный диаза- или триазагетероцикл, при этом вышеуказанные гетероциклы присоединены через атом азота, содержат карбонильную группу, смежную с атомом азота, и дополнительно могут быть замещены по атому углерода фенильной группой, а олефиновая двойная связь одного из вышеуказанных ненасыщенных гетероциклов может быть сконденсирована с фенильным, тиенильным или хинолиновым кольцом, причем содержащиеся в R¹ фенильные группы, а также сконденсированные с бензольным кольцом гетероциклы дополнительно могут быть одно-, дву- либо тризамещены в углеродном скелете идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора, брома и йода, метильной группы, метоксигруппы, нитрогруппы, диформетильной группы, трифторметильной группы, гидроксигруппы, аминогруппы, алкиламиногруппы, диалкиламиногруппы, ацетиламиногруппы, ацетильной группы, цианогруппы, диформетоксигруппы и трифторметоксигруппы, предпочтительно, однако, являются незамещенными или однозамещены атомом фтора, хлора или брома, метильной группой или метоксигруппой,

при этом все вышеуказанные алкильные группы, а также присутствующие в других остатках алкильные группы содержат, если не указано иное, от 1 до 7 атомов углерода и могут быть неразветвленными или разветвленными, а вышеуказанные ароматические и гетероароматические остатки дополнительно могут быть одно-, дву- либо тризамещены идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора и брома, цианогруппы и гидроксигруппы, их таутомеры, их диастереомеры, их энантиомеры, их смеси и их соли.

4. Соединения общей формулы (I) по п. 1, в которой

A, U, V, W, X, R² и R³ имеют указанные в п. 1 значения, а

R¹ обозначает 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ильную, 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ильную, 4-(5-оксо-3-фенил-4,5-дигидро-1,2,4-триазол-1-ил)пиперидин-1-ильную, 4-(2-оксо-1,2-дигидроимидазо[4,5-с]хинолин-3-ил)пиперидин-1-ильную, 4-(2-оксо-1,2-дигидро-4Н-тиено[3,4-d]-пиримидин-3-ил)пиперидин-1-ильную, 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-тиено[3,2-d]пиримидин-3-ил)-

пиперидин-1-ильную, 4-(5-оксо-4,5,7,8-тетрагидро-2-тиа-4,6-диазаазулен-6-ил)пиперидин-1-ильную, 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидротииено[3,2-d]-1,3-диазепин-3-ил)пиперидин-1-ильную, 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидротииено[2,3-d]-1,3-диазепин-3-ил)пиперидин-1-ильную или 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-тиено[2,3-d]пиримидин-3-ил)пиперидин-1-ильную группу, при этом вышеуказанные моно- и бициклические гетероциклы дополнительно могут быть однозамещены в углеродном скелете метоксигруппой, при этом вышеуказанные ароматические и гетероароматические остатки дополнительно могут быть одно-, дву- либо тризамещены идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора и брома, цианогруппы и гидроксигруппы, их таутомеры, их диастереомеры, их энантиомеры, их смеси и их соли.

5. Соединения общей формулы (I) по п. 1, в которой

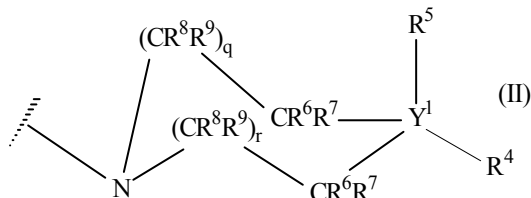
A, U, V, W, X и R¹ имеют указанные в п. 1 значения, а

R² обозначает атом водорода или фенилметильную группу либо C₂-C₇алкильную группу, которая в ω-положении может быть замещена фенильной группой, пиридинильной группой, гидроксигруппой, аминогруппой, алкиламиногруппой, диалкиламиногруппой, карбоксихгруппой, алкоксикарбонильной группой, аминокарбонильной группой, аминокарбонил-аминогруппой, ацетиламиногруппой, 1-пирролидинильной группой, 1-пиперидинильной группой, 4-морфолинийной группой или [бис(2-гидроксиэтил)]аминогруппой,

при этом вышеуказанные гетероциклические остатки и фенильные группы дополнительно могут быть одно-, дву- либо тризамещены в углеродном скелете идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора, брома и йода, метильной группы, алкоксигруппы, диформетильной группы, трифторметильной группы, гидроксигруппы, аминогруппы, C₁-C₃алкиламиногруппы, ди(C₁-C₃алкил)аминогруппы, ацетиламиногруппы, аминокарбонильной группы, цианогруппы, диформетоксигруппы, трифторметоксигруппы, амино-C₁-C₃алкильной группы, C₁-C₃алкиламино-C₁-C₃алкильной группы и ди(C₁-C₃алкил)амино-C₁-C₃алкильной группы,

R³ обозначает атом водорода или C₁-C₃алкильную группу, при этом указанная C₁-C₃алкильная группа может быть соединена с присутствующей в R² алкильной группой или с присутствующим

в R^2 фенильным или пиридилным кольцом и атомом азота, к которому они присоединены, с образованием 5-7-членного кольца, или R^2 и R^3 совместно с заключенным между ними атомом азота образуют остаток общей формулы (II)



в которой Y^1 обозначает атом углерода, или же когда R^5 представляет собой свободную пару электронов, обозначает также атом азота, q и r , когда Y^1 представляет собой атом углерода, обозначают число 0 или 1 либо q и r , когда Y^1 представляет собой атом азота, обозначают число 1 или 2,

R^4 обозначает атом водорода, гидроксигруппу, аминогруппу, алкиламиногруппу, C_3 - C_6 циклоалкиламиногруппу, N -(C_3 - C_6 циклоалкил)алкиламиногруппу, диалкиламиногруппу, алкильную группу, трифторметильную группу, C_3 - C_6 циклоалкильную группу, диалкиламино- C_2 - C_7 алкильную группу, карбоксиалкильную группу, алкоксикарбонилалкильную группу, алкилсульфонилалкильную группу, алкилсульфониламиногруппу или N -(алкилсульфонил)алкиламиногруппу, или же когда Y^1 не представляет собой атом азота, обозначает также карбоксигруппу или диалкиламинометильную группу либо обозначает фенильную, фенил- C_1 - C_3 алкильную, пиридинильную или диазинильную группу, каждая из которых может быть замещена атомом фтора, хлора или брома, трифторметилкарбонильной группой, метильной группой или метоксигруппой, насыщенную или одно- либо многократно ненасыщенную 4-7-членную азациклоалкильную группу, 5-7-членную оксаза-, диаза- либо триазаациклоалкильную группу, 7-9-членную азабицикло- либо диазабициклоалкильную группу, 1-алкил-4-пиперидиниламиногруппу или 1-алкил-4-пиперидинил-аминосульфонилалкильную группу, при этом вышеуказанные моно- и бициклические гетероциклы присоединены через атом азота или углерода,

метиленовая группа в вышеуказанных моно- и бициклических гетероциклах может быть заменена на карбонильную или сульфонилную группу,

в вышеуказанных моно- и бициклических гетероциклах не связанная непосредственно с атомом азота, кислорода или серы метиленовая

группа может быть замещена одним или двумя атомами фтора,

вышеуказанные моно- и бициклические гетероциклы могут быть замещены одной или двумя C_1 - C_3 алкильными группами, в которых каждая метиленовая группа может быть замещена 1-2 атомами фтора, а каждая метильная группа может быть замещена 1-3 атомами фтора, и/или могут быть замещены C_3 - C_6 циклоалкил- C_1 - C_3 алкильной группой, бензильной группой, C_1 - C_4 алканоильной группой, ди(C_1 - C_3 алкил)аминогруппой, C_1 - C_3 алкилсульфонилной группой, алкоксикарбонильной группой, бензилоксикарбонильной группой, алкоксикарбонилалкильной группой, карбоксигруппой или карбоксиалкильной группой,

R^5 обозначает атом водорода, C_1 - C_3 алкильную группу или алкоксикарбонильную группу, либо когда Y^1 представляет собой атом азота, обозначает также свободную пару электронов или R^4 и R^5 совместно, когда Y^1 представляет собой атом углерода, обозначают 5-6-членное циклоалифатическое кольцо, в котором одна или две метиленовые группы могут быть заменены на группу -NH- или -N(метил)-, а одна или две другие метиленовые группы могут быть заменены на одну, соответственно две карбонильные группы, R^6 и R^7 могут иметь идентичные или различные значения и каждый из них обозначает атом водорода, C_1 - C_3 алкильную группу или ди(C_1 - C_3 алкил)аминогруппу и

R^8 и R^9 могут иметь идентичные или различные значения и каждый из них обозначает атом водорода, C_1 - C_3 алкильную группу, карбоксигруппу или C_1 - C_3 алкоксикарбонильную группу,

при этом все вышеуказанные алкильные группы, а также присутствующие в других остатках алкильные группы содержат, если не указано иное, от 1 до 7 атомов углерода и могут быть неразветвленными или разветвленными, а вышеуказанные ароматические и гетероароматические остатки дополнительно могут быть одно-, дву- либо тризамещены идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора и брома, цианогруппы и гидроксигруппы,

их таутомеры, их диастереомеры, их энантиомеры, их смеси и их соли.

6. Соединения общей формулы (I) по п. 1, в которой

A, U, V, W, X и R^1 имеют указанные в п. 1 значения, а

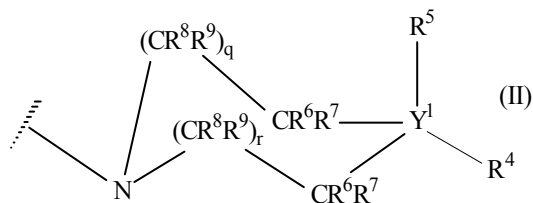
R^2 обозначает фенилметильную группу или C_2 - C_7 алкильную группу, которая может быть замещена в ω -положении фенильной группой, ами-

ногруппой, алкиламиногруппой или диалкиламиногруппой, при этом вышеуказанная фенильная группа может быть замещена амино- C_1 - C_3 -алкильной, C_1 - C_3 алкиламино- C_1 - C_3 алкильной или ди(C_1 - C_3 алкил)амино- C_1 - C_3 алкильной группой,

R^3 обозначает атом водорода или C_1 - C_3 алкильную группу,

R^2 и R^3 совместно с атомом азота, к которому они присоединены, обозначают 7-диметиламинометил-1,2,4,5-тетрагидро-3-бензазепин-3-ильную или 2-амино-4,5,7,8-тетрагидро-1,2,4,5-дизазепин-6-ильную группу либо

R^2 и R^3 совместно с заключенным между ними атомом азота образуют остаток общей формулы (II)



в которой Y^1 обозначает атом углерода, или же когда R^5 представляет собой свободную пару электронов, обозначает также атом азота,

q и r , когда Y^1 представляет собой атом углерода, обозначают число 0 или 1 либо

q и r , когда Y^1 представляет собой атом азота, обозначают число 1 или 2,

R^4 обозначает атом водорода,

фенильную, бензильную или пиридинильную группу, каждая из которых может быть замещена атомом фтора, хлора или брома, трифторметилкарбонильной группой, метильной группой или метоксигруппой,

гидроксигруппу, карбоксигруппу, метильную группу, трифторметильную группу, *n*-пропильную группу, фенильную группу, *p*-толилную группу, *p*-трифторметилкарбонилфенильную группу, *p*-(3-диметиламинопропил)фенильную группу, аминогруппу, бензильную группу, трет-бутиламиногруппу, диметиламиногруппу, диэтиламиногруппу, диэтиламинометильную группу, 2-диметиламиноэтильную группу, 2-диэтиламиноэтильную группу, 5-аминопентильную группу, метоксикарбонильную группу, метоксикарбонилметильную группу, пергидроазепин-1-ильную группу, 4-метилпергидро-1,4-дизазепин-1-ильную группу, 1-метил-1-пиперидинил-4-ильную группу, 4-пиперазин-1-ильную группу, 4-ацетилпиперазин-1-ильную группу, 4-циклопропилметилпиперазин-1-ильную группу, пирролидин-1-ильную группу, 4-этилпиперазин-1-ильную группу, 4-изопропилпиперазин-1-ильную группу, пиперидин-1-ильную группу, пипери-

дин-4-ильную группу, морфолин-4-ильную группу, 4,4-дифтор-1-пиперидин-1-ильную группу, 1-метил-1-азабицикло[3.2.1]окт-4-ильную группу, 4-метилпиперазин-1-ильную группу, 4-этилпиперазин-1-ильную группу, 1-метилпиперидин-1-ильную группу, 4-карбоксиметилпиперазин-1-ильную группу, 1-карбоксиметилпиперидин-4-ильную группу, 4-бензилоксикарбонилпиперазин-1-ильную группу, 1-этоксикарбонилметилпиперидин-4-ильную группу, азетидин-1-ильную группу, 5-метил-2,5-дизабицикло[2.2.1]гепт-2-ильную группу, 1-бензилпиперидин-4-ильную группу, 4-бензилпиперазин-1-ильную группу, 4-диметиламинометил-1-фенильную группу, 2,2,2-трифторэтилпиперазин-1-ильную группу, 1-метилсульфонилпиперидин-4-ильную группу, пиперидин-1-илметильную группу, 1-метилпиперидин-4-иламиногруппу, метилсульфонаминогруппу, *N*-метилсульфонил-*N*-метиламиногруппу, *N*-(циклопентил)метиламиногруппу, 1,1-диоксо- λ^6 -изотиазолидин-2-ильную группу, 2-оксопергидро-1,3-оксазин-3-ильную группу, циклогексильную группу, 2-оксоимидазолидин-1-ильную группу, 2-метилимидазол-1-ильную группу, 4-метилимидазол-1-ильную группу, 4-тиазол-2-ильную группу, 2,4-диметилимидазол-1-ильную группу, 4-имидазол-1-ильную группу, 1,2,4-триазол-1-ильную группу, 1-азабицикло[2.2.2]окт-3-ильную группу, 1-метилпиперидин-4-илметилсульфонильную группу, 1*H*-имидазол-4-ильную группу, 4-этоксикарбонилметилпиперазин-1-ильную группу, 1-этоксикарбонилпиперидин-4-ильную группу, 4-трет-бутоксикарбонилметилпиперазин-1-ильную группу, 1-(2,2,2-трифторэтил)пиперидин-4-ильную группу, 4-метилсульфонилпиперазин-1-ильную группу, 2-карбокси-4-метилпиперазин-1-ильную группу, 3-карбокси-4-метилпиперазин-1-ильную группу, 2-этоксикарбонил-4-метилпиперазин-1-ильную группу, 3-этоксикарбонил-4-метилпиперазин-1-ильную группу или 4-(2,2,2-трифторэтил)пиперазин-1-ильную группу,

R^5 обозначает атом водорода, метильную группу, или же когда Y^1 представляет собой атом азота, обозначает также свободную пару электронов либо

R^4 и R^5 совместно, когда Y^1 представляет собой атом углерода, обозначают 1-метилпиперидин-4-илиденовую, циклогексиденовую или имидазолидин-2,4-дион-5-илиденовую группу, каждый из R^6 и R^7 обозначает атом водорода или диметиламиногруппу и

каждый из R^8 и R^9 обозначает атом водорода, карбоксигруппу или этоксикарбонильную группу, при этом все вышеуказанные алкильные группы, а также присутствующие в других остатках ал-

кильные группы содержат, если не указано иное, от 1 до 7 атомов углерода и могут быть неразветвленными или разветвленными, а вышеуказанные ароматические и гетероароматические остатки дополнительно могут быть одно-, дву- либо тризамещены идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора и брома, цианогруппы и гидроксигруппы,

их таутомеры, их диастереомеры, их энантиомеры, их смеси и их соли.

7. Соединения общей формулы (I) по п. 1, в которой

A обозначает атом кислорода, цианиминогруппу или фенилсульфолиминогруппу,

X обозначает атом кислорода, иминогруппу или метиленовую группу,

U обозначает неразветвленную C₁-C₆алкильную, C₂-C₆алкенильную или C₂-C₆алкинильную группу, в которой каждая метиленовая группа может быть замещена 1-2 атомами фтора, а метильная группа может быть замещена 1-3 атомами фтора,

V обозначает аминогруппу или гидроксигруппу,

W обозначает атом водорода, хлора или брома или трифторметильную группу,

R¹ обозначает однократно ненасыщенный 5-7-членный диаза- или триазагетероцикл,

при этом вышеуказанные гетероциклы присоединены через атом азота, содержат карбонильную группу, смежную с атомом азота, и дополнительно могут быть замещены по атому углерода фенильной группой, а олефиновая двойная связь одного из вышеуказанных ненасыщенных гетероциклов может быть сконденсирована с фенильным, тиенильным или хинолиновым кольцом,

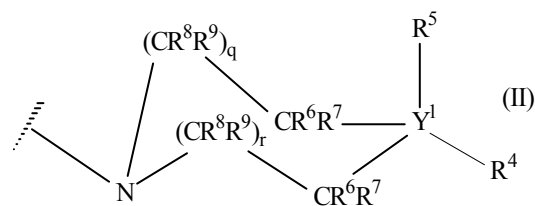
причем содержащиеся в R¹ фенильные группы, а также сконденсированные с бензолом гетероциклы дополнительно могут быть одно-, дву- либо тризамещены в углеродном скелете идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора, брома и йода, метильной группы, метоксигруппы, нитрогруппы, дифторметильной группы, трифторметильной группы, гидроксигруппы, аминогруппы, алкиламиногруппы, диалкиламиногруппы, ацетиламиногруппы, ацетильной группы, цианогруппы, дифторметоксигруппы и трифторметоксигруппы, предпочтительно, однако, являются незамещенными или однозамещены атомом фтора, хлора или брома, метильной группой или метоксигруппой,

R² обозначает атом водорода либо фенилметильную группу или C₂-C₇алкильную группу, которая может быть замещена в ω-положении фенильной группой, пиридиновой

группой, гидроксигруппой, аминогруппой, алкиламиногруппой, диалкиламиногруппой, алкоксикарбонильной группой, карбоксигруппой, аминокарбонильной группой, аминокарбониламиногруппой, ацетиламиногруппой, 1-пирролидинильной группой, 1-пиперидинильной группой, 4-морфолинильной группой или [бис-(2-гидроксиэтил)]аминогруппой,

при этом вышеуказанные гетероциклические остатки и фенильные группы дополнительно могут быть одно-, дву- либо тризамещены в углеродном скелете идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора, брома и йода, метильной группы, алкоксигруппы, дифторметильной группы, трифторметильной группы, гидроксигруппы, аминогруппы, C₁-C₃алкиламиногруппы, ди(C₁-C₃алкил)аминогруппы, ацетиламиногруппы, аминокарбонильной группы, цианогруппы, дифторметоксигруппы, трифторметоксигруппы, амина-C₁-C₃алкильной группы, C₁-C₃алкиламино-C₁-C₃алкильной группы и ди(C₁-C₃алкил)амино-C₁-C₃алкильной группы,

R³ обозначает атом водорода или C₁-C₃алкильную группу, при этом указанная C₁-C₃алкильная группа может быть соединена с присутствующей в R² алкильной группой или присутствующим в R² фенильным или пиридиновым кольцом и атомом азота, к которому они присоединены, с образованием 5-7-членного кольца, либо R² и R³ совместно с заключенным между ними атомом азота образуют остаток общей формулы (II)



в которой Y¹ обозначает атом углерода, или же когда R⁵ представляет собой свободную пару электронов, обозначает также атом азота, q и r, когда Y¹ представляет собой атом углерода, обозначают число 0 или 1 либо q и r, когда Y¹ представляет собой атом азота, обозначают число 1 или 2,

R⁴ обозначает атом водорода, гидроксигруппу, аминогруппу, алкиламиногруппу, C₃-C₆циклоалкиламиногруппу, N-(C₃-C₆циклоалкил)алкиламиногруппу, диалкиламиногруппу, алкильную группу, трифторметильную группу, C₃-C₆циклоалкильную группу, диалкиламино-C₂-C₇алкильную группу, карбоксиалкильную группу, алкоксикарбонилалкильную группу, алкилсульфонильную группу, алкилсульфолиаминогруппу или N-(ал-

килсульфонил)алкиламиногруппу, или же когда Y^1 не представляет собой атом азота, обозначает также карбоксигруппу или диалкиламинометильную группу либо обозначает фенильную, фенил- C_1 - C_3 алкильную, пиридинильную или диазинильную группу, каждая из которых может быть замещена атомом фтора, хлора или брома, трифторметилкарбонильной группой, метильной группой или метоксигруппой, насыщенную или одно- либо многократно ненасыщенную 4-7-членную азацicloалкильную группу, 5-7-членную оксаза-, диаза- или триазацicloалкильную группу, 7-9-членную азабицикло- или диазабициклоалкильную группу, 1-алкил-4-пиперидиниламиногруппу или 1-алкил-4-пиперидинил-аминосульфонильную группу, при этом вышеуказанные моно- и бициклические гетероциклы присоединены через атом азота или углерода,

метиленовая группа в вышеуказанных моно- и бициклических гетероциклах может быть заменена на карбонильную или сульфонильную группу,

в вышеуказанных моно- и бициклических гетероциклах не связанная непосредственно с атомом азота, кислорода или серы метиленовая группа может быть замещена одним или двумя атомами фтора,

вышеуказанные моно- и бициклические гетероциклы могут быть замещены одной или двумя C_1 - C_3 алкильными группами, в которых каждая метиленовая группа может быть замещена 1-2 атомами фтора, а каждая метильная группа может быть замещена 1-3 атомами фтора, и/или могут быть замещены C_3 - C_6 циклоалкил- C_1 - C_3 алкильной группой, бензильной группой, C_1 - C_4 алканоильной группой, ди(C_1 - C_3 алкил)аминогруппой, C_1 - C_3 алкилсульфонильной группой, алкоксикарбонильной группой, бензилоксикарбонильной группой, алкоксикарбонилалкильной группой, карбоксигруппой или карбоксиалкильной группой,

R^5 обозначает атом водорода, C_1 - C_3 алкильную группу или алкоксикарбонильную группу, либо когда Y^1 представляет собой атом азота, обозначает также свободную пару электронов либо R^4 и R^5 совместно, когда Y^1 представляет собой атом углерода, обозначают 5-6-членное циклоалифатическое кольцо, в котором одна или две метиленовые группы могут быть заменены на группу -NH- или -N(метил)-, а одна или две другие метиленовые группы могут быть заменены на одну, соответственно две карбонильные группы,

R^6 и R^7 могут иметь идентичные или различные значения и каждый из них обозначает атом водо-

рода, C_1 - C_3 алкильную группу или ди(C_1 - C_3 алкил)аминогруппу и

R^8 и R^9 могут иметь идентичные или различные значения и каждый из них обозначает атом водорода, C_1 - C_3 алкильную группу, карбоксигруппу или C_1 - C_3 алкоксикарбонильную группу,

при этом все вышеуказанные алкильные группы или присутствующие в вышеуказанных остатках алкильные группы содержат, если не указано иное, от 1 до 7 атомов углерода и могут быть разветвленными или неразветвленными, а вышеуказанные ароматические и гетероароматические остатки дополнительно могут быть одно-, дву- либо тризамещены идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора и брома, цианогруппы и гидроксигруппы,

их таутомеры, их энантиомеры, их диастереомеры, их смеси и их соли.

8. Соединения общей формулы (I) по п. 1, в которой

A обозначает атом кислорода,

X обозначает атом кислорода, иминогруппу или метиленовую группу,

U обозначает метильную, этильную, C_2 - C_4 алкильную или C_2 - C_4 алкинильную группу, в которой метиленовая группа может быть замещена 1-2 атомами фтора, а метильная группа может быть замещена 1-3 атомами фтора,

V обозначает аминогруппу или гидроксигруппу, W обозначает атом водорода, хлора или брома или трифторметильную группу,

R^1 обозначает 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бензодиазепин-3-ил)пиперидин-1-ильную, 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2H-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ильную, 4-(5-оксо-3-фенил-4,5-дигидро-1,2,4-триазол-1-ил)пиперидин-1-ильную, 4-(2-оксо-1,2-дигидроимидазо[4,5-c]хинолин-3-ил)пиперидин-1-ильную, 4-(2-оксо-1,2-дигидро-4H-тиено[3,4-d]-пиримидин-3-ил)пиперидин-1-ильную, 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2H-тиено[3,2-d]пиримидин-3-ил)пиперидин-1-ильную, 4-(5-оксо-4,5,7,8-тетрагидро-2-тиа-4,6-диазаазулен-6-ил)пиперидин-1-ильную, 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидротииено[3,2-d]-1,3-дiazепин-3-ил)пиперидин-1-ильную, 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидротииено[2,3-d]-1,3-дiazепин-3-ил)пиперидин-1-ильную или 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2H-тиено[2,3-d]пиримидин-3-ил)пиперидин-1-ильную группу,

при этом вышеуказанные моно- и бициклические гетероциклы дополнительно могут быть однозамещены в углеродном скелете метоксигруппой,

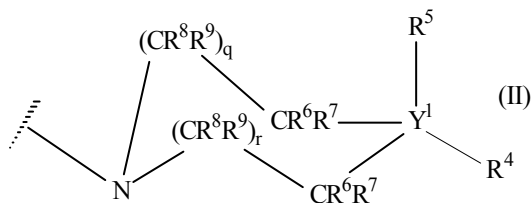
R^2 обозначает фенилметильную группу или C_2 - C_7 алкильную группу, которая может быть замещена в ω -положении фенильной группой, ами-

ногруппой, алкиламиногруппой или диалкиламиногруппой, при этом вышеуказанная фенильная группа может быть замещена амино-С₁-С₃алкильной группой, С₁-С₃алкиламино-С₁-С₃алкильной группой или ди(С₁-С₃алкил)амино-С₁-С₃алкильной группой,

R³ обозначает атом водорода или С₁-С₃алкильную группу,

R² и R³ совместно с атомом азота, к которому они присоединены, обозначают 7-диметиламинометил-1,2,4,5-тетрагидро-3-бензазепин-3-ильную или 2-амино-4,5,7,8-тетрагидро-1,2,4,5-д]азепин-6-ильную группу либо

R² и R³ совместно с заключенным между ними атомом азота образуют остаток общей формулы (II)



в которой Y¹ обозначает атом углерода, или же когда R⁵ представляет собой свободную пару электронов, обозначает также атом азота,

q и r, когда Y¹ представляет собой атом углерода, обозначают число 0 или 1 либо

q и r, когда Y¹ представляет собой атом азота, обозначают число 1 или 2,

R⁴ обозначает атом водорода,

фенильную, бензильную или пиридинильную группу, каждая из которых может быть замещена атомом фтора, хлора или брома, трифторметилкарбонильной группой, метильной группой или метоксигруппой,

гидроксигруппу, карбоксигруппу, метильную группу, трифторметильную группу, н-пропильную группу, фенильную группу, п-толильную группу, п-трифторметилкарбонилфенильную группу, п-(3-диметиламинопропил)фенильную группу, аминогруппу, бензильную группу, трет-бутиламиногруппу, диметиламиногруппу, диэтиламиногруппу, диэтиламинометильную группу, 2-диметиламиноэтильную группу, 2-диэтиламиноэтильную группу, 5-аминопентильную группу, метоксикарбонильную группу, метоксикарбонилметильную группу, пергидроазепин-1-ильную группу, 4-метилпергидро-1,4-дiazepин-1-ильную группу, 1-метил-1-пиперидинил-4-ильную группу, 4-пиперазин-1-ильную группу, 4-ацетилпиперазин-1-ильную группу, 4-циклопропилметилпиперазин-1-ильную группу, пирролидин-1-ильную группу, 4-этилпиперазин-1-ильную группу, 4-изопропилпиперазин-1-ильную группу, пиперидин-1-ильную группу, пипери-

дин-4-ильную группу, морфолин-4-ильную группу, 4,4-дифтор-1-пиперидин-1-ильную группу, 1-метил-1-азабицикло[3.2.1]окт-4-ильную группу, 4-метилпиперазин-1-ильную группу, 4-этилпиперазин-1-ильную группу, 1-метилпиперидин-1-ильную группу, 4-карбоксиметилпиперазин-1-ильную группу, 1-карбоксиметилпиперидин-4-ильную группу, 4-бензилоксикарбонилпиперазин-1-ильную группу, 1-этоксикарбонилметилпиперидин-4-ильную группу, азетидин-1-ильную группу, 5-метил-2,5-дiazabiцикло[2.2.1]гепт-2-ильную группу, 1-бензилпиперидин-4-ильную группу, 4-бензилпиперазин-1-ильную группу, 4-диметиламинометил-1-фенильную группу, 2,2,2-трифторэтилпиперазин-1-ильную группу, 1-метилсульфонилпиперидин-4-ильную группу, пиперидин-1-илметильную группу, 1-метилпиперидин-4-иламиногруппу, метилсульфониламиногруппу, N-метилсульфонил-N-метиламиногруппу, N-(циклопентил)метиламиногруппу, 1,1-диоксо-λ⁶-изотиазолидин-2-ильную группу, 2-оксопергидро-1,3-оксазин-3-ильную группу, циклогексильную группу, 2-оксоимидазолидин-1-ильную группу, 2-метилимидазол-1-ильную группу, 4-метилимидазол-1-ильную группу, 4-тиазол-2-ильную группу, 2,4-диметилимидазол-1-ильную группу, 4-имидазол-1-ильную группу, 1,2,4-триазол-1-ильную группу, 1-азабицикло[2.2.2]окт-3-ильную группу, 1-метилпиперидин-4-илметилсульфонильную группу, 1H-имидазол-4-ильную группу, 4-этоксикарбонилметилпиперазин-1-ильную группу, 1-этоксикарбонилпиперидин-4-ильную группу, 4-трет-бутоксикарбонилметилпиперазин-1-ильную группу, 1-(2,2,2-трифторэтил)пиперидин-4-ильную группу, 4-метилсульфонилпиперазин-1-ильную группу, 2-карбокси-4-метилпиперазин-1-ильную группу, 3-карбокси-4-метилпиперазин-1-ильную группу, 2-этоксикарбонил-4-метилпиперазин-1-ильную группу или 4-(2,2,2-трифторэтил)пиперазин-1-ильную группу,

R⁵ обозначает атом водорода, метильную группу, или же когда Y¹ представляет собой атом азота, обозначает также свободную пару электронов либо

R⁴ и R⁵ совместно, когда Y¹ представляет собой атом углерода, обозначают 1-метилпиперидин-4-илиденовую, циклогексиденовую или имидазолидин-2,4-дион-5-илиденовую группу, каждый из R⁶ и R⁷ обозначает атом водорода или диметиламиногруппу и каждый из R⁸ и R⁹ обозначает атом водорода, карбоксигруппу или этоксикарбонильную группу, при этом все вышеуказанные алкильные группы,

а также присутствующие в других остатках алкильные группы содержат, если не указано иное, от 1 до 7 атомов углерода и могут быть неразветвленными или разветвленными, а вышеуказанные ароматические и гетероароматические остатки дополнительно могут быть одно-, дву- либо тризамещены идентичными или различными заместителями, выбранными из атомов фтора, хлора и брома, цианогруппы и гидроксигруппы, их энантиомеры, их диастереомеры и их соли.

9. Соединения общей формулы (I) по п. 1, выбранные из группы, включающей

- (1) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (2) 2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(1'-метил-[4,4']бипиперидинил-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (3) 2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (4) 2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (5) 2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пиридин-4-илпиперазин-1-ил)-бутан-1,4-дион,
- (6) 2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(1-метилпиперидин-4-иламино)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (7) [4-(1-{2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]уксусную кислоту,
- (8) метиловый эфир (1'-{2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксусной кислоты,
- (9) (1'-{2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксусную кислоту,
- (10) [(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-2-оксоэтил]-амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
- (11) [(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-(4-диметиламинопиперидин-1-ил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенз-

диазепин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,

- (12) [(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-оксо-2-(4-пиридин-4-илпиперазин-1-ил)-этил]амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
- (13) [(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-(1'-метил-4,4'-бипиперидинил-1-ил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
- (14) бензиловый эфир 4-[1-((R)-3-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилфенил)-2-{[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино}пропионил)пиперидин-4-ил]пиперазин-1-карбоновой кислоты,
- (15) этиловый эфир [1'-((R)-3-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилфенил)-2-{[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино}пропионил)-4,4'-бипиперидинил-1-ил]уксусной кислоты,
- (16) {(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-2-оксоэтил}амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
- (17) {(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-2-оксоэтил}амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
- (18) [(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-(4-азетидин-1-ил)пиперидин-1-ил]-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
- (19) {(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-[4-(5-метил-2,5-диазабиперидин-2,2,1]гепт-2-ил)пиперидин-1-ил]-2-оксоэтил}амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
- (20) [(R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-оксо-2-(4-пиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил)-этил]амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
- (21) [1'-((R)-3-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилфенил)-2-{[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино}-пропионил)-4,4'-бипиперидинил-1-ил]уксусную кислоту,
- (22) [1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,

- зил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пиридин-4-илпиперазин-1-ил)бутан-1,4-дион,
- (51) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(3-пергидроазепин-1-илазетидин-1-ил)бутан-1,4-дион,
- (52) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(1-бензилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (53) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-бензилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (54) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(7-диметиламинометил-1,2,4,5-тетрагидро-3-бензазепин-3-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-бутан-1,4-дион,
- (55) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-диметиламинометилфенил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (56) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-{4-[4-(2,2,2-трифторэтил)пиперазин-1-ил]пиперидин-1-ил}бутан-1,4-дион,
- (57) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(1'-метансульфонил-4,4'-бипиперидинил-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (58) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(9-метил-3,9-диазапиро[5.5]ундец-3-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (59) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пиперидин-1-илметилпиперидин-1-ил)бутан-1,4-дион,
- (60) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(2-диметиламиноэтил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (61) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-N-метил-N-[2-(1-метилпиперидин-4-ил)этил]-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирамид,
- (62) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-N-метил-N-(1-метилпиперидин-4-илметил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирамид,
- (63) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-пиперидин-1-ил-бутан-1,4-дион,
- (64) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пропилпиперидин-1-ил)бутан-1,4-дион,
- (65) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(4-бензилпиперидин-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (66) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(2-диэтиламиноэтил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (67) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(3-азаспиро[5.5]ундец-3-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (68) N-(1-{(S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}пиперидин-4-ил)-N-метилметансульфон-амид,
- (69) N-(1-{(S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}пиперидин-4-ил)метансульфонамид,
- (70) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(циклопентилметиламино)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (71) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(4-метилпиперидин-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (72) метиловый эфир (1-{(S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}пиперидин-4-ил)уксусной кислоты,
- (73) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(4-гидроксипиперидин-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (74) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-трифторметилпиперидин-1-ил)бутан-1,4-дион,
- (75) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(1,1-диоксо-1,6-изотиазолидин-2-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (76) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(2-оксопергидро-1,3-оксазин-3-ил)пипе-

ридин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(77) метиловый эфир 1-{(S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-карбоновой кислоты,

(78) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(4-циклогексилпиперидин-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)-пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(79) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(4-трет-бутиламинопиперидин-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(80) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-фенилпиперидин-1-ил)бутан-1,4-дион,

(81) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-п-толилпиперидин-1-ил)бутан-1,4-дион,

(82) 8-{(S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-1,3,8-триазаспиро[4.5]декан-2,4-дион,

(83) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(2-оксоимидазолидин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(84) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(4-амино-4-метилпиперидин-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(85) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(86) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(2-амино-4,5,7,8-тетрагидропиазоло[4,5-d]-азепин-6-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(87) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(2-метилимидазол-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(88) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилимидазол-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(89) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-тиазол-2-илпиперазин-1-ил)бутан-1,4-дион,

(90) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(2,4-диметилимидазол-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(91) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-(4-имидазол-1-илпиперидин-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)-пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(92) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-1,2,4-триазол-1-илпиперидин-1-ил)бутан-1,4-дион,

(93) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(1-азабицикло[2.2.2]окт-3-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(94) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-пиперазин-1-ил-бутан-1,4-дион,

(95) (1-метилпиперидин-4-ил)амид 4-{(S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперазин-1-сульфоновой кислоты,

(96) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-N-(5-аминопентил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирамид,

(97) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-N-(3-аминометилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирамид,

(98) 1-{(S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-пиперидин-4-карбоновую кислоту,

(99) (1-{(S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-пиперидин-4-ил)уксусную кислоту,

(100) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(8-метил-8-азабицикло[3.2.1]окт-3-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(101) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пиперазин-1-илпиперидин-1-ил)бутан-1,4-дион,

(102) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(1H-имидазол-4-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(103) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бензди-

азепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-[4-[4-(2,2,2-трифторацетил)фенил]пиперазин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(104) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(105) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(5-оксо-3-фенил-4,5-дигидро-1,2,4-триазол-1-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(106) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2-дигидроимидазо[4,5-с]хинолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(107) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2-дигидро-4Н-тиено[3,4-д]пиримидин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(108) (S)-2-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-1-[4-(5-метил-2,5-диазабицикло[2.2.1]гепт-2-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(109) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпергидро-1,4-дiazепин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(110) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-1-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пергидро-1,4-дiazепин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(111) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-1-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(112) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-1-[4-(1-азабицикло[2.2.2]окт-3-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(113) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(114) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пергидроазепин-1-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(115) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-1-[1,4'-бипиперидинил-1'-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(116) (S)-2-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бензди-

азепин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(117) {(R)-1-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-2-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-2-оксоэтил}амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
(118) {(R)-1-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-2-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-2-оксоэтил}амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
(119) [(R)-1-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-2-1,4'-бипиперидинил-1'-ил-2-оксоэтил]-амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
(120) [(R)-1-(4-амино-3,5-бис-трифторметилбензил)-2-оксо-2-(4-пиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-этил]амид 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
(121) (R)-1-(4-амино-3-хлор-5-трифторметилбензил)-2-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-2-оксоэтиловый эфир 4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
(122) [2-[1,4']бипиперидинил-1'-ил]-1-(4-бром-3-метилбензил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
(123) [1-(4-бром-3-метилбензил)-2-(1'-метил[4,4']бипиперидинил-1-ил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
(124) {1-(4-бром-3-метилбензил)-2-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-2-оксоэтил}-амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
(125) {1-(4-бром-3-метилбензил)-2-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-2-оксоэтил}-амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
(126) этиловый эфир {4-[1-(3-(4-бром-3-метилфенил)-2-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино}пропионил)-пиперидин-4-ил]пиперазин-1-ил}уксусной кислоты,
(127) этиловый эфир [1'-(3-(4-бром-3-метилфенил)-2-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино}пропионил)-[4,4']бипиперидинил-1-ил]уксусной кислоты,
(128) этиловый эфир {4-[4-(3-(4-бром-3-метилфенил)-2-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил]амино}пропионил)пиперазин-1-ил]пиперидин-1-ил}уксусной кислоты,

- (129) {4-[1-(3-(4-бром-3-метилфенил)-2-{{4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил}амино}пропионил)пиперидин-4-ил]-пиперазин-1-ил}уксусную кислоту,
- (130) [1'-(3-(4-бром-3-метилфенил)-2-{{4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил}амино}пропионил)-[4,4']бипиперидинил-1-ил}уксусную кислоту,
- (131) {4-[4-(3-(4-бром-3-метилфенил)-2-{{4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил}амино}пропионил)пиперазин-1-ил]-пиперидин-1-ил}уксусную кислоту,
- (132) 2-(4-бром-3-метилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (133) 2-(4-бром-3-метилбензил)-1-(1'-метил-[4,4']бипиперидинил-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (134) 1-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-2-(4-бром-3-метилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (135) 2-(4-бром-3-метилбензил)-1-{{4-[4-(3-диметиламинопропил)фенил]пиперазин-1-ил}-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион},
- (136) [4-(1-{2-(4-бром-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}пиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил}уксусную кислоту,
- (137) метиловый эфир (1'-{2-(4-бром-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксусной кислоты,
- (138) (1'-{2-(4-бром-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксусную кислоту,
- (139) {1-(4-хлор-3-метилбензил)-2-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-2-оксоэтил}-амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
- (140) [2-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-1-(4-хлор-3-метилбензил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
- (141) {1-(4-хлор-3-метилбензил)-2-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-2-оксоэтил}-амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
- (142) [1-(4-хлор-3-метилбензил)-2-(1'-метил-[4,4']бипиперидинил-1-ил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
- (143) этиловый эфир [1'-(3-(4-хлор-3-метилфенил)-2-{{4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил}амино}пропионил)-[4,4']бипиперидинил-1-ил}уксусной кислоты,
- (144) трет-бутиловый эфир {4-[1-(3-(4-хлор-3-метилфенил)-2-{{4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил}амино}пропионил)пиперидин-4-ил]пиперазин-1-ил}уксусной кислоты,
- (145) {1-(4-хлор-3-метилбензил)-2-оксо-2-[1'-(2,2,2-трифторэтил)-[4,4']бипиперидинил-1-ил]-этил}амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
- (146) (1-(4-хлор-3-метилбензил)-2-оксо-2-{{4-[4-(2,2,2-трифторэтил)пиперазин-1-ил]пиперидин-1-ил}этил)амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
- (147) [1'-(3-(4-хлор-3-метилфенил)-2-{{4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбонил}амино}пропионил)-[4,4']бипиперидинил-1-ил}уксусную кислоту,
- (148) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-[4-(4-этилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (149) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-(1'-метил-[4,4']бипиперидинил-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (150) 1-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (151) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (152) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (153) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-[4-(4-метансульфонилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (154) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-[4-(4-изопропилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
- (155) этиловый эфир 1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-2-карбоновой кислоты,
- (156) этиловый эфир 1-(1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназо-

лин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)-4-метилпиперазин-2-карбоновой кислоты,
(157) этиловый эфир 4-(1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)-1-метилпиперазин-2-карбоновой кислоты,
(158) этиловый эфир 4-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-1-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-2-карбоновой кислоты,
(159) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-[1'-(2,2,2-трифторэтил)-[4,4']бипиперидинил-1-ил]бутан-1,4-дион,
(160) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-[4-[4-(2,2,2-трифторэтил)пиперазин-1-ил]пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(161) [4-(1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]уксусную кислоту,
(162) метиловый эфир (1'-(2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксусной кислоты,
(163) (1'-(2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксусную кислоту,
(164) 1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-2-карбоновую кислоту,
(165) 1-(1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)-4-метилпиперазин-2-карбоновую кислоту,
(166) 4-(1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)-1-метилпиперазин-2-карбоновую кислоту,
(167) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(168) 2-(4-хлор-3-метилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,2,4,5-тетрагидро-1,3-бенздиазепин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(169) [4-(1-{2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(5-оксо-3-фенил-4,5-дигидро-1,2,4-триазол-1-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]уксусную кислоту,

(170) метиловый эфир (1'-(2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(5-оксо-3-фенил-4,5-дигидро-1,2,4-триазол-1-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-4,4'-бипиперидинил-1-ил)уксусной кислоты,
(171) (1'-(2-(4-хлор-3-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(5-оксо-3-фенил-4,5-дигидро-1,2,4-триазол-1-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-4,4'-бипиперидинил-1-ил)уксусную кислоту,
(172) 2-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(173) 2-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-1-(1'-метил-[4,4']бипиперидинил-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(174) 2-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]-1-(4-пиридин-4-илпиперазин-1-ил)бутан-1,4-дион,
(175) 2-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-1-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,
(176) [4-(1-{2-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]уксусную кислоту,
(177) метиловый эфир (1'-(2-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксусной кислоты,
(178) (1'-(2-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксусную кислоту,
(179) {1-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-2-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-2-оксоэтил}амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
(180) [2-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-1-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
(181) {1-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-2-[4-(1-метилпиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]-2-оксоэтил}амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
(182) [1-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-2-(1'-метил-[4,4']бипиперидинил-1-ил)-2-оксоэтил]амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,
(183) [1-(3-бром-4-хлор-5-метилбензил)-2-оксо-2-(4-пиридин-4-илпиперазин-1-ил)этил]амид 4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-карбоновой кислоты,

(184) 2-(4-хлор-3-трифторметилбензил)-1-(1'-метил-[4,4']бипиперидинил-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(185) 2-(4-хлор-3-трифторметилбензил)-1-[4-(4-метилпиперазин-1-ил)пиперидин-1-ил]-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(186) 1-[1,4']бипиперидинил-1'-ил-2-(4-хлор-3-трифторметилбензил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

(187) [4-(1-{2-(4-хлор-3-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил} пиперидин-4-ил)пиперазин-1-ил]уксусную кислоту,

(188) метиловый эфир (1'-{2-(4-хлор-3-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксусной кислоты,

(189) (1'-{2-(4-хлор-3-трифторметилбензил)-4-оксо-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутирил}-[4,4']бипиперидинил-1-ил)уксусную кислоту,

(190) 2-(4-хлор-3-трифторметилбензил)-1-(1'-метил-[4,4']бипиперидинил-1-ил)-4-[4-(2-оксо-1,4-дигидро-2Н-хиназолин-3-ил)пиперидин-1-ил]бутан-1,4-дион,

их энантиомеры, их диастереомеры и их соли.

10. Соединение по одному из предыдущих пунктов, которое представляет собой физиологически совместимую соль с неорганическими или органическими кислотами или основаниями.

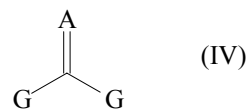
11. Лекарственное средство, обладающее CGRP-ингибирующей активностью, содержащее соединение по любому из пп. 1-9 или физиологически совместимую соль по п. 10 в эффективном количестве, а также необязательно один или несколько инертных носителей и/или разбавителей.

12. Способ получения лекарственного средства по п. 11, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что соединение по любому из пп. 1-10 нехимическим путем объединяют с одним или несколькими инертными носителями и/или разбавителями.

13. Способ получения соединений общей формулы (I) по любому из пп. 1-9, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что для получения соединений общей формулы (I), в которой X обозначает атом кислорода или группу NH, а R¹-R³ имеют указанные в п. 1 значения, при условии, что эти группы не содержат свободную карбоксильную функцию, пиперидины общей формулы (III)



в которой R¹ имеет указанные в п. 1 значения, подвергают взаимодействию (I) с производными угольной кислоты общей формулы (IV)

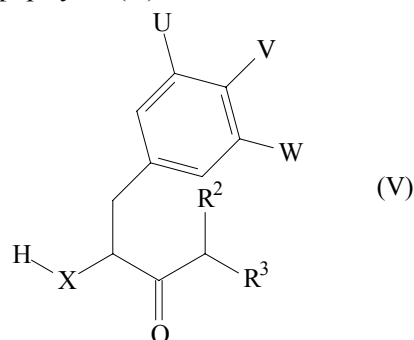


в которой А имеет указанные в п. 1 значения, а G обозначает нуклеофобную группу, такую как феноксигруппа, 1Н-имидазол-1-ильная группа, 1-Н-1,2,4-триазол-1-ильная группа, трихлорметоксигруппа или 2,5-диоксопирролидин-1-илоксигруппа, при условии, что X представляет собой группу -NH, или

(II) с производными угольной кислоты общей формулы (IV)



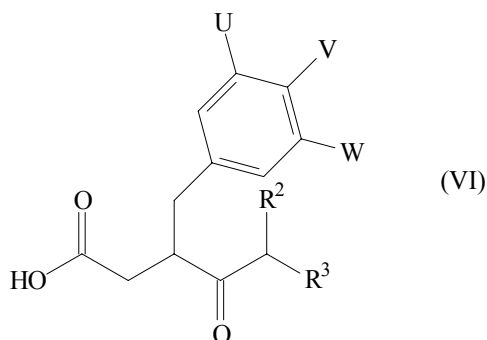
в которой А обозначает атом кислорода, а G обозначает нуклеофобную группу, такую как феноксигруппа, 1Н-имидазол-1-ильная группа, 1-Н-1,2,4-триазол-1-ильная группа, трихлорметоксигруппа или 2,5-диоксопирролидин-1-илоксигруппа, при этом оба G могут быть идентичными или различными, при условии, что X представляет собой атом кислорода, и с соединениями общей формулы (V)



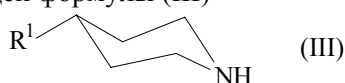
в которой X обозначает атом кислорода или группу -NH, а U, V, W, R² и R³ имеют указанные в п. 1 значения, при условии, что R² и R³ не содержат свободную карбоксильную функцию и/или другую свободную первичную или вторичную алифатическую аминofункцию либо другую свободную гидроксифункцию.

14. Способ получения соединений общей формулы (I) по любому из пп. 1-9, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что для получения соединений общей формулы (I), в которой X обозначает метиленовую группу, а R¹-R³ имеют указанные в п. 1 значения, при условии, что эти группы не содержат свободную карбоксильную функцию и/или другую свободную первичную или вторичную али-

фатическую аминофункцию, карбоновую кислоту общей формулы (VI)

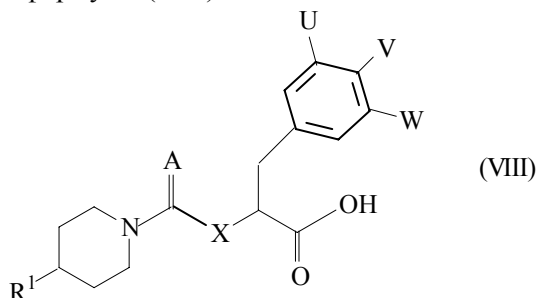


в которой U, V, W, R² и R³ имеют указанные в п. 1 значения, подвергают сочетанию с пиперидином общей формулы (III)



в которой R¹ имеет указанные в п. 1 значения.

15. Способ получения соединений общей формулы (I) по любому из пп. 1-9, отличающийся тем, что для получения соединений общей формулы (I), в которой все остатки имеют указанные в п. 1 значения, карбоновую кислоту общей формулы (VIII)



в которой все остатки имеют указанные в п. 1 значения, подвергают сочетанию с амином общей формулы HNR²R³, в которой R² и R³ имеют указанные в п. 1 значения, при условии, что эти группы не содержат свободную карбоксильную функцию и/или другую свободную первичную или вторичную алифатическую аминофункцию.

(11) IAP 03634

(13) C

(51) 8 C 07 D 413/00, C 07 D 403/00, C 07 D 211/00, A 61 K 31/537, A 61 K 31/496, A 61 K 31/4523, A 61 P 35/00

(21) IAP 2006 0040

(22) 08.07.2004

(31)(32)(33) 60/485,814, 09.07.2003, US

(71)(73) Фармация Италия С.п.А., IT

(72) ФАНЧЕЛЛИ, Даниеле; ФОРТЕ, Барбара; МОЛЛЬ, Юрген; ВАРАЗИ, Марио; ВИАНЕЛЛО, Паола, IT

(85) 09.02.2006

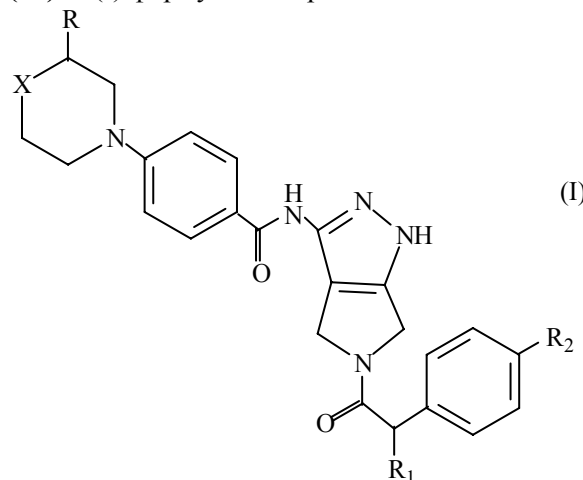
(86) PCT/EP 2004/007515, 08.07.2004

(87) WO 2005/005427, 20.01.2005

(54) Киназа ингибиторлари каби фаолликга эга бўлган пирроло [3,4-С] пиразол ҳосилалари

Производные пирроло [3,4-С] пиразола, обладающие активностью как ингибиторы киназы

(57) 1. (I) формулалари бирикма



унда

R водород ёки метилдан иборат;

R₁ гидроксид ёки чизикли ёки тармоқланган C₁-C₃ алкил ёки алкоксигуруҳдан иборат;

R₂ водород ёки галоген атомидан иборат;

X (-CH₂-) метилден ёки (-CHF-)фторметилден танланган иккивалентли гуруҳдан иборат, ёки X гетероатом ёки кислород (-O-) ёки азот (-NR') дан танланган гетероатом гуруҳини бирдиради, бунда R' водород атоми, чизикли ёки тармоқланган C₁-C₄ алкил гуруҳи ёки C₃-C₆ циклоалкил гуруҳидан иборат;

ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи.

2. 1-банд бўйича (I) формулалари бирикмада R водород ёки метилни билдиради; R₁ гидроксид, метил ёки метоксидан танланган; R₂ водород ёки фтор атомни билдиради; X метилден, трифторметилден, -O- ёки -NR' дан танланган, бунда R' 10-бандда аниқланган кўрсаткичларнга тенг .

3. 1-банд бўйича ўзининг фармацевтик мувофиқ тузи шаклида бўлиши шарт бўлмаган ва ўз ичига қуйидагиларни олган (I) формулалари бирикма:

(1) N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-метилпиперазин-1-ил)бензамид;

(2) N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-этилпиперазин-1-ил)бензамид;

(3) N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-изопропилпиперазин-1-ил)бензамид;

- (4) N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)бензамид;
- (5) 4-(3,4-диметилпиперазин-1-ил)-N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил} бензамид;
- (6) N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-пиперидин-1-илбензамид;
- (7) 4-(4-фторпиперидин-1-ил)-N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил} бензамид;
- (8) N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-морфолин-4-илбензамид;
- (9) 4-(4-трет-бутилпиперазин-1-ил)-N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил} бензамид;
- (10) N-{5-[(2R)-2-гидрокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-метилпиперазин-1-ил)бензамид;
- (11) N-{5-[(2R)-2-метил-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-метилпиперазин-1-ил)бензамид;
- (12) N-{5-[(2R)-2-метил-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-этилпиперазин-1-ил)бензамид;
- (13) N-{5-[(2R)-2-метил-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-изопропилпиперазин-1-ил)бензамид;
- (14) N-{5-[(2R)-2-метил-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)бензамид;
- (15) 4-(3,4-диметилпиперазин-1-ил)-N-{5-[(2R)-2-фенилпропаноил]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил} бензамид;
- (16) N-{5-[(2R)-2-фенилпропаноил]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-пиперидин-1-илбензамид;
- (17) 4-(4-фторпиперидин-1-ил)-N-{5-[(2R)-2-метил-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил} бензамид;
- (18) N-{5-[(2R)-2-метил-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-морфолин-4-илбензамид;
- (19) 4-(4-трет-бутилпиперазин-1-ил)-N-{5-[(2R)-2-фенилпропаноил]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил} бензамид.

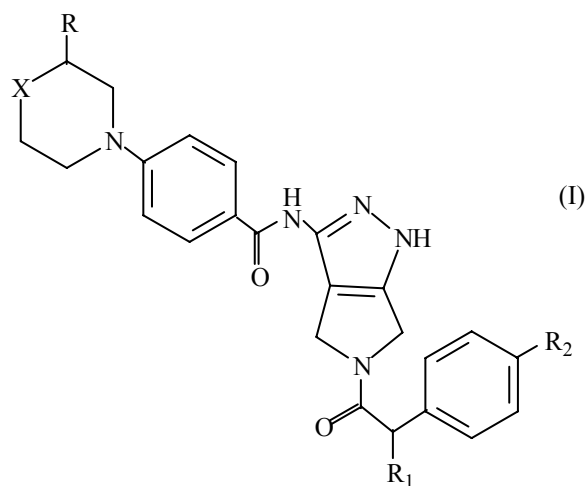
4. Протеинкиназанинг ўзгарган фаоллиги билан боғлиқ ва/ёки унинг туфайли вужудга келган хужайра пролифератив хасталигин даволаш учун, таркибида 1-бандда аниқланган (I) формулани бирикма ёки унинг фармацевтик мувофиқ

тузининг терапевтик самарали микдори, ва камида битта фармацевтик мувофиқ тўлдирувчи, ташувчи ва/ёки суялтирувчи бўлган фармацевтик композиция.

5. 4-банд бўйича қўшимча равишда битта ёки бир нечта химиотерапевтик агентларни ўз ичига олган фармацевтик композиция.

6. Саратонга қарши терапияда бир вақтда, ажратиб ёки кетма-кет қўллаш учун комбинацияланган препарат сифатидаги 1-бандда аниқланган (I) формулани бирикма ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи ёки уларнинг 4-бандда аниқланган фармацевтик композициялари, ва битта ёки бир нечта химиотерапевтик агентларни ўз ичига олган тўплам.

7. (I) формулани бирикмани



унда

R водород ёки метилдан иборат;

R₁ гидрокси ёки чизикли ёки тармоқли C₁-C₃ алкил ёки алкоксигуруҳдан иборат;

R₂ водород ёки галоген атомидан иборат;

X метилен (-CH₂-) ёки фторметилен (-CHF-)дан танланган иккивалентли гуруҳдан иборат, ёки X гетероатом ёки кислород (-O-) ёки азот(-NR')дан танланган гетероатом гуруҳини билдиради, бунда R' водород атоми, чизикли ёки тармоқли C₁-C₄ алкил гуруҳи ёки C₃-C₆ циклоалкил гуруҳдан иборат;

ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузининг самарали микдорини даволанишга муҳтож сўт эмизувчига киритишни ўз ичига олган протеинкиназанинг ўзгарган фаоллиги билан боғлиқ ва/ёки унинг туфайли вужудга келган хужайра пролифератив хасталигин даволаш усули.

8. 7-банд бўйича Авроракиназанинг ўзгарган фаоллиги билан боғлиқ ва/ёки унинг туфайли вужудга келган хужайра пролифератив хасталигини даволаш усули.

9.8-банд бўйича усулда Авроракиназа Аврора-2 дан иборат.

10. 7-банд бўйича усулда хужайра пролифератив хасталиги саратон, Альцгеймер касаллиги, вирусли инфекциялар, аутоиммунли хасталиклар ва нейродегенератив хасталикларни ўз ичига олган гуруҳдан танланган.

11. 10 банд бўйича усулда саратон карцинома, яссиҳужайрали карцинома, келиб чиқиши миелоидли ёки лимфоидли бўлган гемопоэтик хавфли шишлар, келиб чиқиши мезенхимли бўлган хавфли шишлар, марказий ва периферия асаб тизимининг хавфли шишлари, меланома, семинома, тератокарцинома, остеосаркома, пигментозли ксеродерма, кератоксантома, қалқонсимон безнинг фолликуляр саратони ва Капоши саркомасини ўз ичига олган гуруҳдан танланган.

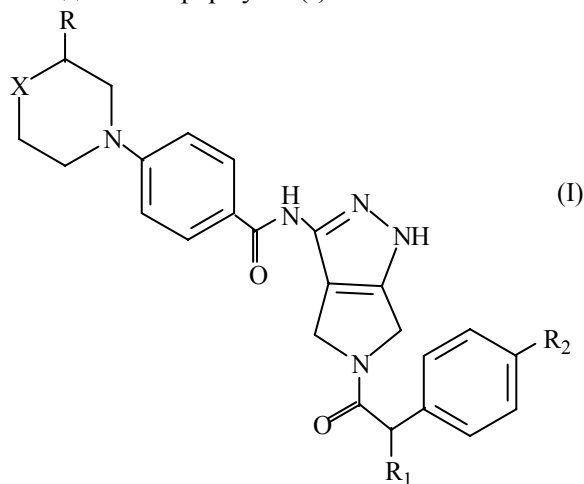
12. 7-банд бўйича усулда хужайра пролифератив хасталиги хавфлимас простата гиперплазияси, оилавий аденоматозли полипоз, нейрофиброматоз, псориаз, атеросклероз билан боғлиқ томирлар силлик мушаклари хужайраларининг пролиферацияси, ўпка фибрози, артрит, гломеруло-нефрит ва операциядан кейинги стеноз ва рестенозни ўз ичига олган гуруҳдан танланган.

13. 7-банд бўйича, қўшимча равишда давола-нишга мухтож сут эмизувчига камида битта цитостатик ёки цитотоксик агент билан комбинациядаги кимётерапевтик схема ёки нур терапияси таъсирини ўз ичига олган усул.

14. 7-банд бўйича усулда унга мухтож бўлган сут эмизувчи инсондан иборат.

15. Ушбу киназанинг 1-бандда кўрсатилган бирикманинг самарали микдори билан бирикишни ўз ичига олган Аврора-2-киназа фаоллигини ингибирлаш усули .

1. Соединение формулы (I)



в которой

R представляет собой водород или метил;

R₁ представляет собой гидроксильную или линейную или разветвленную C₁-C₃ алкил или алкоксигруппу;

R₂ представляет собой водород или атом галогена;

X представляет собой двухвалентную группу, выбранную из метилена (-CH₂-) или фторметилена (-CHF-), или X означает гетероатом или гетероатомную группу, выбранную из кислорода (-O-) или азота (-NR'-), где R' представляет собой атом водорода, линейную или разветвленную C₁-C₄ алкильную группу или C₃-C₆ циклоалкильную группу;

или его фармацевтически приемлемая соль.

2. Соединение формулы (I) по п. 1, где R означает водород или метил; R₁ выбран из гидроксильной, метильной или метоксильной; R₂ означает водород или атом фтора; X выбран из метилена, трифторметилена, -O- или -NR', где R' принимает значения, определенные в п. 10.

3. Соединение формулы (I) по п. 1 необязательно в виде его фармацевтически приемлемой соли, выбранное из группы, включающей:

(1) N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-метилпиперазин-1-ил)бензамид;

(2) N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-этилпиперазин-1-ил)бензамид;

(3) N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-изопропилпиперазин-1-ил)бензамид;

(4) N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)бензамид;

(5) 4-(3,4-диметилпиперазин-1-ил)-N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил} бензамид;

(6) N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-пиперидин-1-илбензамид;

(7) 4-(4-фторпиперидин-1-ил)-N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил} бензамид;

(8) N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-морфолин-4-илбензамид;

(9) 4-(4-трет-бутилпиперазин-1-ил)-N-{5-[(2R)-2-метокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил} бензамид;

(10) N-{5-[(2R)-2-гидрокси-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-метилпиперазин-1-ил)бензамид;

(11) N-{5-[(2R)-2-метил-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-метилпиперазин-1-ил)бензамид;

(12) N-{5-[(2R)-2-метил-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-этилпиперазин-1-ил)бензамид;

(13) N-{5-[(2R)-2-метил-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-изопропилпиперазин-1-ил)бензамид;

(14) N-{5-[(2R)-2-метил-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-(4-циклопропилпиперазин-1-ил)бензамид;

(15) 4-(3,4-диметилпиперазин-1-ил)-N-{5-[(2R)-2-фенилпропаноил]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}бензамид;

(16) N-{5-[(2R)-2-фенилпропаноил]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-пиперидин-1-илбензамид;

(17) 4-(4-фторпиперидин-1-ил)-N-{5-[(2R)-2-метил-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}бензамид;

(18) N-{5-[(2R)-2-метил-2-фенилэтанойл]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}-4-морфолин-4-илбензамид;

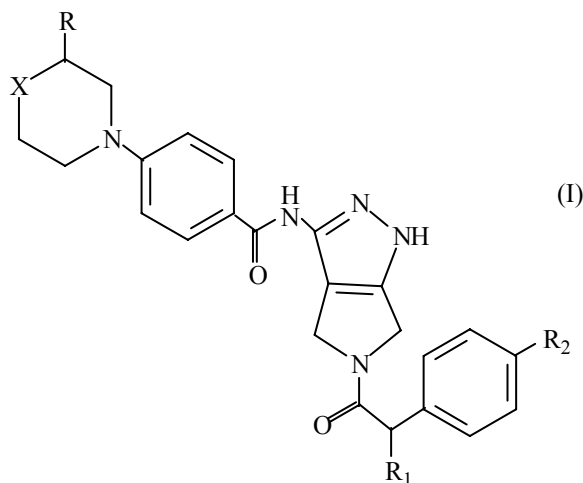
(19) 4-(4-трет-бутилпиперазин-1-ил)-N-{5-[(2R)-2-фенилпропаноил]-1,4,5,6-тетрагидропирроло[3.4-с]пиразол-3-ил}бензамид.

4. Фармацевтическая композиция для лечения клеточных пролиферативных нарушений, вызванных и/или связанных с измененной активностью протеинкиназы, содержащая терапевтически эффективное количество соединения формулы (I) или его фармацевтически приемлемой соли, определенных в п. 1, и по меньшей мере один фармацевтически приемлемый наполнитель, носитель и/или разбавитель.

5. Фармацевтическая композиция по п. 4, содержащая дополнительно один или несколько химиотерапевтических агентов.

6. Набор, содержащий соединение формулы (I) или его фармацевтически приемлемую соль, определенные в п. 1, или их фармацевтические композиции, определенные в п. 4, и один или несколько химиотерапевтических агентов в качестве комбинированного препарата для одновременного, раздельного или последовательного применения в противораковой терапии.

7. Способ лечения клеточных пролиферативных нарушений, вызванных и/или связанных с измененной активностью протеинкиназы, включающий введение млекопитающему, нуждающемуся в этом, эффективного количества соединения формулы (I)



в которой

R представляет собой водород или метил;

R₁ представляет собой гидроксильную или линейную или разветвленную C₁-C₃ алкильную или алкоксильную группу;

R₂ представляет собой водород или атом галогена;

X представляет собой двухвалентную группу, выбранную из метилена (-CH₂-) или фторметилена (-CHF-), или X означает гетероатом или гетероатомную группу, выбранную из кислорода (-O-) или азота (-NR'), где R' представляет собой атом водорода, линейную или разветвленную C₁-C₄ алкильную группу или C₃-C₆ циклоалкильную группу;

или его фармацевтически приемлемой соли.

8. Способ по п. 7 лечения клеточных пролиферативных нарушений, вызванных и/или связанных с измененной активностью Авроракиназа.

9. Способ по п. 8, где Авроракиназа представляет собой Аврору-2.

10. Способ по п. 7, где клеточные пролиферативные нарушения выбраны из группы, включающей рак, болезнь Альцгеймера, вирусные инфекции, аутоиммунные заболевания и нейродегенеративные расстройства.

11. Способ по п. 10, где рак выбран из группы, включающей карциному, плоскоклеточную карциному, гемопозитические опухоли миелоидного или лимфоидного происхождения, опухоли мезенхимного происхождения, опухоли центральной и периферической нервной системы, меланому, семиному, тератокарциному, остеосаркому, пигментозную ксеродерму, кератоксантому, фолликулярный рак щитовидной железы и саркому Капоши.

12. Способ по п. 7, где клеточное пролиферативное нарушение выбрано из группы, включающей доброкачественную гиперплазию простаты, се-

мейный аденоматозный полипоз, нейрофиброматоз, псориаз, пролиферацию клеток гладких мышц сосудов, связанную с атеросклерозом, фиброз легких, артрит, гломерулонефрит и послеоперационный стеноз и рестеноз.

13. Способ по п. 7, дополнительно включающий воздействие на млекопитающего, нуждающегося в этом, лучевой терапии или химиотерапевтической схемы в комбинации по меньшей мере с одним цитостатическим или цитотоксическим агентом.

14. Способ по п. 7, где млекопитающее, нуждающееся в нем, представляет собой человека.

15. Способ ингибирования активности Аврора-2-киназы, включающий контактирование указанной киназы с эффективным количеством соединения, представленного в п. 1.

(11) IAP 03635

(13) C

(51) 8 C 07 D 417/00, C 07 D 403/00, C 07 D 209/00, C 07 D 405/00, C 07 D 401/00, C 07 D 409/00, C 07 D 413/00, A 61 K 31/00

(21) IAP 2004 0061

(22) 18.07.2002

(31)(32)(33) 60/307,674, 25.07.2001; 60/338,061, 07.12.2001, US

(71)(73) БЁРИНГЕР ИНГЕЛЬХАЙМ (Канада) Лтд., СА

(72) БОЛЬЕ, Пьер, Луи; ФАЗАЛЬ, Гульрез; ГУЛЕ, Сильвия; КУКОЛЬ, Жорж; ПУАРЬЕ, Мартин; ТСАНТРИЗОС, Йула, С.; ЖОЛИКЁР, Эрик; ЖИЙЯР, Джеймс; ПУПАР, Марк-Андре; РАНКУР, Жан, СА

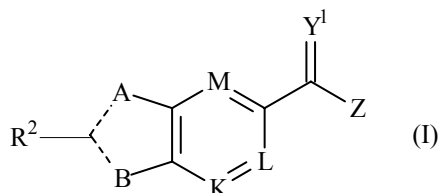
(85) 25.02.2004

(86) PCT/CA 02/01128, 18.07.2002

(87) WO 03/010141, 06.02.2003

(54) Вирусли полимеразнинг ингибиторлари
Ингибиторы вирусной полимеразы

(57) Диастереомер ёки таутомери:



бунда:

A O, S, NR¹ ёки CR¹ дан иборат, бунда R¹ H, (C₁₋₆)алкилдан ташкил топган гурухдан танланади,

- ёки оддий, ёки иккиланган боғланишни билдиради;

R² куйидагилардан танланади: галоген, R²¹, OR²¹, SR²¹, COOR²¹, SO₂N(R²²)₂, N(R²²)₂, CON(R²²)₂, NR²²C(O)R²² ёки NR²²C(O)NR²², бунда R²¹ ва ҳар

бир R²² мустақил равишда H, (C₁₋₆)алкил, галогеналкил, (C₂₋₆)алкенил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₂₋₆)алкинил, (C₅₋₇)циклоалкенил, 6- ёки 10-азоли арил ёки Нетдан иборат, бунда ушбу R²¹ ва R²² радикал R²⁰ билан алмашилиши шарт эмас;

ёки иккала R²² ковалент равишда бунда 5-, 6- ёки 7-азоли тўйинган гетероциклни ҳосил қилиш билан бирга ўз-ўзлари билан, ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланганлар;

B NR³ ёки CR³ дан иборат, шу шарт биланки, A ёки Внинг бири ёки CR¹, ёки CR³ ни билдиради, бунда R³ (C₃₋₇)циклоалкил ва (C₅₋₇)циклоалкенилдан танланади,

K CR⁴ дан иборат, бунда R⁴ Ндан иборат,

L CR⁵ ни ифодалайди, бунда R⁵ R⁴ нинг юқорида аниқлангандей кўрсаткичларига эга;

M N ёки CR⁷ ни ифодалайди, бунда R⁷ R⁴ нинг юқорида аниқлангандей кўрсаткичларига эга;

Y¹ O ёки S ни ифодалайди;

Z N(R^{6a})R⁶ ни ифодалайди, бунда R^{6a} N ни ифодалайди ва

R⁶ (C₃₋₆)циклоалкил, (C₂₋₆)алкенил, 6- членный арил, Нет, (C₁₋₆)алкил-арил, (C₁₋₆)алкил-Нет дан иборат, бунда барча кўрсатилган циклоалкил, алкенил, арил, Нет, алкил-арил, ёки алкил-Нет R⁶⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

бунда R⁶⁰ куйидагини билдиради:

- куйидагиларни ўз ичига олган гурухдан танланган 1-4 ўринбосарлар:

а) (C₁₋₆) алкил, таркибида 1 ёки 2 та гетероатом бўлиши шарт бўлмаган C₃₋₇спироциклоалкил, (C₂₋₆)алкенил, барча кўрсатилган ўринбосарлар R¹⁵⁰ билан алмашилиши шарт эмас;

в) OR¹⁰⁴, бунда R¹⁰⁴ H ёки (C₁₋₆)алкилни ифодалайди, ушбу алкил R¹⁵⁰ билан алмашилиши шарт эмас;

д) NR¹¹¹R¹¹², бунда R¹¹ H ёки (C₁₋₆)алкилни ифодалайди, ва R¹¹² (C₁₋₆)алкил ёки арилни ифодалайди, ушбу алкил ва арил R¹⁵⁰ билан алмашилиши шарт эмас;

и) COR¹²⁷, бунда R¹²⁷ (C₁₋₆)алкилни ифодалайди;

к) COOR¹²⁸, бунда R¹²⁸ N ни ифодалайди;

л) CONR¹²⁹R¹³⁰, бунда R¹²⁹ ва R¹³⁰ мустақил равишда H, (C₁₋₆)алкил, арил ёки Нетни ифодалайди, ушбу алкил, арил ва Нет, R¹⁵⁰ билан алмашилиши шарт;

м) арил ёки Нет, барчаси R¹⁵⁰ билан алмашилиши шарт эмас,

бунда R¹⁵⁰ куйидагини билдиради:

- куйидагиларни ўз ичига олган гурухдан танланган 1-3 ўринбосарлар:

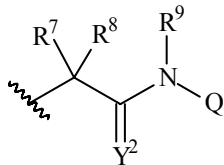
а) (C₁₋₆)алкил ки (C₂₋₆)алкенил, барчаси R¹⁶⁰ билан алмашилиши шарт эмас;

д) NR¹¹¹R¹¹², бунда R¹¹¹ N ни ифодалайди ва R¹¹² N ни ифодалайди;

к) COOR¹²⁸, бунда R¹²⁸ N ни ифодалайди; ва

л) $\text{CONR}^{129}\text{R}^{130}$, бунда R^{129} ва R^{130} мустақил равишда Нни ифодалайди, бунда R^{160} қуйидагиларни ўз ичига олган гуруҳдан танланган 1 ёки 2 ўринбосарларни ифодалайди:

COOR^{161} ёки $\text{CON}(\text{R}^{162})_2$, бунда R^{161} ва ҳар бир R^{162} мустақил равишда Нни ифодалайди, ёки $\text{Z N}(\text{R}^{6a})\text{R}^6$ дан иборат, бунда R^{6a} юқорида белгилангандек ва R^6 билдиради:



бунда R^7 ва R^8 ҳар бири мустақил равишда Н ёки (C_{1-6}) алкилдан иборат, бунда ушбу алкил R^{70} радикали билан алмашилиши шарт эмас; бунда R^{70} билдиради

д) $\text{NR}^{111}\text{R}^{112}$, бунда R^{111} Нни ифодалайди ёки (C_{1-6}) алкил ва R^{112} Н ёки (C_{1-6}) алкилни ифодалайди, ёки

R^7 ва R^8 иккинчи (C_{3-7}) циклоалкил ёки таркибида О, N ва Sдан танланган гетероатом бўлган 4-, 5-ёки 6-аззоли гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда бир бирлари билан боғланганлар;

Y^2 О ёки S дан иборат;

R^9 Н дан иборат ёки

R^9 5- ёки 6-аззоли гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ёки R^7 , ёки R^8 билан боғланганлар; Q 6- ёки 10-аззоли арил, Het ёки (C_{1-6}) алкиларилдан иборат, уларнинг ҳар бири R^{100} радикали билан алмашилиши шарт эмас,

бунда R^{100} билдиради

- галоген ёки цианодан танланган битта ўринбосар; ёки

- қуйидагиларни ўз ичига олган гуруҳдан танланган 1-4 ўринбосарлар:

а) (C_{1-6}) алкил, C_{3-7} циклоалкил, (C_{2-6}) алкенил ёки (C_{2-8}) алкинил, ушбу барча ўринбосарлар R^{150} билан алмашилиши шарт эмас;

в) OR^{104} , бунда R^{104} Нни ифодалайди;

г) $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{108})_2$, бунда ҳар бир R^{108} мустақил равишда Нни ифодалайди;

д) $\text{NR}^{111}\text{R}^{112}$, бунда R^{111} Н ёки (C_{1-6}) алкилни ифодалайди ва R^{112} (C_{1-6}) алкилни ифодалайди;

е) $\text{NR}^{116}\text{COR}^{117}$, бунда ҳар бир R^{116} ва R^{117} Н ёки (C_{1-6}) алкилни билдиради,

з) $\text{NR}^{121}\text{COCOR}^{122}$, бунда R^{121} Нни ифодалайди ва R^{122} OR^{123} ёки $\text{N}(\text{R}^{124})_2$ ни ифодалайди бунда R^{123} ва ҳар бир R^{124} мустақил равишда Н ёки (C_{1-6}) алкилни ифодалайди ёки R^{124} ОН ни ифодалайди;

к) COOR^{128} , бунда R^{128} Нни ифодалайди;

л) $\text{CONR}^{129}\text{R}^{130}$, бунда R^{129} ва R^{130} мустақил равишда Н ни ифодалайдилар;

м) Het R^{150} билан алмашилиши шарт эмас, бунда R^{150} қуйидагини ифодалайди:

- цианодан танланган 1 зринбосар ёки

- қуйидагиларни ўз ичига олган гуруҳдан танланган 1-3 ўринбосарлар:

д) $\text{NR}^{111}\text{R}^{112}$, бунда R^{111} Нни ифодалайди ва R^{112} Нни ифодалайди;

и) COOR^{127} , бунда R^{127} (C_{1-6}) алкилни ифодалайди;

к) тетразол ёки COOR^{128} , бунда R^{128} Нни ифодалайди,

л) $\text{COOR}^{129}\text{R}^{130}$, бунда R^{129} ва R^{130} мустақил равишда Нни ифодалайди,

ёки унинг тузлари, ёки ҳосилалари;

бунда Het О, N ва S дан танланган 1-4 гетероатомни ўз ичига олган 5- ёки 6-аззоли гетероцикл ёки О, N ва Sдан танланган 1-5 гетероатомларни ўз ичига олган -9 ёки 10-аззоли гетеробициклини ифодалайди, ҳар бир R^{20} эса, қуйидагича аниқланади:

- қуйидагилардан танланган 1-4 ўринбосарлар: галоген, OPO_3H , NO_2 , циано, азидо, $\text{C}(\text{=NH})\text{NH}_2$, $\text{C}(\text{=NH})\text{NH}(\text{C}_{1-6})$ алкил ёки $\text{C}(\text{=NH})\text{NHCO}(\text{C}_{1-6})$ алкилдан; ёки

- қуйидагилардан танланган 1-4 ўринбосарлар:

а) (C_{1-6}) алкил ёки галогеналкила (C_{3-7}) циклоалкил, 1 ёки 2 гетероатомни ўз ичига олиши шарт бўлмаган C_{3-7} спироциклоалкил, (C_{2-6}) алкенил, (C_{2-8}) алкинил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, уларнинг ҳар бири R^{150} радикали билан алмашилиши шарт эмас;

б) OR^{104} , бунда R^{104} Н, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, или (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил ёки (C_{1-6}) алкил)Hetдан иборат, бунда ушбу алкил, циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил ёки (C_{1-6}) алкил)Het R^{150} радикали билан алмашилиши шарт эмас;

в) OCOR^{105} , бунда R^{105} (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, Het, (C_{1-6}) алкиларил или (C_{1-6}) алкил)Hetдан иборат, бунда ушбу алкил, циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил или (C_{1-6}) алкил)Het R^{150} радикали билан алмашилиши шарт эмас;

г) SR^{108} , $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{108})_2$ ёки $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{108})\text{C}(\text{O})\text{R}^{108}$, бунда ҳар бир R^{108} мустақил равишда Н, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил или (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил ёки (C_{1-6}) алкил)Het дан иборат, ёки иккала R^{108} ковалент равишда бир-бирлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланганлар, бунда ушбу алкил, циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил ёки (C_{1-6}) алкил)Het ёки гетероцикл R^{150} радикали билан алмашилиши шарт эмас;

д) $\text{NR}^{111}\text{R}^{112}$, бунда R^{111} Н, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил ёки (C_{1-6}) алкил)Hetдан ибо-

рат, ва R^{112} H, CN, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил, (C_{1-6}) алкил)Het, COOR¹¹⁵ ёки SO₂R¹¹⁵ дан иборат, уларда R¹¹⁵ (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Hetдан иборат, ёки иккала R¹¹¹ ва R¹¹² 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда бир-бирлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланганлар, бунда ушбу алкил, циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{6}) алкил)-Het ёки гетероцикл R¹⁵⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

е) NR¹¹⁶COR¹¹⁷, бунда ҳар бир R¹¹⁶ ва R¹¹⁷ H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Hetдан иборат, бунда ушбу (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het R¹⁵⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

ж) NR¹¹⁸CONR¹¹⁹R¹²⁰, бунда ҳар бир R¹¹⁸, R¹¹⁹ ва R¹²⁰ H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Hetдан иборат, ёки R¹¹⁸ 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда R¹¹⁹ радикали ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланганлар; ёки R¹¹⁹ ва R¹²⁰ 5-, 6- ёки 7- аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланганлар; ушбу алкил, циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)-Het ёки гетероцикл R¹⁵⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

з) NR¹²¹COCOR¹²², бунда ҳар бир R¹²¹ ва R¹²² H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, 6- ёки 10-аъзоли арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Hetдан иборат, бунда ушбу алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het R¹⁵⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

ёки R¹²² OR¹²³ ёки N(R¹²⁴)₂ дан иборат, бунда R¹²³ ва ҳар бир R¹²⁴ мустақил равишда H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het дан иборат, ёки R¹²⁴ OH ёки O (C_{1-6}) алкил)дан иборат ёки иккала R¹²⁴ бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан боғланганлар, бунда ушбу алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het ва гетероцикл R¹⁵⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

и) COR¹²⁷, бунда R¹²⁷ H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het дан иборат,

бунда ушбу алкил, циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het R¹⁵⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

к) COOR¹²⁸, бунда R¹²⁸ H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Hetдан иборат, бунда ушбу (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ва (C_{1-6}) алкил)Het R¹⁵⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

л) CONR¹²⁹R¹³⁰, бунда R¹²⁹ ва R¹³⁰ мустақил равишда H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Hetдан иборат, ёки иккала R¹²⁹ ва R¹³⁰ бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланганлар, бунда ушбу алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил, (C_{1-6}) алкил)Het ва гетероцикл R¹⁵⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

м) арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het, бунда уларнинг ҳар бири R¹⁵⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас, бунда R¹⁵⁰ қуйидагича аниқланади:

- қуйидагилардан танланган 1-3 ўринбосарлар: галоген, OPO₃H, NO₂, циано, азидо, C(=NH)NH₂, C(=NH)NH (C_{1-6}) алкил ёки

C(=NH)NHCO (C_{1-6}) алкил; ёки

- қуйидагилардан танланган 1-3 ўринбосарлар:

а) (C_{1-6}) алкил ёки галогеналкил, (C_{3-7}) циклоалкил, 1 ёки 2 гетероатомни ўз ичига олиши шарт бўлмаган C_{3-7} спироциклоалкил, (C_{2-6}) алкенил, (C_{2-8}) алкинил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, уларнинг ҳар бири R¹⁶⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

б) OR¹⁰⁴, бунда R¹⁰⁴ H, (C_{1-6}) алкил), (C_{3-7}) циклоалкил, ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Hetдан иборат, бунда ушбу алкил, циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het R¹⁶⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

в) OCOR¹⁰⁵, бунда R¹⁰⁵ (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Hetдан иборат, бунда ушбу алкил, циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het R¹⁶⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

г) SR¹⁰⁸, SO₂N(R¹⁰⁸)₂ ёки SO₂N(R¹⁰⁸)C(O)R¹⁰⁸, бунда ҳар бир R¹⁰⁸ мустақил равишда H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил или (C_{1-6}) алкил)Hetдан иборат, ёки иккала R¹⁰⁸ бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланганлар, бунда

ушбу алкил, циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)-арил ёки (C₁₋₆алкил)Нет ёки гетероцикл R¹⁶⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

д) NR¹¹¹R¹¹², бунда R¹¹¹ H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил ёки (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил ёки (C₁₋₆алкил)Нетдан иборат, ва R¹¹² H, CN, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил ёки (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил, (C₁₋₆алкил)Нет, COOR¹¹⁵ ёки SO₂R¹¹⁵ дан иборат, бунда R¹¹⁵ (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, ёки (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил ёки (C₁₋₆алкил)Нетдан иборат, ёки иккала R¹¹¹ ва R¹¹² бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланганлар, бунда ушбу алкил, циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Нет, или гетероцикл R¹⁶⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

е) NR¹¹⁶COR¹¹⁷, бунда ҳар бир R¹¹⁶ ва R¹¹⁷ H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил ёки (C₁₋₆алкил)Нетдан иборат, бунда ушбу (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил ёки (C₁₋₆алкил)Нет R¹⁶⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

ж) NR¹¹⁸COR¹¹⁹R¹²⁰, бунда ҳар бир R¹¹⁸, R¹¹⁹ ва R¹²⁰ H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил ёки (C₁₋₆алкил)Нетдан иборат ёки R¹¹⁸ бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда R¹¹⁹ радикали ва ўзлари қўшилган азот атомига қўшилганлар, ёки R¹¹⁹ ва R¹²⁰ бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланганлар, бунда ушбу алкил, циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил ёки (C₁₋₆алкил)Нет ёки гетероцикл R¹⁶⁰ радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

з) NR¹²¹COCOR¹²², бунда ҳар бир R¹²¹ ва R¹²² H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, 6- ёки 10-аъзоли арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил ёки (C₁₋₆алкил)Нетдан иборат, бунда ушбу алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил ёки (C₁₋₆алкил)Нет R¹⁶⁰ билан алмашилишлари шарт эмас, ёки R¹²² OR¹²³ ёки N(R¹²⁴)₂ дан иборат, бунда R¹²³ ва ҳар бир R¹²⁴ мустақил равишда H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил ёки (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил ёки (C₁₋₆алкил)Нетдан иборат, ёки R¹²⁴ OH ёки O(C₁₋₆алкил)дан иборат ёки иккала R¹²⁴ бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-

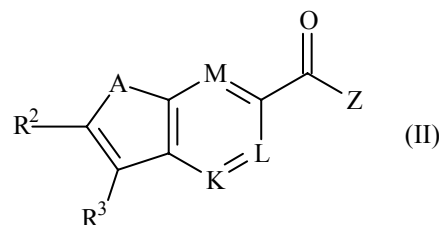
ўзлари билан билан боғланганлар, бунда ушбу алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Нет ёки гетероцикл R¹⁶⁰ радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

и) COR¹²⁷, бунда R¹²⁷ H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил ёки (C₁₋₆алкил)Нет дан иборат, бунда ушбу алкил, циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Нет R¹⁶⁰ радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

к) тетразол, COOR¹²⁸, бунда R¹²⁸ H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, ёки (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил ёки (C₁₋₆алкил)Нет дан иборат, бунда ушбу (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, ёки (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил ва (C₁₋₆алкил)Нет R¹⁶⁰ радикали билан алмашилишлари шарт эмас; ва

л) CONR¹²⁹R¹³⁰, бунда R¹²⁹ ва R¹³⁰ мустақил равишда H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил ёки (C₁₋₆алкил)Нетдан иборат, ёки иккала R¹²⁹ ва R¹³⁰ бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан боғланганлар, бунда ушбу алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Нет, (C₁₋₆алкил)арил, (C₁₋₆алкил)Нет и гетероцикл R¹⁶⁰ радикали билан алмашилишлари шарт эмас; ва бунда R¹⁶⁰ 1 ёки 2 ўринбосар сифатида аниқланади, уларни қуйидаги ўринбосарлардан танланади: тетразол, галоген, CN, C₁₋₆алкил, галогеналкил, COOR¹⁶¹, SO₃H, SR¹⁶¹, SO₂R¹⁶¹, OR¹⁶¹, N(R¹⁶²)₂, SO₂N(R¹⁶²)₂, NR¹⁶²COR¹⁶² ёки CON(R¹⁶²)₂, бунда R¹⁶¹ ва ҳар бир R¹⁶² мустақил равишда H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил ёки (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкилдан иборат; ёки иккала R¹⁶² бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан билан боғланганлар, ёки унинг тузи.

2.1-банд бўйича (II) формулани бирикма:

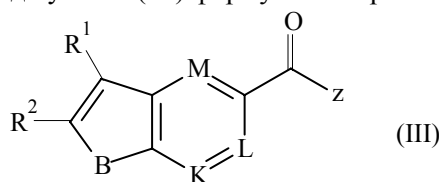


бунда A O, S ёки NR¹ ни билдиради, ва R¹, R², R³, K, L, M ва Z 1-бандда аниқлангандекдирлар.

3. 2-банд бўйича бирикмада A NR¹ ни ифодалайди.

4. 3-банд бўйича бирикмада M, K ва L CNни ифодалайди.

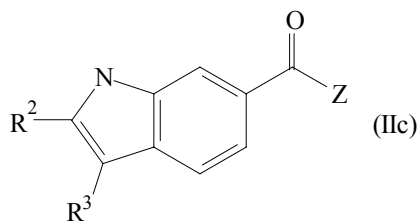
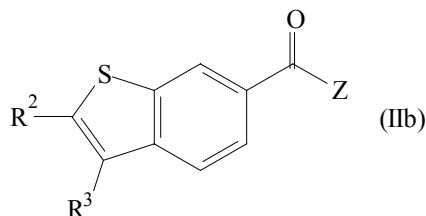
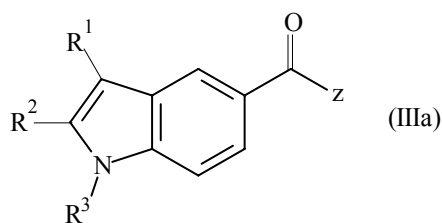
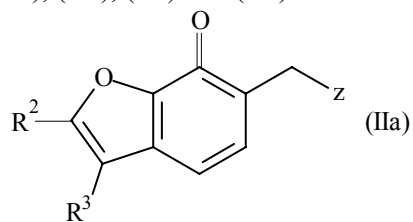
5. 1-банд бўйича (III) формулани бирикма:



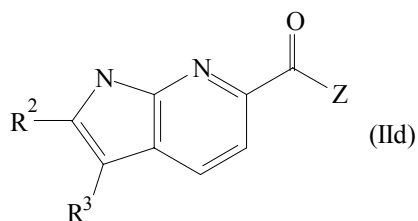
бунда B NR³ ни ифодалайди, ва R¹, R², R³, K, L, M ва Z 1-бандда аниқлангандекдирлар.

6. 5-банд бўйича бирикмада M, K ва L CH ни иблдирлади.

7. 1-банд бўйича қуйидаги формулани бирикма: (IIa), (IIb), (IIc) ёки (IId)



ёки



бунда R¹, R², R³ ва Z 1-бандда аниқланган декдирлар.

8. 1-банд бўйича бирикмада R¹ H, CH₃, изопропил ёки изобутилни ифодалайди.

9. 8-банд бўйича бирикмада R¹ H, CH₃ ни ифодалайди.

10. 9-банд бўйича бирикмада R¹ CH₃ ни ифодалайди.

11. 1-банд бўйича бирикмада R² CON(R²²)₂ ни ифодалайди, бунда ҳар бир R²² мустақил равишда H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₅₋₇)циклоалкенил, 6 ёки 10-аъзоли арил ёки Het ни ифодалайди, ёки иккала R²² бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланганлар; ёки R² қуйидагидан танланади: H, галоген, (C₁₋₆)алкил, галогеналкил, (C₂₋₆)алкенила, (C₅₋₇)циклоалкенил, 6- ёки 10-аъзоли арил ёки Het; бунда ҳар бир ушбу алкил, галогеналкил, (C₂₋₆)алкенил, (C₅₋₇)циклоалкенил, арил ёки Het R²⁰ радикали билан алмашилишлари шарт эмас, бунда R²⁰ қуйидагича аниқланади:

- қуйидагилардан танланган 1-4 ўринбосарлар: галоген, NO₂, циано, азидо, C(=NH)NH₂, C(=NH)NH(C₁₋₆)алкил ёки C(=NH)NHCO(C₁₋₆)алкил; ёки

- қуйидаги ўринбосарлардан танланган 1-4 ўринбосарлар:

а) (C₁₋₆) алкил ёки галогеналкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₂₋₆)алкенил, (C₂₋₈)алкинил, (C₁₋₆) алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, уларнинг ҳар бири R¹⁵⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас;

б) OR¹⁰⁴, бунда R¹⁰⁴ H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил ёки (C₁₋₆)алкиларилдан иборат, бунда ушбу алкил, циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил ёки (C₁₋₆)алкиларил R¹⁵⁰ радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

в) OCOR¹⁰⁵, бунда R¹⁰⁵ (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, Het, (C₁₋₆)алкиларил или (C₁₋₆)алкиларилдан иборат, бунда ушбу алкил, циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил ёки (C₁₋₆)алкиларил R¹⁵⁰ радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

г) SR¹⁰⁸, SO₂N(R¹⁰⁸)₂ ёки SO₂N(R¹⁰⁸)C(O)R¹⁰⁸, бунда ҳар бир R¹⁰⁸ мустақил равишда H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил или (C₁₋₆)алкиларилдан иборат, ёки иккала R¹⁰⁸ бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланганлар, бунда ушбу алкил, циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил ёки (C₁₋₆)алкиларил, ёки гетероцикл R¹⁵⁰ радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

д) NR¹¹¹R¹¹², бунда R¹¹¹ H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил ёки (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил ёки (C₁₋₆)алкиларилдан иборат.

рат, ва R^{112} H, CN, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил, (C_{1-6}) алкил)Het, COOR¹¹⁵ ёки SO₂R¹¹⁵ дан иборат, бунда R^{115} (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Hetдан иборат, ёки иккала R^{111} ва R^{112} бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланганлар, бунда ушбу алкил, циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het, ёки гетероцикл R^{150} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

е) NR¹¹⁶COR¹¹⁷, бунда ҳар бир R^{116} ва R^{117} H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het дан иборат, бунда ушбу (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het R^{150} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

ж) NR¹¹⁸CONR¹¹⁹R¹²⁰, бунда ҳар бир R^{118} , R^{119} ва R^{120} H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het дан иборат, ёки R^{118} бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда R^{119} радикали билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланган; ёки иккала R^{119} ва R^{120} бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланган; ушбу алкил, циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het, ёки гетероцикл R^{150} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

з) NR¹²¹COCOR¹²², бунда ҳар бир R^{121} ва R^{122} H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, 6- ёки 10-аъзоли арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het дан иборат, бунда ушбу алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het R^{150} радикали билан алмашилишлари шарт эмас; ёки R^{122} OR¹²³ ёки N(R¹²⁴)₂ дан иборат, бунда R^{123} ва ҳар бир R^{124} мустақил равишда H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het дан иборат, ёки R^{124} OH ёки O (C_{1-6}) алкил)дан иборат, ёки иккала R^{124} бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан боғланган; бунда ушбу алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het ва гетероцикл R^{150} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

и) COR¹²⁷, бунда R^{127} H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Hetдан иборат,

бунда ушбу алкил, циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил или (C_{1-6}) алкил)Het R^{150} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

к) COOR¹²⁸, бунда R^{128} H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het дан иборат, бунда ушбу (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ва (C_{1-6}) алкил)Het R^{150} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

л) CONR¹²⁹R¹³⁰, бунда R^{129} ва R^{130} мустақил равишда H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het дан иборат, ёки иккала R^{129} ва R^{130} бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланган, бунда ушбу алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил, (C_{1-6}) алкил)Het ва гетероцикл R^{150} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

м) арил, Het, (C_{1-6}) алкил)арил ёки (C_{1-6}) алкил)Het, уларнинг ҳар бири R^{150} радикали билан алмашилишлари шарт эмас; бунда R^{150} қуйидагидан иборат:

- галоген, NO₂, циано ёки азидодан танланган 1-3 ўринбосарлар; ёки

- қуйидаги ўринбосарлардан танланган 1-3 ўринбосарлар:

а) (C_{1-6}) алкил ёки галогеналкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{2-6}) алкенил, (C_{2-8}) алкинил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, уларнинг ҳар бири R^{160} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

б) OR¹⁰⁴, бунда R^{104} H, (C_{1-6}) алкил) ёки (C_{3-7}) циклоалкилдан иборат, бунда ушбу алкил ёки циклоалкил R^{160} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

г) SR¹⁰⁸, SO₃H, SO₂N(R¹⁰⁸)₂ ёки SO₂N(R¹⁰⁸)C(O)R¹⁰⁸, бунда ҳар бир R^{108} мустақил равишда H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het дан иборат, ёки иккала R^{108} бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланган, бунда ушбу алкил, циклоалкил, арил, Het ва гетероцикл R^{160} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

д) NR¹¹¹R¹¹², бунда R^{111} H, (C_{1-6}) алкил ёки (C_{3-7}) циклоалкилдан иборат, R^{112} эса, H, (C_{1-6}) алкил ёки (C_{3-7}) циклоалкил, COOR¹¹⁵ ёки SO₂R¹¹⁵ дан иборат, бунда R^{115} (C_{1-6}) алкил ёки (C_{3-7}) циклоалкилдан иборат, ёки иккала R^{111} ва R^{112} бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланган, бун-

да ушбу алкил, циклоалкил ва гетероцикл R^{160} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

е) $NR^{116}COR^{117}$, бунда ҳар бир R^{116} ва R^{117} H, (C_{1-6}) алкил ёки (C_{3-7}) циклоалкилдан иборат, бунда ушбу (C_{1-6}) алкил ва (C_{3-7}) циклоалкил R^{160} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

ж) $NR^{118}CONR^{119}R^{120}$, бунда ҳар бир R^{118} , R^{119} ва R^{120} H, (C_{1-6}) алкил ёки (C_{3-7}) циклоалкилдан иборат, ёки R^{118} бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда R^{119} радикали билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланган, ёки R^{119} ва R^{120} бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланган, бунда ушбу алкил, циклоалкил ва гетероцикл R^{160} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

з) $NR^{121}COCOR^{122}$, бунда R^{121} H, (C_{1-6}) алкил ёки (C_{3-7}) циклоалкилдан иборат, бунда ушбу алкил ва циклоалкил R^{160} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

ёки R^{122} OR^{123} ёки $N(R^{124})_2$ ни билдиради, бунда R^{123} ва ҳар бир R^{124} мустақил равишда H, (C_{1-6}) алкил) ёки (C_{3-7}) циклоалкилдан иборат, ёки иккала R^{124} бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан боғланган, бунда ушбу алкил, циклоалкил ва гетероцикл R^{160} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

и) COR^{127} , бунда R^{127} H, (C_{1-6}) алкил ёки (C_{3-7}) циклоалкилдан иборат, бунда ушбу алкил ва циклоалкил R^{160} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

к) $COOR^{128}$, бунда R^{128} H, (C_{1-6}) алкил ёки (C_{3-7}) циклоалкилдан иборат, бунда ушбу (C_{1-6}) алкил ва (C_{3-7}) циклоалкил R^{160} радикали билан алмашилишлари шарт эмас; ва

л) $CONR^{129}R^{130}$, бунда R^{129} ва R^{130} мустақил равишда H, (C_{1-6}) алкил ёки (C_{3-7}) циклоалкилдан иборат, ёки иккала R^{129} ва R^{130} бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланган, бунда ушбу алкил, циклоалкил ва гетероцикл R^{160} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

бунда R^{160} галоген, CN, C_{1-6} алкил, галогеналкил, $COOR^{161}$, OR^{161} , $N(R^{162})_2$, $SO_2N(R^{162})_2$, $NR^{162}COR^{162}$ $CON(R^{162})_2$ дан танланган 1 ёки 2 ўринбосарлар сифатида аниқланади, бунда R^{161} ва ҳар бир R^{162} мустақил равишда H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил ёки (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкилдан иборат; ёки иккала R^{162} бунда 5-, 6- ёки 7-аъзоли тўйинган гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланган.

12. 11-банд бўйича бирикмада R^2 ҳар бири ўринбосарлар билан моноалмашилиши ёки диалмашилиши шарт бўлмаган арил ёки Нет дан танланади, бунда ўринбосарлар қуйидагилардан ташкил топган гуруҳдан танланади: галоген, галогеналкил, N_3 ёки

а), OH ёки $O(C_{1-6})$ алкил билан алмашилиши шарт бўлмаган (C_{1-6}) алкил;

б) (C_{1-6}) алкокси;

д) $NR^{111}R^{112}$, бунда иккала R^{111} ва R^{112} мустақил равишда H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкилдан иборат, ёки R^{112} 6- ёки 10-аъзоли арил, Нет, (C_{1-6}) алкил-арил ёки (C_{1-6}) алкил-Нет дан иборат; ёки иккала R^{111} ва R^{112} бунда азот таркибли гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланган, ҳар бир кўрсатилган алкил, циклоалкил, арил, Нет, алкил-арил ёки алкил-Нет галоген радикали билан алмашилишлари шарт эмас ёки:

- OR^{2h} ёки $N(R^{2h})_2$, бунда ҳар бир R^{2h} мустақил равишда H, (C_{1-6}) алкилдан иборат, ёки иккала R^{2h} азот таркибли гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланган;

е) $NHCOR^{117}$, бунда R^{117} (C_{1-6}) алкилдан иборат;

и) CO-арил; ва

л) $CONH_2$, $CONH(C_{1-6})$ алкил), $CON(C_{1-6})$ алкил), $CONH$ -арил, ёки $CONHC_{1-6}$ алкил арил.

13. 12-банд бўйича бирикмада R^2 ҳар бири ўринбосарлар билан моноалмашилиши ёки диалмашилиши шарт бўлмаган арил ёки Нет дан танланади, бунда ўринбосарлар қуйидаги ўринбосарлардан ташкил бўлган гуруҳдан танланган: галоген, галогеналкил, ёки

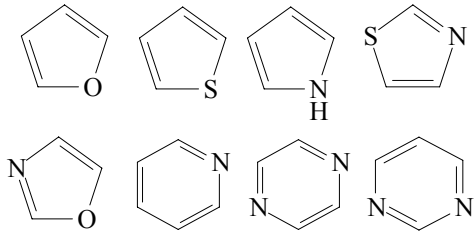
а) OH гуруҳи ёки $O(C_{1-6})$ алкил билан алмашилиши шарт бўлмаган (C_{1-6}) алкил;

б) (C_{1-6}) алкокси; ва

д) $NR^{111}R^{112}$, бунда иккала R^{111} ва R^{112} мустақил равишда H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкилдан иборат, ёки R^{112} 6- ёки 10-аъзоли арил, Нет, (C_{1-6}) алкил-арил ёки (C_{1-6}) алкил-Нетдан иборат; ёки иккала R^{111} ва R^{112} азот таркибли гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланган, бунда ҳар бир кўрсатилган алкил, циклоалкил, арил, Нет, алкил-арил ёки алкил-Нет галоген билан алмашилиши шарт эмас ёки :

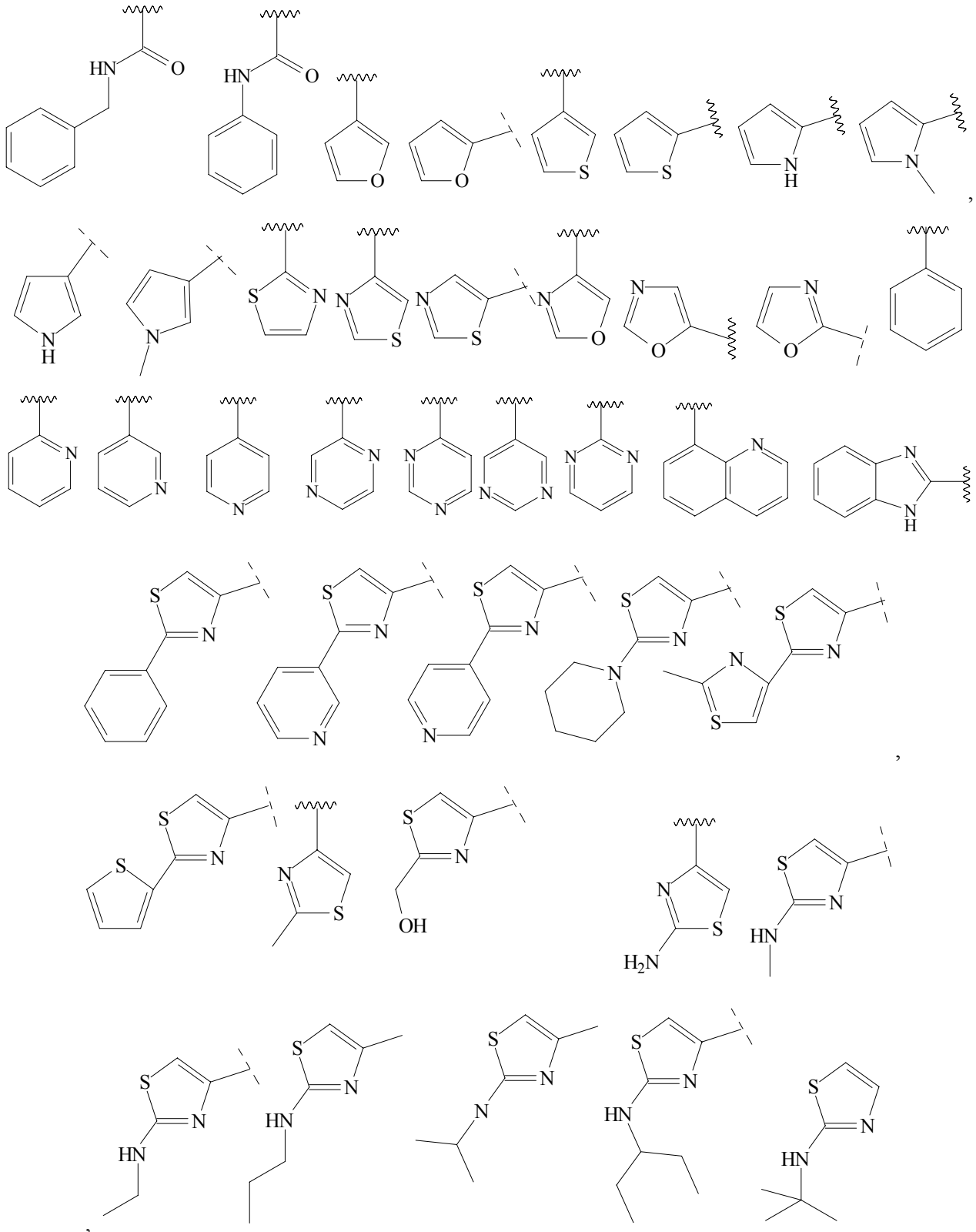
- OR^{2h} ёки $N(R^{2h})_2$, бунда ҳар бир R^{2h} мустақил равишда H, (C_{1-6}) алкилдан иборат, ёки иккала R^{2h} азот таркибли гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда ўз-ўзлари билан ва ўзлари қўшилган азот атоми билан боғланган.

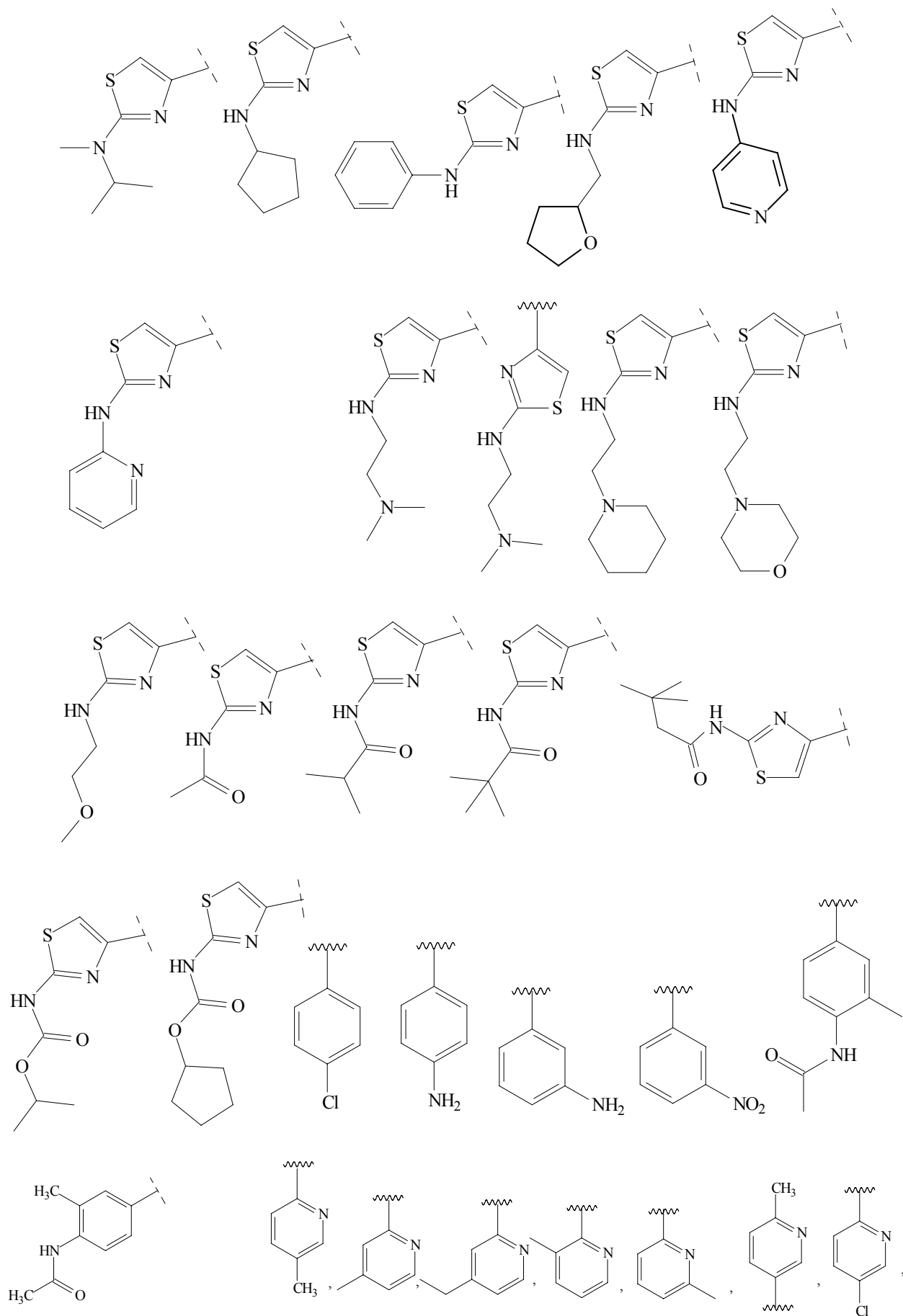
14. 13-банд бўйича бирикмада R^2 қуйидагидан танланган фенил ёки гетероциклни билдиради:

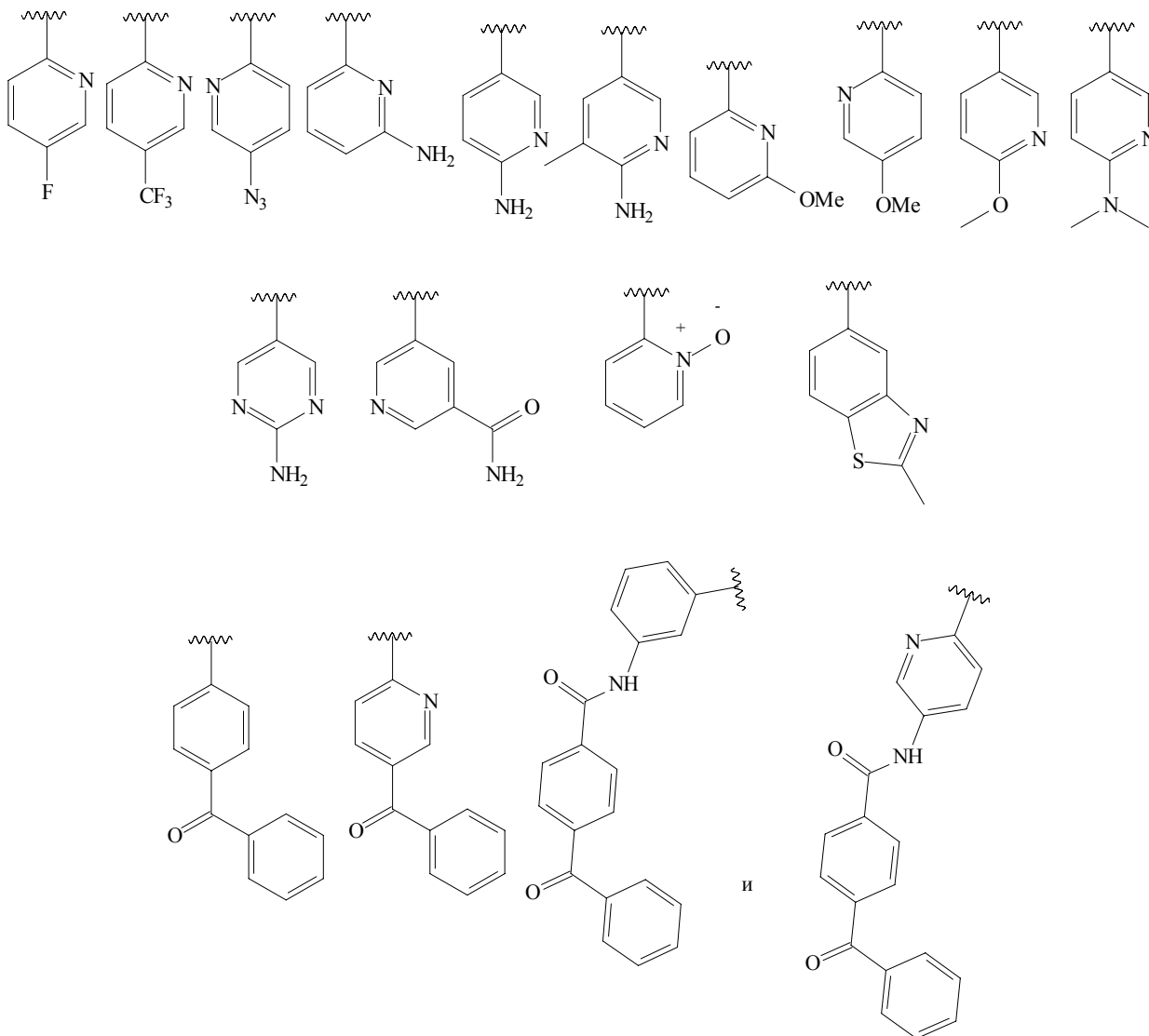


уларнинг ҳар бири 13-бандда кўрсатилганидек алмашилиши шарт эмас.

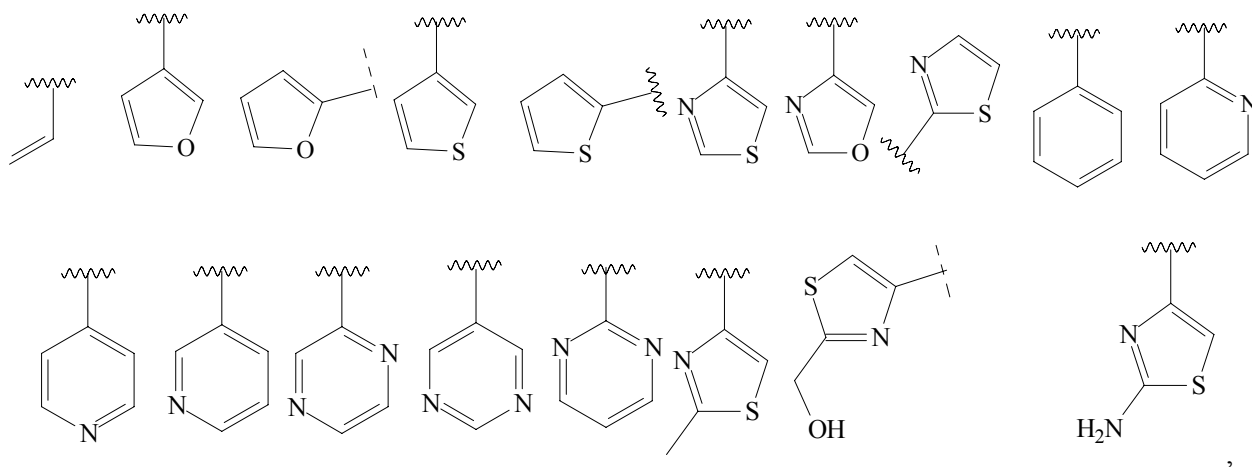
15. 1-банд бўйича бирикмада R^2 куйдагилардан ташкил топган гуруҳдан танланади: H, Br, CONHCH_3 , $\text{CON}(\text{CH}_3)_2$, CONH_2 , $\text{CH}=\text{CH}_2$,

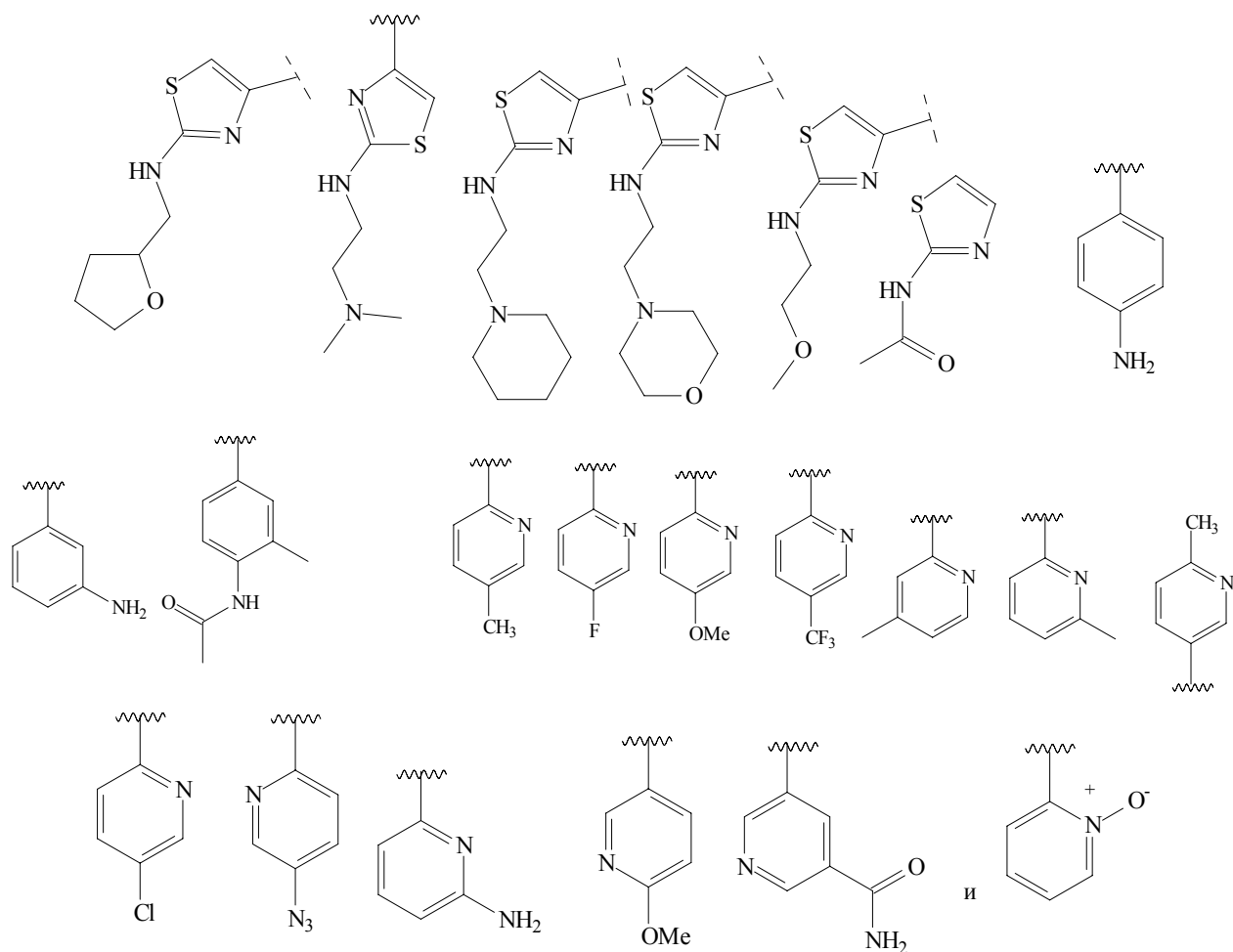




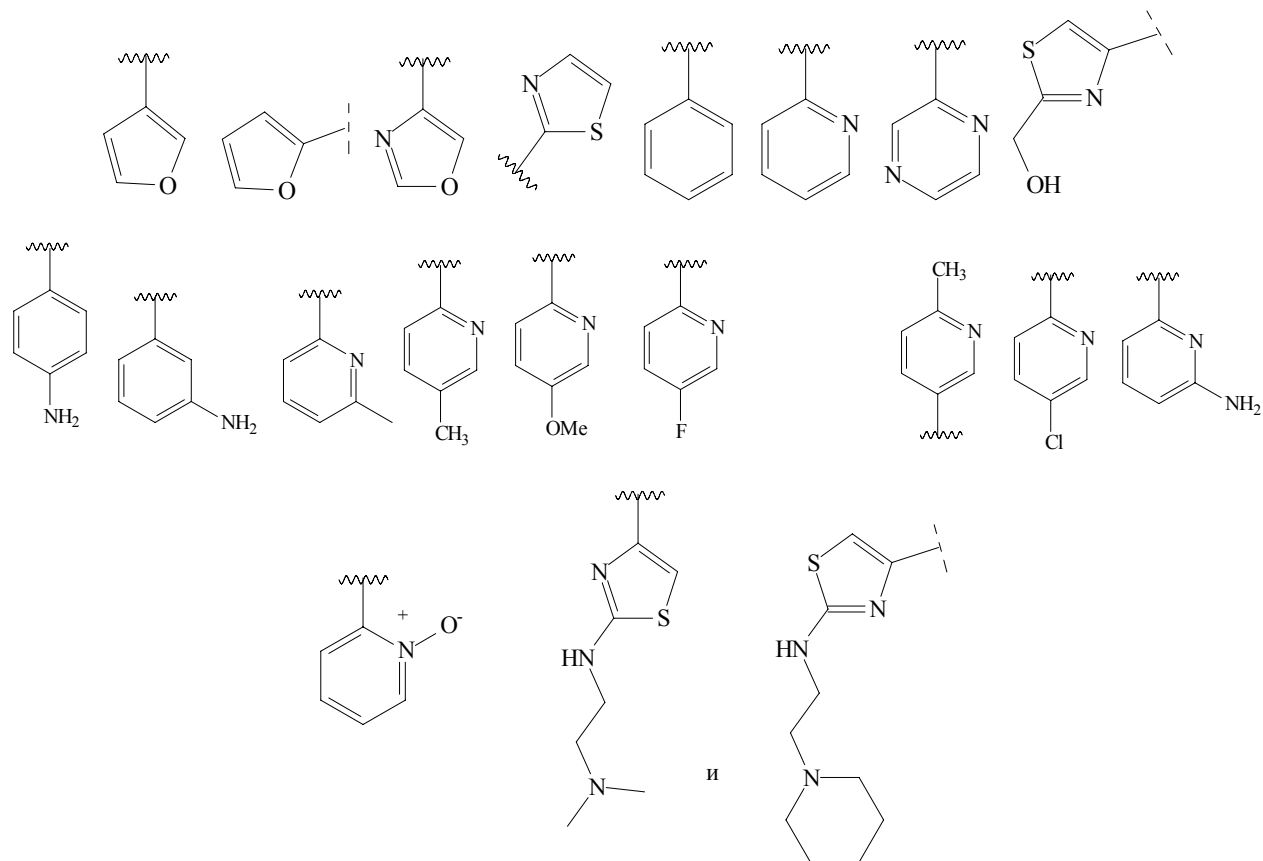


16. 15-банд бўйича бирикмада R² қуйдагилардан танланади:





17. 16-банд бўйича бирикмада R² куйидагилардан танланади:



18. 1-банд бўйича бирикмада R^3 (C_{3-7})циклоалкилни билдиради.

19. 18-банд бўйича бирикмада R^3 циклопентил ёки циклогексилни билдиради.

20.1-банд бўйича ихтиро формуласининг бирикмасида Y^1 O ни билдиради.

21. 1-банд бўйича ихтиро формуласининг бирикмасида Z $N(R^{6a})$ R^6 ни билдиради, бунда R^6 а Н дан иборат, R^6 эса, (C_{2-6})алкенил, арил, Нет, (C_{1-6})-алкил-арил, (C_{1-6})алкил- Нетдан иборат, ва барча кўрсатилган алкенил, арил, Нет, алкил-арил ёки алкил-Нет, куйидаги ўринбосарлардан танланган 1-4 ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас:

а), 1 ёки 2 гетероатомни ўз ичига олишиши шарт бўлмаган (C_{1-6})алкил, C_{3-7} спироциклоалкил ёки ҳар бири R^{150} радикали билан алмашилиши шарт бўлмаган (C_{2-6})алкенил;

б) OR^{104} , бунда R^{104} R^{150} радикали билан алмашилиши шарт бўлмаган Н ёки (C_{1-6} алкил)дан иборат;

д) $NR^{111}R^{112}$, бунда R^{111} Н ёки (C_{1-6})алкилдан иборат ва R^{112} (C_{1-6})алкил ёки арил, Нетдан иборат, бунда ушбу алкил ва арил R^{150} радикали билан алмашилишлари шарт эмас;

и) COR^{127} , бунда R^{127} (C_{1-6})алкилдан иборат,

к) $COOR^{128}$, бунда R^{128} Ндан иборат;

л) $CONR^{129}R^{130}$, бунда R^{129} ва R^{130} мустақил равишда Н, (C_{1-6})алкил, арил и Нетдан иборат, бунда ушбу кўрсатилган алкил, арил ва Нет R^{150} радикали билан алмашилиши шарт эмас;

м) арил ёки Нет, уларнинг ҳар бири R^{150} радикали билан алмашилиши шарт эмас; бунда R^{150} - куйидаги ўринбосарлардан танланган 1-3 ўринбосарларни англатади:

а) (C_{1-6})алкил ёки (C_{2-6})алкенил, уларнинг ҳар бири R^{160} радикали билан алмашилиши шарт эмас;

д) $NR^{111}R^{112}$, бунда R^{111} Ндан иборат, ва R^{112} Н дан иборат,

к) $COOR^{128}$, бунда R^{128} Ндан иборат,

л) $CONR^{129}R^{130}$, бунда R^{129} ва R^{130} мустақил равишда Ндан иборат,

бунда R^{160} $COOR^{161}$ ёки $CON(R^{162})_2$ дан танланган 1 ёки 2 ўринбосар сифатида аниқланади, бунда R^{161} ва ҳар бир R^{162} мустақил равишда Ндан иборат.

22. 21-банд бўйича бирикмада R^6 C_{2-6} алкенил, фенил, (C_{1-6})алкил-арил, (C_{1-6})алкил-Нетдан иборат, бунда ушбу алкенил, фенил ва алкильная часть ушбу алкил-арилнинг алкиль қисми ёки алкил- Нет 1-3 ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас, ушбу ўринбосарлар куйидаги ўринбосарлардан танланади:

а) ҳар бири C_{1-6} алкил ёки NH_2 радикали билан алмашилиши шарт бўлмаган (C_{1-6})алкил, 1 ёки 2 гетероатомни ўз ичига олиши шарт бўлмаган C_{3-7} спироциклоалкил, ёки (C_{2-6})алкенил;

д) NHR^{112} , бунда R^{112} арилдан иборат, бунда ушбу кўрсатилган арил, Нет, R^{150} радикали билан алмашилиши шарт эмас;

к) $COOH$; ва

л) $CONR^{129}R^{130}$, бунда R^{129} ва R^{130} мустақил равишда Н, (C_{1-6}) арил-алкил или Нетдан иборат, бунда ушбу алкил, арил ва Нет R^{150} радикали билан алмашилиши шарт эмас;

м) фенил ёки Нет, иккаласи R^{150} радикали билан алмашилиши шарт эмас ва бунда R^{150} куйидагидан танланади:

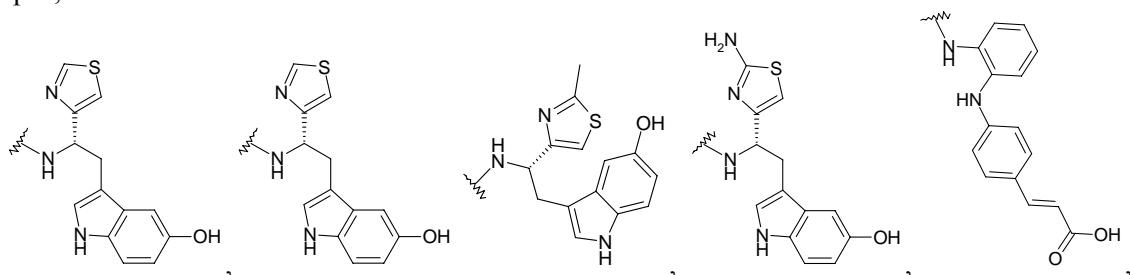
- 1 ёки 2 ўринбосарлардан, улар куйидаги ўринбосарлардан танланади:

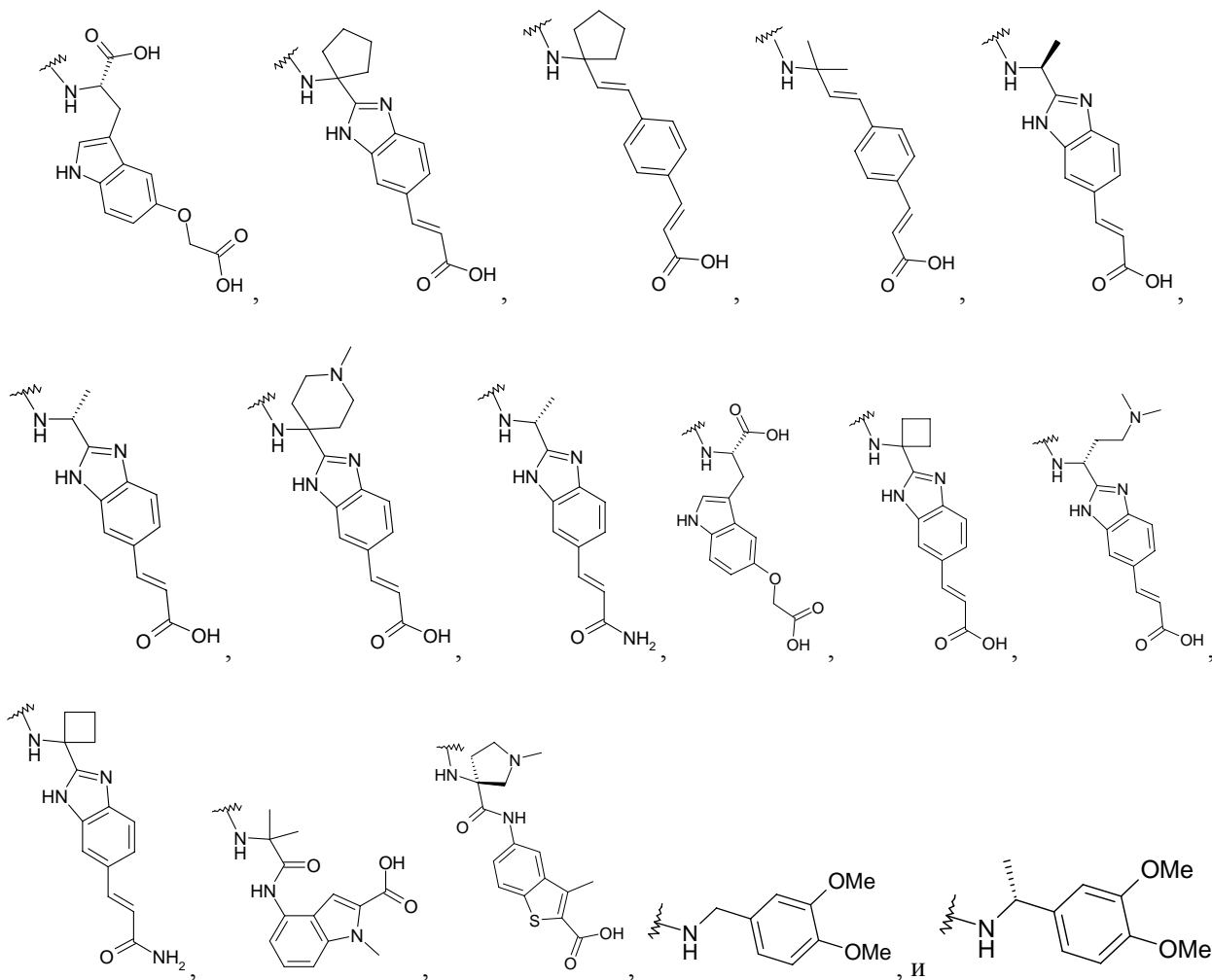
а) (C_{1-6})алкил ёки (C_{2-6})алкенил, иккаласи $COOH$ ёки $CONH_2$ гуруҳи билан алмашилиши шарт эмас;

к) $COOH$;

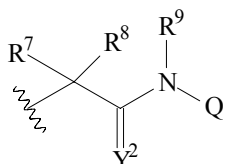
л) $CONH_2$.

23. 1-банд бўйича бирикмада Z куйидагидан танланади:





24. 1-банд бўйича бирикмада R⁶ қуйидагидан иборат:



бунда ҳар бир R⁷ ва R⁸ мустақил равишда Н ёки (C₁₋₆)алкилдан иборат, бунда ушбу алкил R⁷⁰ радикали билан алмашилиши шарт эмас; ёки R⁷ ва R⁸ бунда иккинчи (C₃₋₇)циклоалкил ёки таркибида О, N ва Sдан танланган 1 гетероатом бўлган 4, 5- ёки 6-аъзоли гетероцикл ҳосил қилиб, ковалент равишда бир-бири билан боғланган;

бунда R⁷⁰ қуйидагини англатади:

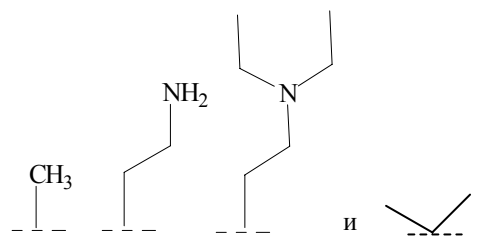
д) NR¹¹¹R¹¹², бунда R¹¹¹ Н ёки (C₁₋₆)алкилдан иборат ва R¹¹² Н ёки (C₁₋₆)алкилдан иборат.

25. 1 ёки 24-банд бўйича бирикмада ҳар бир R⁷ ва R⁸ мустақил равишда Н ёки (C₁₋₆)алкилдан иборат ёки R⁷ ва R⁸ бунда циклопропил, циклобутил, циклопентил, пирролидин, пиперидин, тетрагидрофуран, тетрагидропиран ёки пентаметилен-

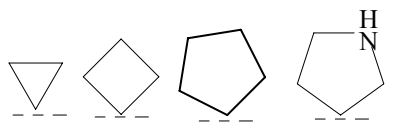
сульфид ҳосил қилиб, ковалент равишда бир-бири билан боғланган; бунда ушбу алкил қуйидагидан танланган ўринбосар билан моноалмашилган бўлиши шарт эмас:

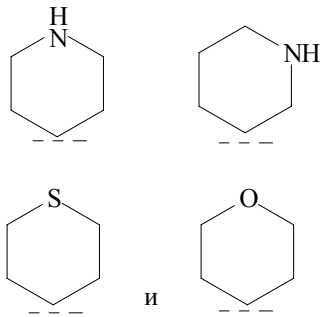
- а) (C₁₋₆)алкил; ва
- б) NH₂, N(CH₂CH₃)₂.

26. 25-банд бўйича бирикмада R⁷ ва R⁸ қуйидагидан танланади:

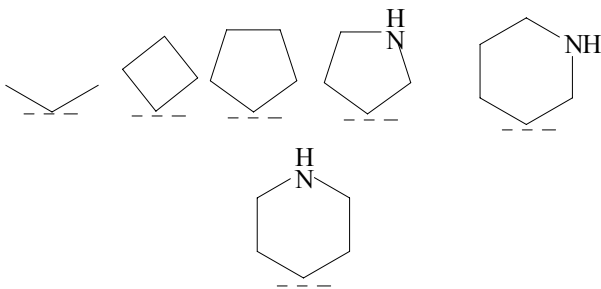


ёки R⁷ ва R⁸ бир-бири билан қуйидагини ҳосил қилади:





27. 26-банд бўйича бирикмада R^7 ва R^8 қуйидагидан танланади:



28. 24-банд бўйича бирикмада R^9 Нни билдиради.

29. 24-банд бўйича бирикмада Q 6- ёки 10-аъзоли арил, Нет ёки $(C_{1-6}$ алкил)арилдан иборат, уларнинг ҳарбири қуйидагилар билан алмашилиши шарт эмас:

- галоген ёки цианодан танланган ўринбосар; ёки
- қуйидаги ўринбосарлардан танланган 1-4 ўринбосарлар:

а) (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{2-6}) алкенил ёки (C_{2-8}) алкинил, (C_{1-6}) , уларнинг ҳар бири R^{150} радикали билан алмашилиши шарт эмас;

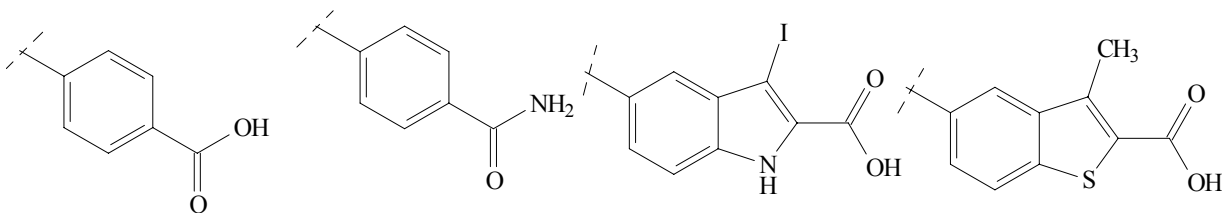
б) OR^{104} , бунда R^{104} Ндан иборат,

г) $SO_2N(R^{108})_2$, бунда ҳар бир R^{108} мустақил равишда Ндан иборат,

д) $NR^{111}R^{112}$, бунда R^{111} Н ёки (C_{1-6}) алкилдан иборат, бунда R^{111} Н ёки (C_{1-6}) алкилдан иборат, R^{112} эса Н ёки (C_{1-6}) алкилдан иборат,

е) $NR^{116}COR^{117}$, бунда ҳар бир R^{116} ва R^{117} Н ёки (C_{1-6}) алкилдан иборат,

з) $NR^{121}COCOR^{122}$, бунда R^{121} Ндан иборат, ва R^{122} OR^{123} ёки $N(R^{124})_2$ дан иборат, бунда R^{123} ва ҳар бир R^{124} мустақил равишда Н ёки (C_{1-6}) алкилдан иборат ёки R^{124} Олни иблдиради,



к) $COOR^{128}$, бунда R^{128} Ндан иборат,
л) $CONR^{129}R^{130}$, бунда R^{129} ва R^{130} мустақил равишда Ндан иборат ва

м) Нет R^{150} радикали билан алмашилиши шарт эмас; бунда R^{150} қуйидагидан танланади:

1 цианодан танланган 1 ўринбосар ёки
- қуйидаги ўринбосарлардан танланган 1-3 ўринбосарлар:

д) $NR^{111}R^{112}$, бунда R^{111} Ндан иборат ва R^{112} Ндан иборат,

к) тетразол ёки $COOR^{128}$, бунда R^{128} Ндан иборат ва

л) $CONR^{129}R^{130}$, бунда R^{129} ва R^{130} мустақил равишда Ндан иборат.

30.29-банд бўйича бирикмада Q 6- ёки 10-аъзоли арил ёки Нетни билдиради, иккалови қуйидагилар билан алмашилиши шарт эмас:

- галоген атоми ёки циано ёки

- қуйидаги ўринбосарлардан танланган 1-3 ўринбосарлар:

а) (C_{1-6}) алкил, биринчи (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{2-6}) -алкенил ёки (C_{2-8}) алкинил, уларнинг ҳар бири R^{150} радикали билан алмашилиши шарт эмас;

б) OR^{104} , бунда R^{104} Нни билдиради,

г) SO_2NHR^{108} , бунда R^{108} Нни билдиради;

д) $NR^{111}R^{112}$, бунда иккала R^{111} ва R^{112} мустақил равишда Н ёки (C_{1-6}) алкилдан иборат;

е) $NHCOR^{117}$, бунда R^{117} Н ёки (C_{1-6}) алкилни билдиради;

з) $NHCOCOR^{122}$, бунда R^{122} OR^{123} ёки $N(R^{124})_2$ ни билдиради, бунда R^{123} ва ҳар бир R^{124} мустақил равишда Н ёки (C_{1-6}) алкилдан иборат;

к) $COOR^{128}$, бунда R^{128} Нни билдиради;

л) $CONHR^{130}$, бунда R^{130} Нни иблдиради;

м) Нет R^{150} радикали билан алмашилиши шарт эмас; бунда R^{150} қуйидагидан танланади:

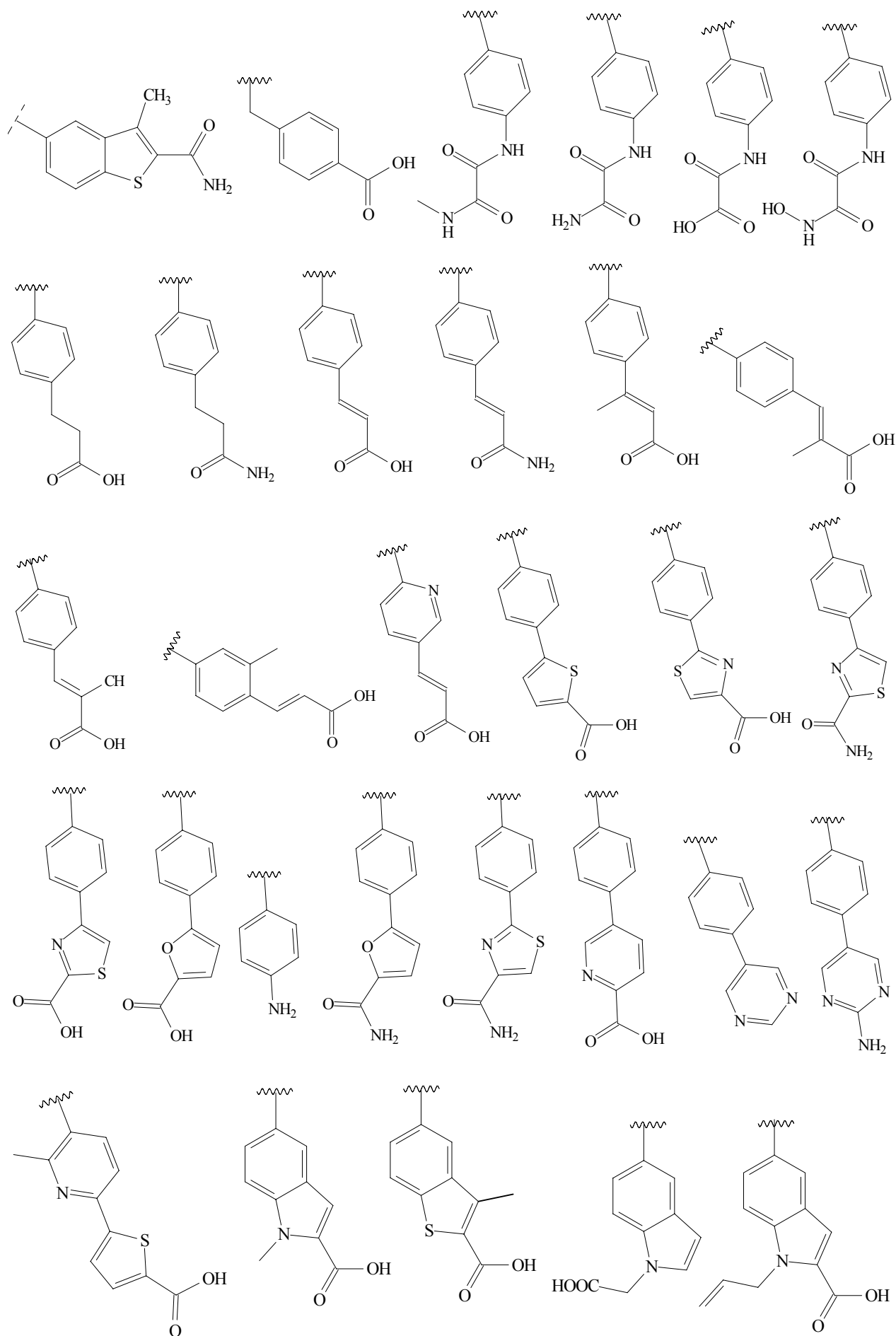
- қуйидагидан танланган 1-3 ўринбосарлар:

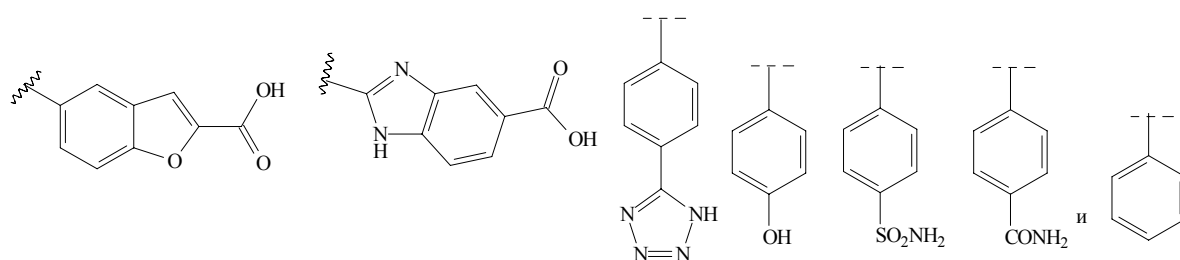
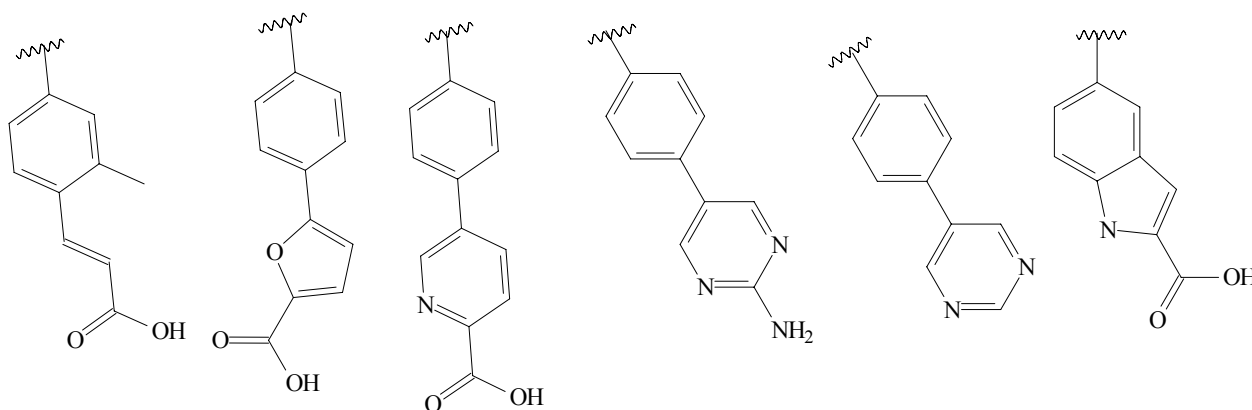
д) $NR^{111}R^{112}$, бунда иккала R^{111} ва R^{112} мустақил равишда Ндан иборат; к) $COOR^{128}$, бунда R^{128} Нни иблдиради ва

л) $CONHR^{130}$, бунда R^{130} Нни билдиради.

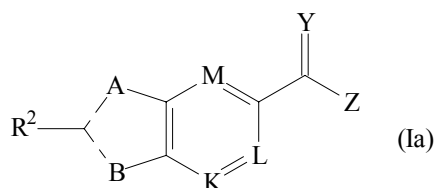
31. 29-банд бўйича бирикмада Q қуйидаги ўринбосарлардан танланади:

л) $CONHR^{130}$, бунда R^{130} Нни билдиради.





33. 1-банд бўйича (Ia) формуласи билан аниқланган бирикма:



унда

A O, S, NR¹ ёки CR¹ ни билдиради;

B NR³ ёки CR³ ни билдиради;

R¹ H, (C₁₋₆)алкил, бензил ва таркибида O, N ва S дан танланган 1-4 гетероатом бўлган, (C₁₋₆)алкил)-5- ёки 6-аъзоли гетероциклдан ташкил топган гуруҳдан танланади

бунда ушбу бензил ва ушбу гетероцикл COOH дан ташкил топган гуруҳдан танланган 1-4 ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас;

R² H, галоген, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, фенил, O, N ва S дан танланган 1-4 гетероатомни ўз ичига олган 5-ёки 6-аъзоли гетероцикл, пирдин-N-оксиди, ва O, N ва S дан танланган 1-4 гетероатомни ўз ичига олган 9- ёки 10-аъзоли гетеробициклдан ташкил топган гуруҳдан танланади,

ушбу фенил, гетероцикл ва гетеробицикл қуйидаги гуруҳдан танланган 1-4 ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас: галоген, C(галоген)₃, (C₁₋₆)алкил, OH, O(C₁₋₆)алкил), NH₂, ва N(C₁₋₆)алкил)₂;

R³ (C₃₋₇)циклоалкилни билдиради;
M N ёки CR⁴ дан иборат, бунда R⁴ H ни билдиради,

K ва L CHни билдиради;

- ёки оддий, ёки иккиланган боғланишни билдиради;

Y O ёки S ни билдиради;

Z NR⁶R^{6a} ни билдиради;

(C₁₋₆)алкил, (C₃₋₆)циклоалкил, (C₆₋₁₀)арил, (C₆₋₁₀)арил(C₁₋₆)алкил, (C₂₋₆)алкенил, (C₃₋₆)циклоалкил-(C₂₋₆)алкенил ва O, N ва S дан танланган 1-4 гетероатомни ўз ичига олган(C₁₋₆)алкил-5- ёки 6-аъзоли гетероцикл,

бунда барча кўрсатилган циклоалкил, арил, алкенил, гетероцикл COOH, (C₁₋₆)алкил, O, N ва S дан танланган 1-4 гетероатомни ўз ичига олган (C₁₋₆)алкил-5- ёки 6-аъзоли гетероциклдан танланган 1-4 ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас,

бунда ушбу алкил ва гетероцикл (C₁₋₆)алкил), NH₂ ва N(C₁₋₆ алкил)₂дан танланган 1-4 ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас; ва

ушбу O, N ва S дан танланган 1-4 гетероатомни ўз ичига олган 9- ёки 10-аъзоли гетеробицикл қуйидаги ўринбосарлардан танланган 1-4 ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас:

(C₂₋₄алкенил)COOH ва -O-(C₁₋₆)алкил COOH, ва қуйидаги ўринбосарлардан танланган 1-4 ўринбосарлар билан алмашилиши шарт бўлмаган 6-аъзоли арил:

(C₂₋₄алкенил)COOH ва (C₁₋₄)алкокси, ва бунда ушбу алкил O, N ва S ни ўз ичига олувчи гуруҳдан танланган 1-4 гетероатомга эга 5 ёки 6-аъзоли гетероциклдан танланган 1-4 ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас,

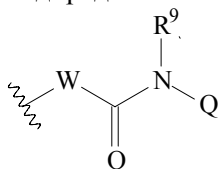
бунда ушбу гетероцикл (C₁₋₆)алкил, NH₂ ва N(C₁₋₆ алкил)₂ ни ўз ичига олган гуруҳдан танланган 1-4 ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас;

9- ёки 10-аъзоли гетеробиицикл O, N ва S дан танланган 1-4 гетероатомга эга, ушбу гетеробиицикл куйидагилардан танланган 1-4 ўринбосарлардан танланган 1-4 ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас: (C₂₋₄алкенил)COOH и -O-(C₁₋₆)алкил COOH ва

6-аъзоли арил (C₂₋₄алкенил)COOH, OH ва (C₁₋₄)алкоксидан танланган 1-4 ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас;

R^{6a} Н дан иборат ёки

R⁶ куйидагини билдиради



бунда W CR⁷R⁸ни билдиради, бунда ҳар бир R⁷ ва R⁸ мустақил равишда H ёки (C₁₋₆алкил)дан иборат

ёки R⁷ ва R⁸ (C₃₋₇циклоалкил), O, N ва S дан танланган 1-4 гетероатомни ўз ичига олган 4-, 5- ёки 6-аъзоли гетероцикл гуруҳини ҳосил қилиб, ковалент равишда бир-бири билан боғланган; ёки R⁷ ёки R⁸ нинг бири пирролидин ҳосил қилиб, ковалент равишда R⁹ радикалига қўшилган;

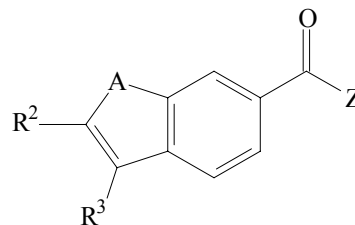
бунда ушбу алкил, циклоалкил ва гетероцикл, куйидагилардан ташкил топган гуруҳдан танлан-

ган 1-4 ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас: (C₁₋₆алкил), NH₂ ва N(C₁₋₆алкил)₂, R⁹ Ндан иборат ва

Q 6-аъзоли арил, O, N ва Sдан танланган 1-4 гетероатомни ўз ичига олган 5- ёки 6-аъзоли гетероцикл, ва O, N ва Sдан танланган 1-4 гетероатомни ўз ичига олган 9- ёки 10-аъзоли гетеробиициклдан ташкил топган гуруҳдан танланади; бунда барча кўрсатилган арил, гетероцикл ва гетеробиицикл куйидаги ўринбосарлардан танланган 1-4 ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас: OH, COOH, (C₁₋₆)алкил, (C₁₋₆)алкилCOOH, (C₁₋₆ алкил)(C₂₋₄ алкинил), галоген, (C₂₋₄)алкенил, O, N ва Sдан танланган 1-4 гетероатомни ўз ичига олган 5- ёки 6-аъзоли иккинчи гетероцикл, бунда ушбу иккинчи гетероцикл куйидаги ўринбосарлардан танланган 1-4 ўринбосарлар билан алмашилиши шарт эмас: COOH; NH₂, сульфонидамо ва -CONH₂, (C₂₋₄алкенил)COOH, бунда ушбу алкенил битта ёки иккита (C₁₋₆алкил),

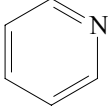
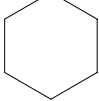
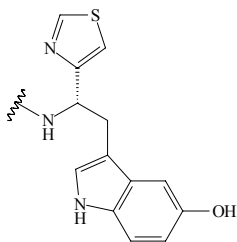
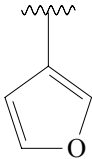
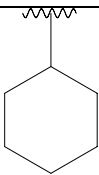
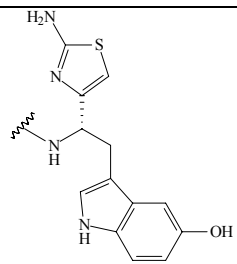
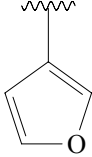
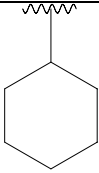
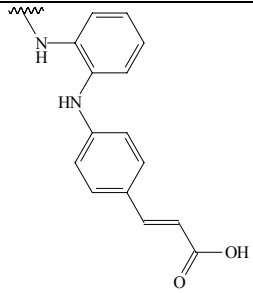
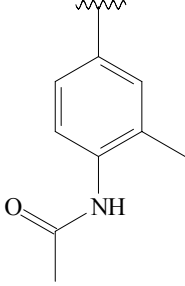
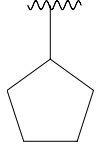
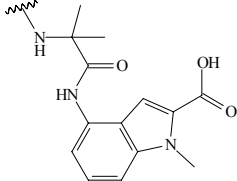
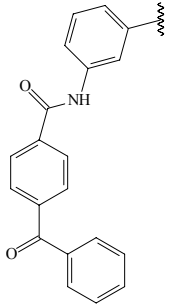
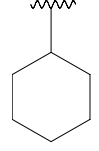
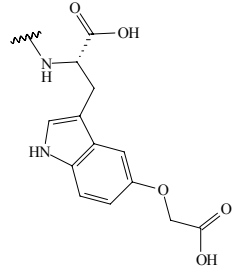
тетразолил, NH₂, -O(C₁₋₆алкил)COOH, циано, -NHCOCOOH, -NHCOCONHOH, -NHCOCONH₂, -NHCOCONHCH₃, NH(C₁₋₆алкил)₂ ва -NH(C₂₋₄)-ацил ўринбосарлари билан алмашилиши шарт эмас, ёки ушбу бирикманнинг тузи.

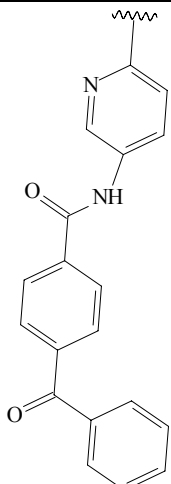
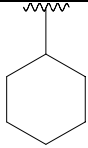
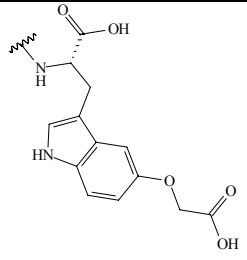
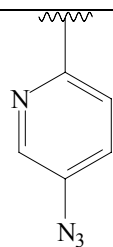
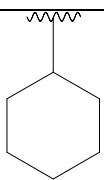
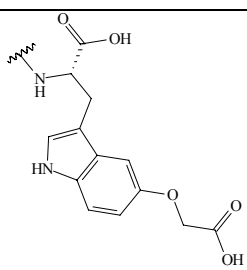
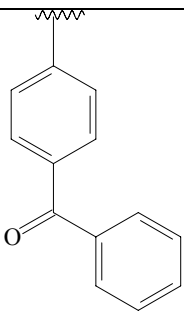
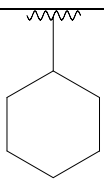
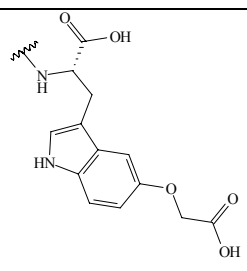
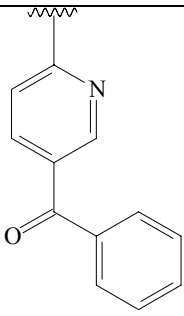
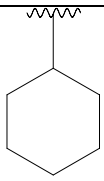
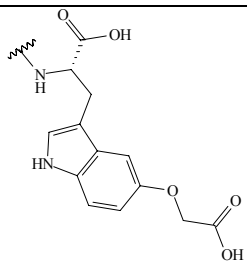
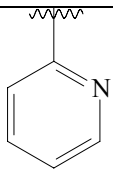
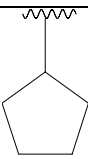
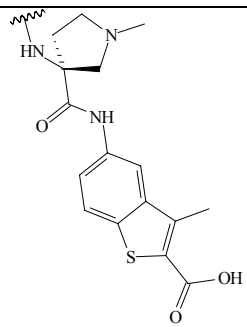
34. 1-банд бўйича бирикма формуласи:

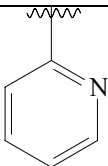
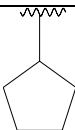
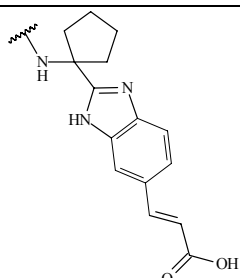
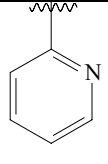
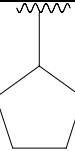
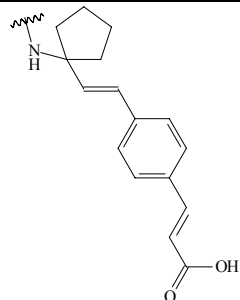
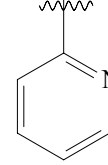
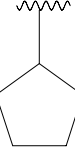
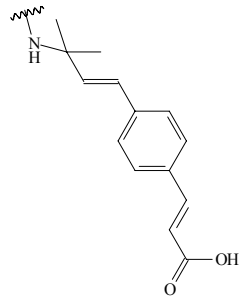
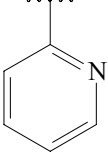
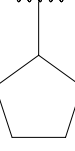
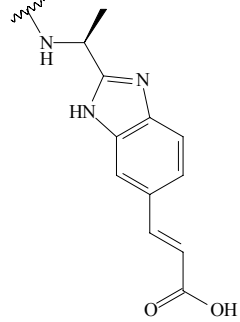
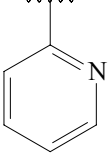
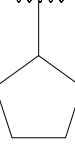
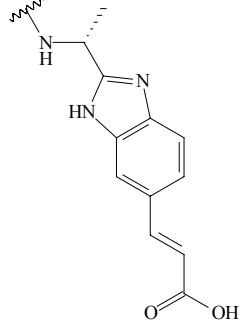
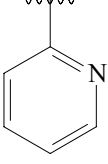
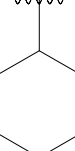
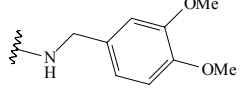


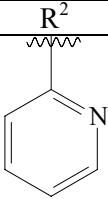
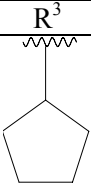
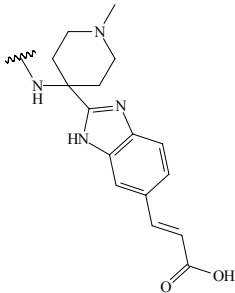
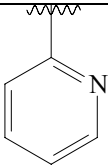
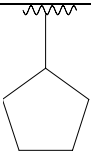
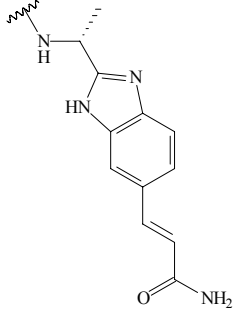
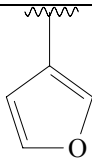
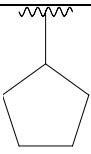
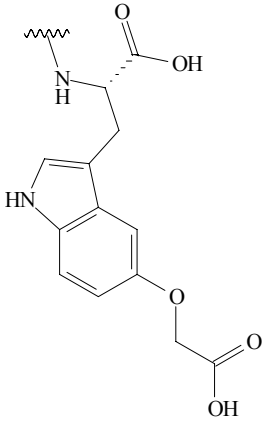
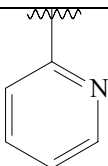
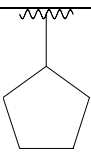
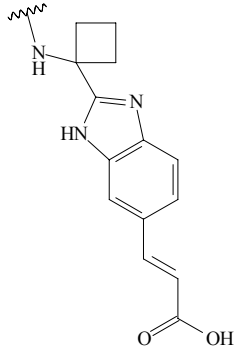
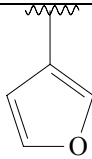
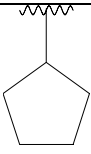
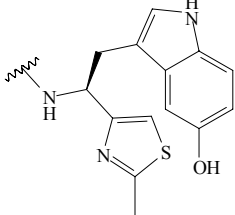
бунда A, R², R³ ва Z куйидагича аниқланади:

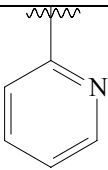

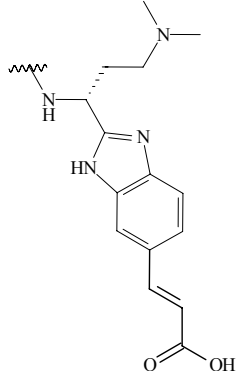
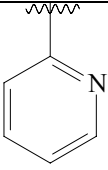
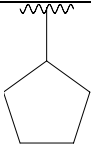
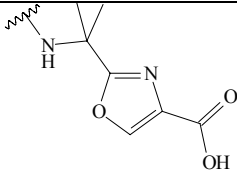
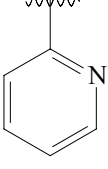
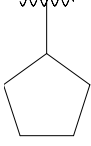
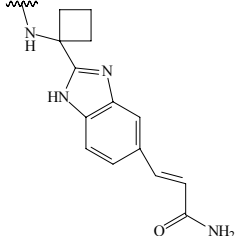
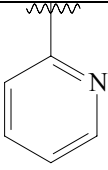
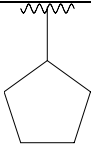
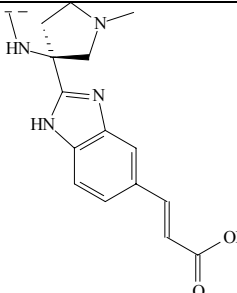
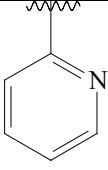
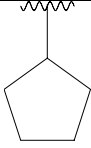
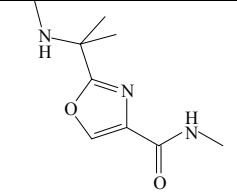
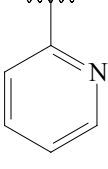
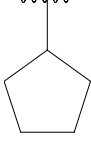
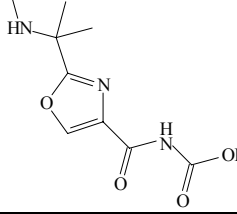
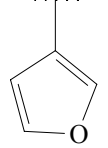
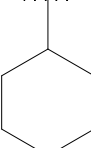
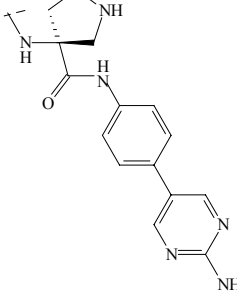
Бирикма №	A	R ²	R ³	Z
1001	NH			
1002	NH			

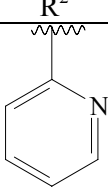
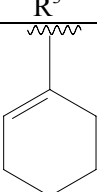
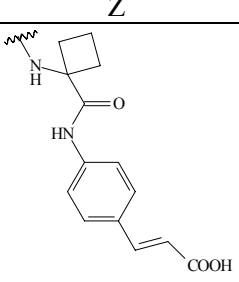
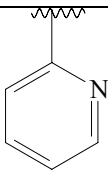
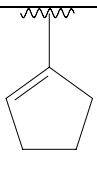
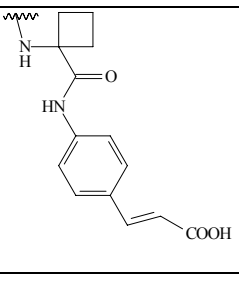
Бирикма №	A	R ²	R ³	Z
1003	NH			
1004	NH			
1005	NH			
1006	NMe			
1008	NMe			

Бирикма №	A	R ²	R ³	Z
1009	NMe			
1010	NMe			
1011	NMe			
1012	NMe			
1013	NMe			

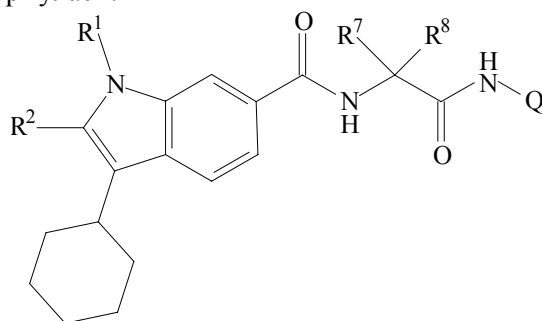
Бирикма №	A	R ²	R ³	Z
1014	NMe			
1015	NMe			
1016	NMe			
1017	NMe			
1018	NMe			
1019	NH			

Бирикма №	A	R ²	R ³	Z
1020	NMe			
1021	NMe			
1022	S			
1023	NMe			
1024	S			

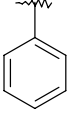
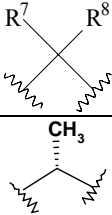
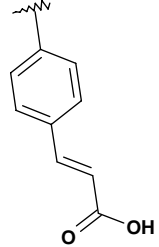
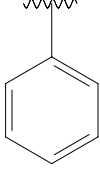
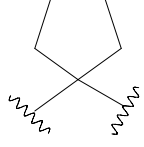
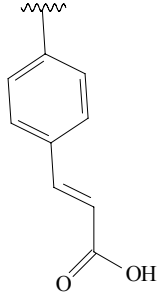
Бирикма №	A	R ²	R ³	Z
1025	NMe			
1026	NMe			
1027	NMe			
1028	NMe			
1029	NMe			
1030	NMe			
1031	NMe			

Бирикма №	A	R ²	R ³	Z
1032	NMe			
1033	NMe			

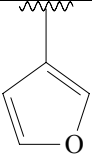
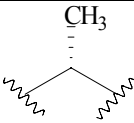
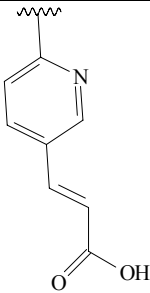
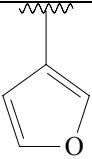
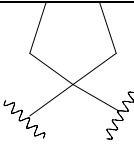
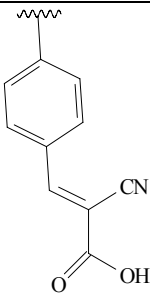
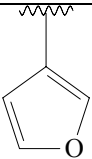
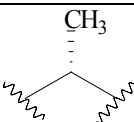
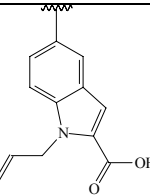
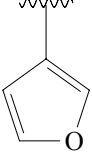
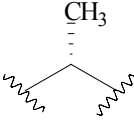
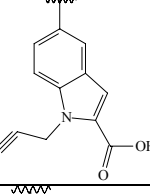
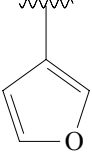
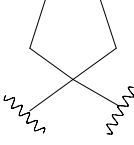
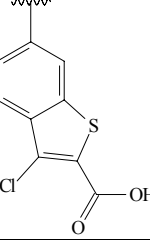
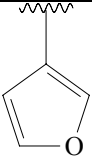
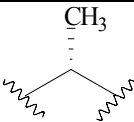
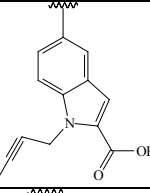
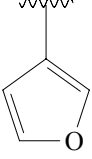
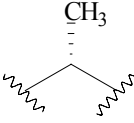
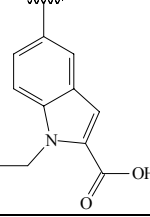
35. 1-банд бўйича бирикма формуласи:

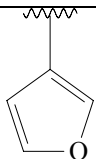
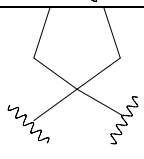
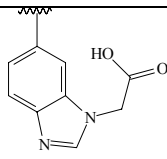
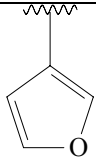
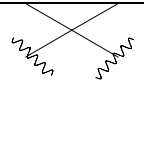
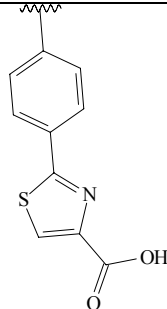
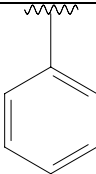
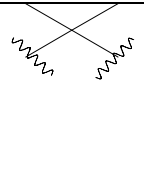
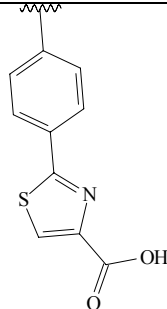
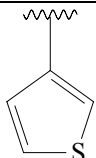
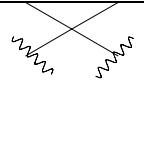
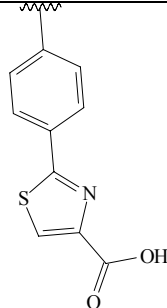
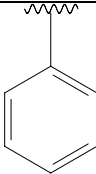
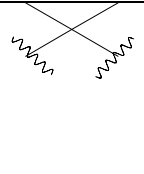
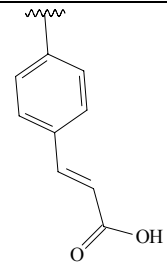
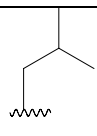
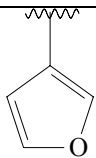
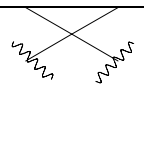
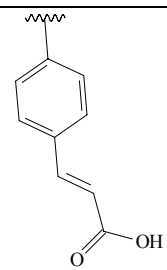



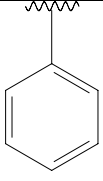
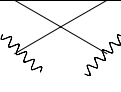
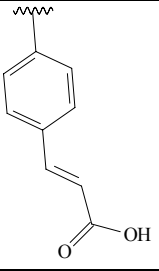
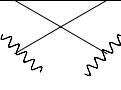
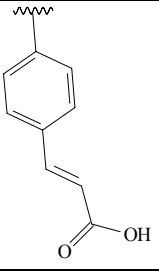
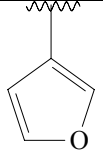
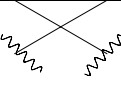
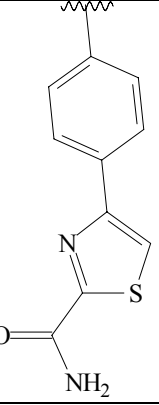
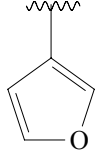
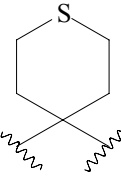
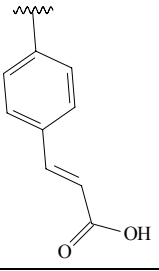
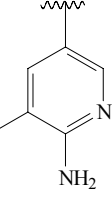
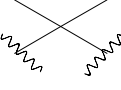
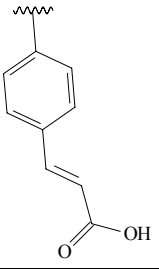
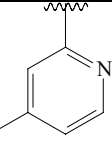
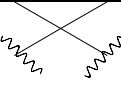
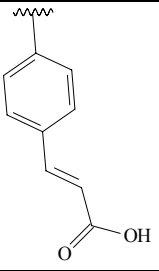
бунда R¹, R², R⁷, R⁸ ва Q қуйидагича аниқланади:

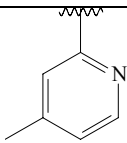
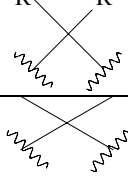
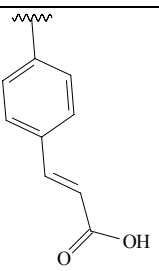
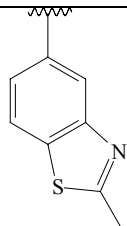
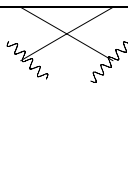
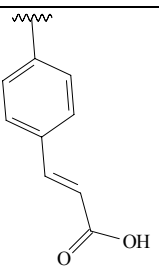
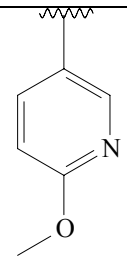
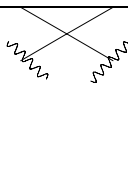
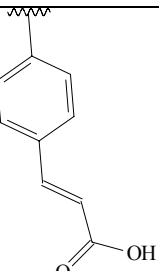
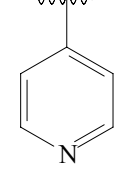
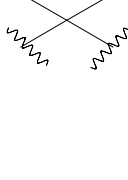
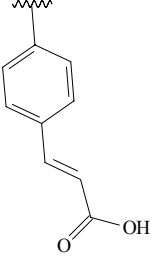
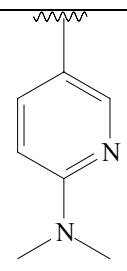
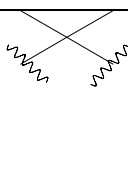
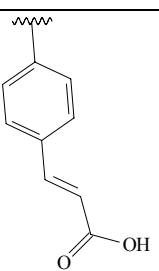
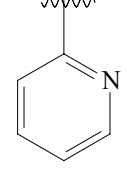
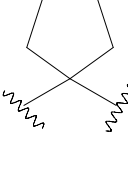
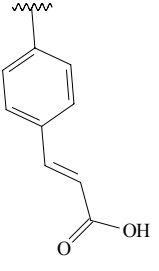
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2001	H				;
2002	H				;

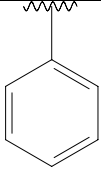
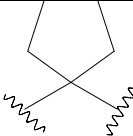
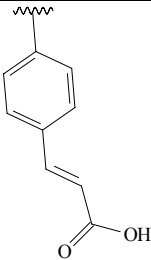
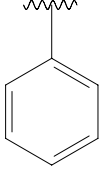
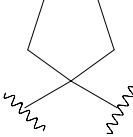
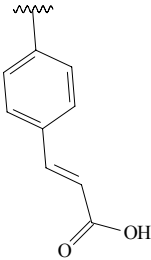
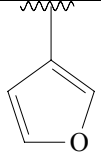
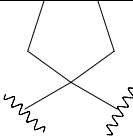
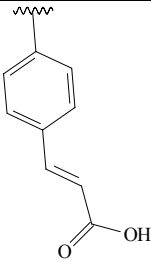
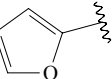
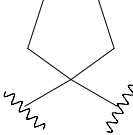
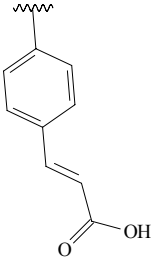
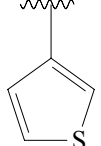
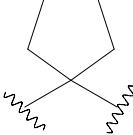
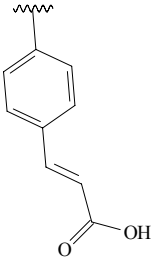
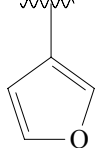
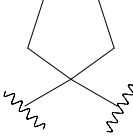
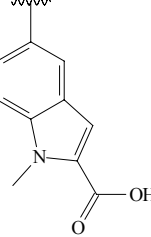
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2003	H	Br			;
2004	H				;
2005	H				;
2006	Me				;
2008	H				;

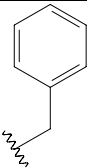
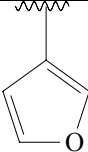
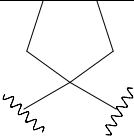
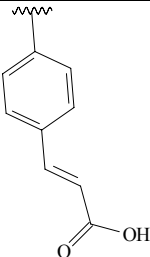
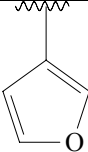
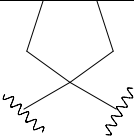
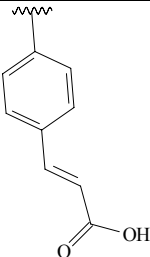
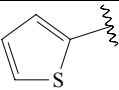
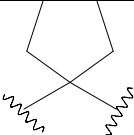
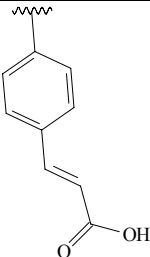
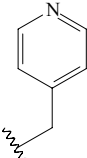
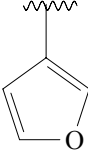
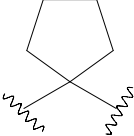
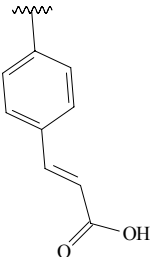
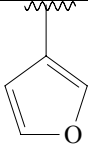
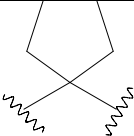
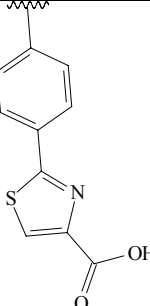
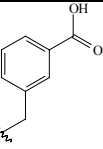
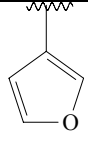
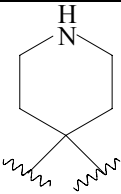
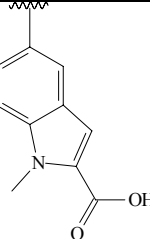
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2009	H				;
2010	H				;
2011	H				;
2012	H				;
2013	H				;
2014	H				;
2015	H				;

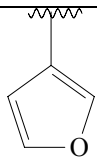
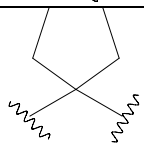
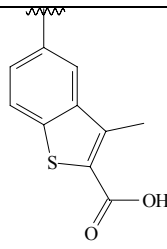
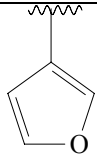
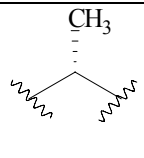
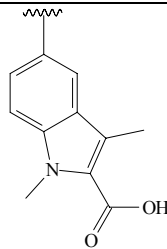
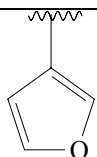
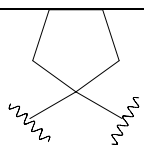
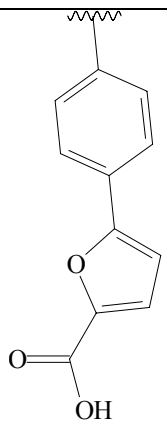
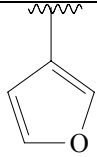
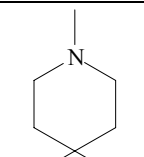
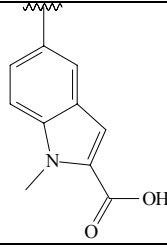
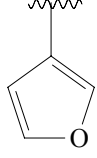
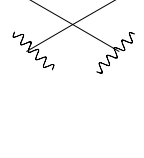
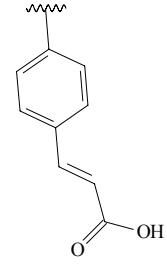
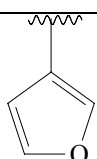
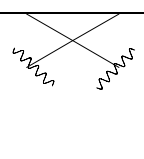
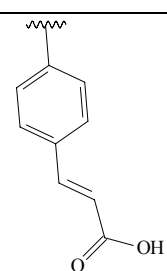
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2016	H				;
2017	H				;
2018	H				;
2019	H				;
2020	Et				;
2021					;

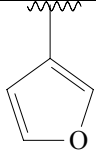
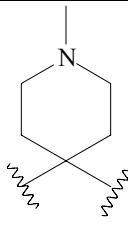
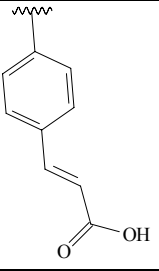
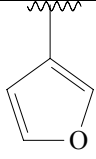
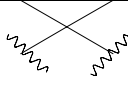
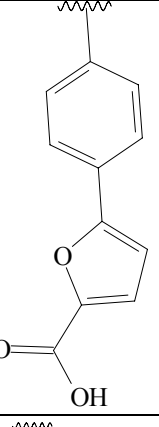
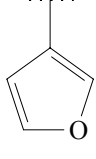

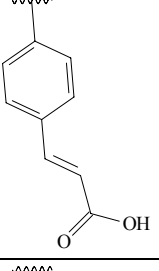
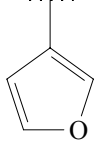
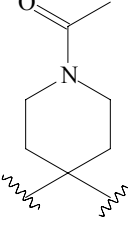
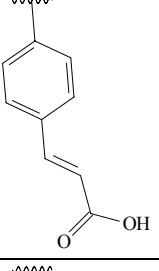
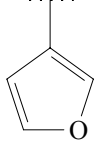
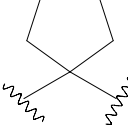
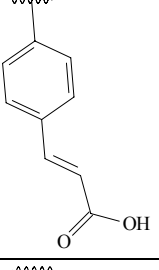
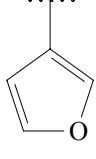
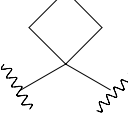
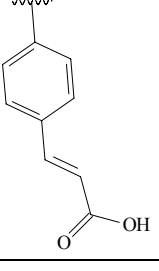
Бирикма №	R ¹	R ²	R⁷ R⁸	Q	
2022					;
2023	Me	H			;
2024	H				;
2025	H				;
2026	Me				;
2027	Me				;

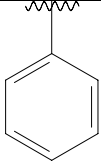
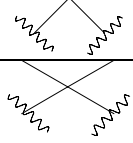
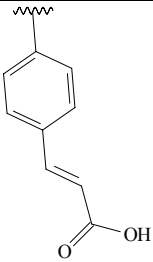
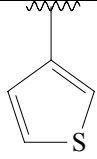
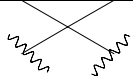
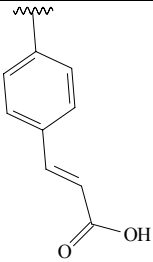
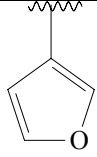
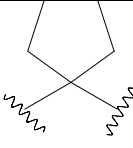
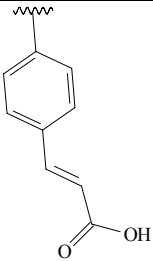
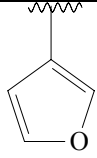
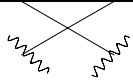
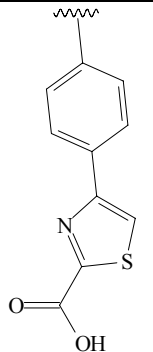
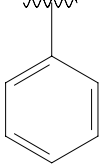

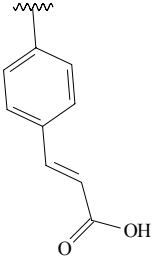
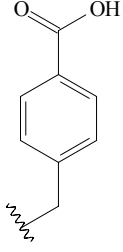
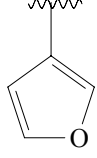

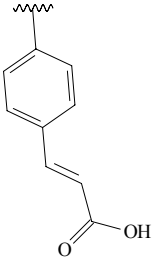
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2028	Me				;
2029	Me				;
2030	Me				;
2031	Me				;
2032	Me				;
2033	H				;

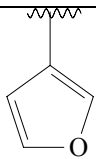
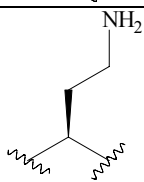
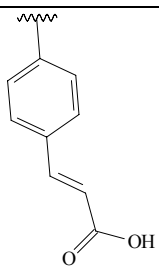
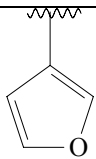
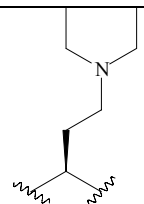
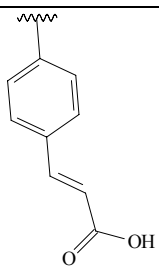

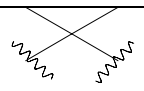
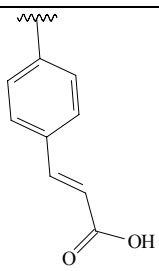
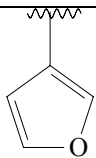
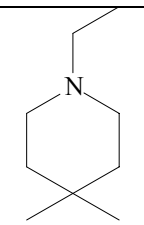
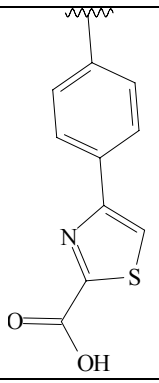
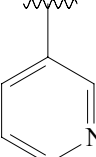
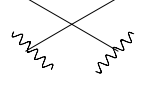
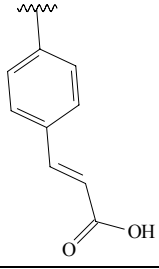
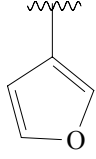
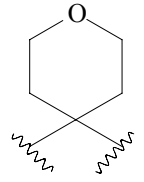
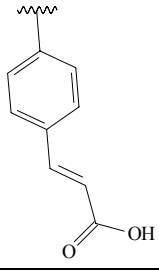
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2034	Me				;
2035	H				;
2036	H				;
2037	H				;
2038	H				;
2039	H				;

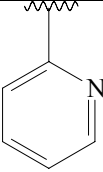
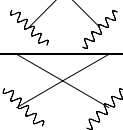
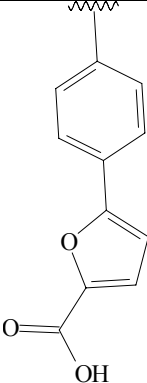
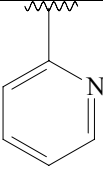

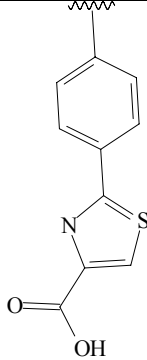
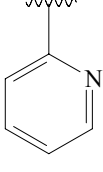

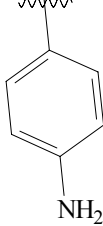
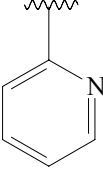
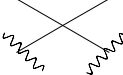
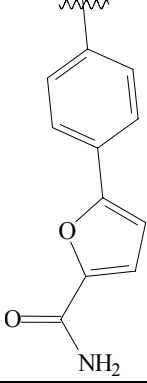
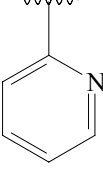

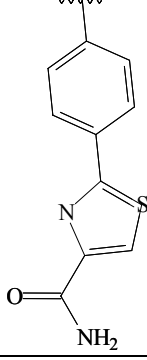
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2040					;
2041	Me				;
2042	H				;
2043					;
2044	H				;
2045					;

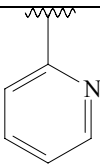
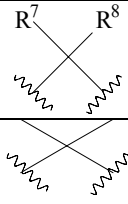
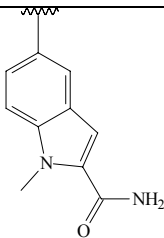
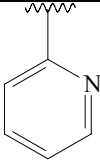
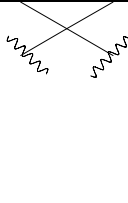
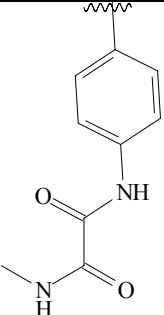
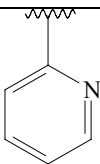
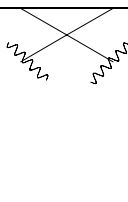
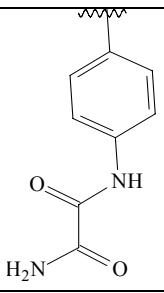
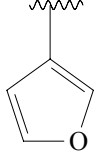
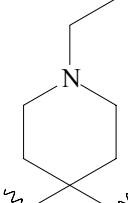
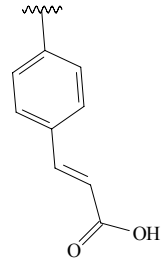
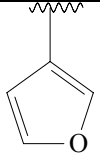
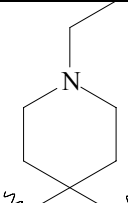
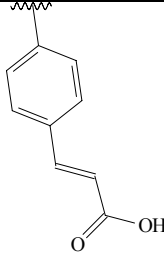
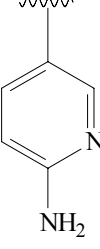
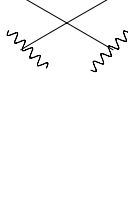
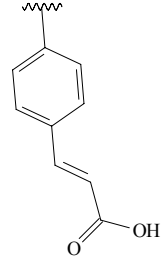
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2046	H				;
2047	H				;
2048	H				;
2049	H				;
2050	H				;
2051	Me				;

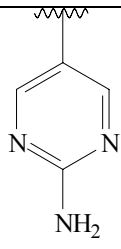
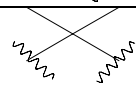
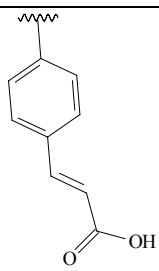
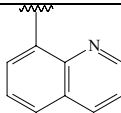
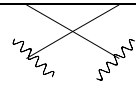
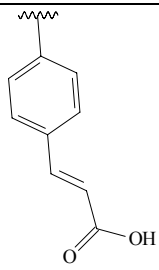
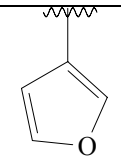
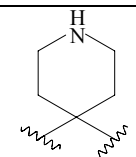
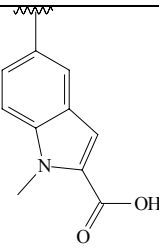
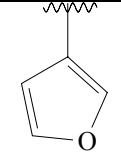
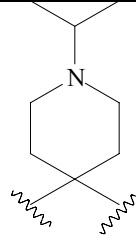
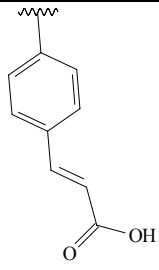
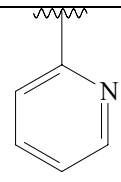
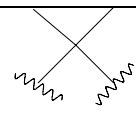
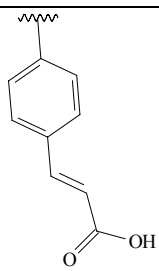
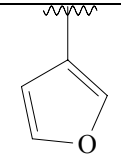
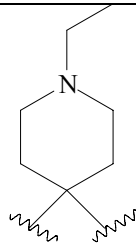
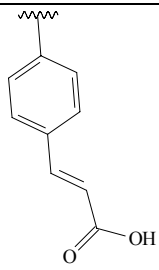
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2052	H				;
2053	H				;
2054	Et				;
2055	H				;
2056	H				;
2057	H				;

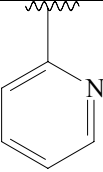
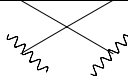
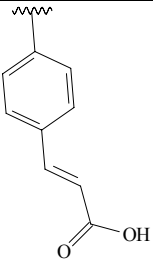
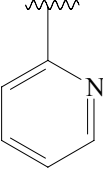
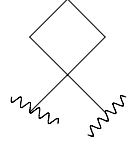
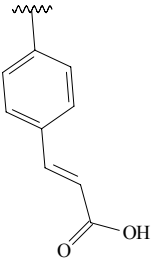
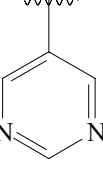

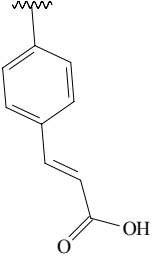
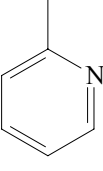
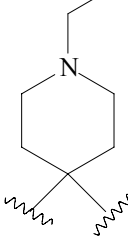
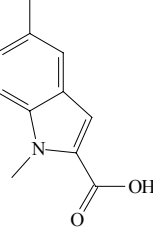
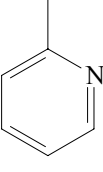

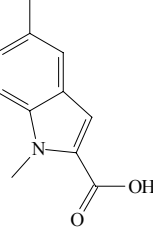
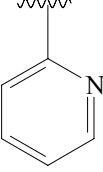

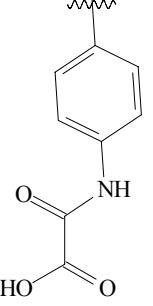
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2058	H				;
2059	H				;
2060	H				;
2061	H				;
2062	Me				;
2063					;

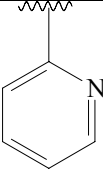
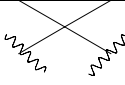
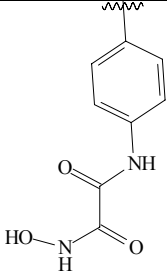
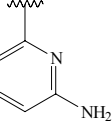
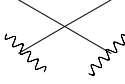
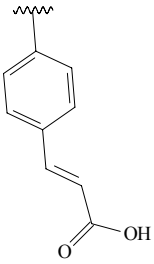
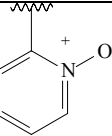
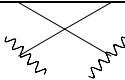
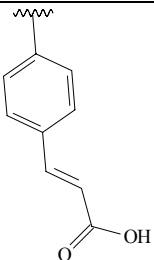
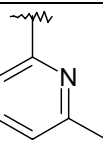

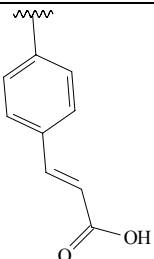
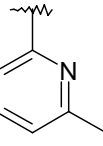
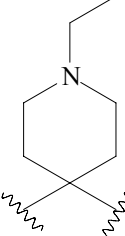
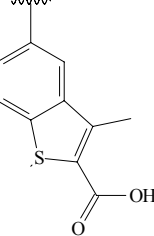
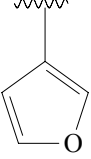
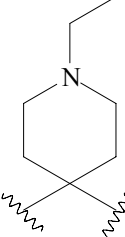
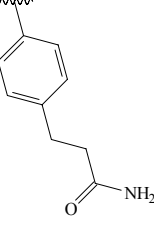
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2064	H				;
2065	H				;
2066	Me				;
2067	H				;
2068	Me				;
2069	H				;

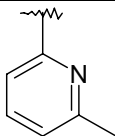
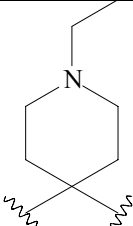
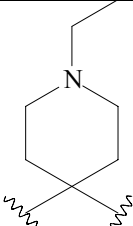
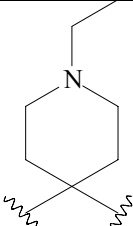
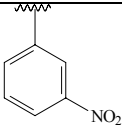
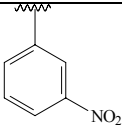
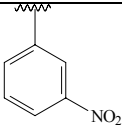
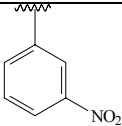
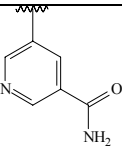
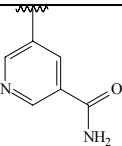
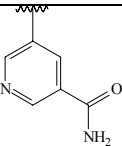
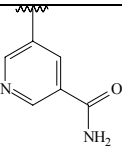
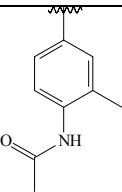
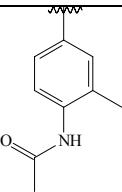
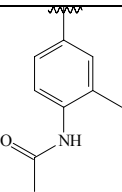
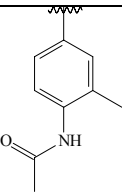
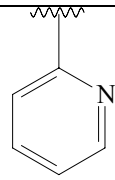
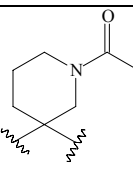
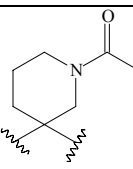
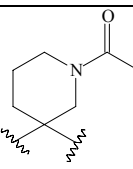
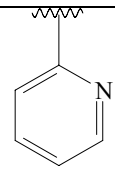
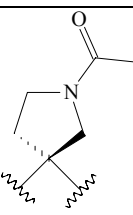
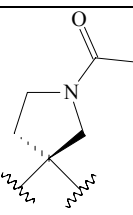
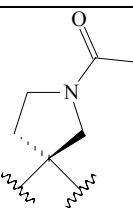
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2070	Me				;
2071	Me				;
2072	Me				;
2073	Me				;
2074	Me				;

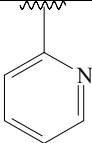

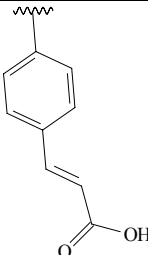
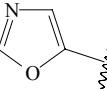
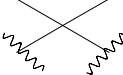
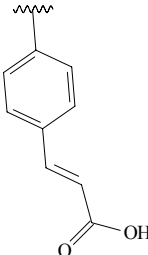
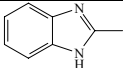

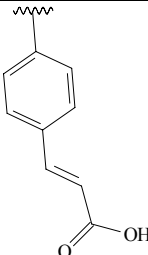
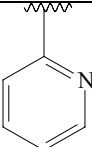
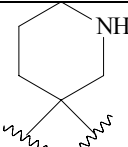
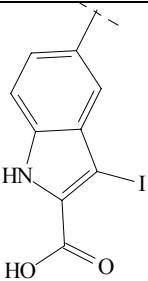
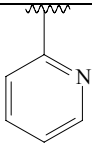
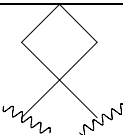
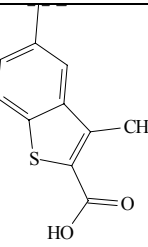
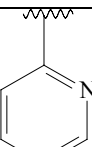
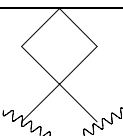
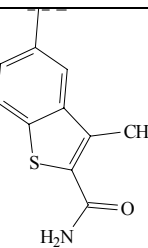
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2075	Me				;
2076	Me				;
2077	Me				;
2078	H				;
2079	H				;
2080	Me				;

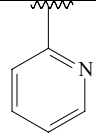
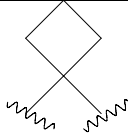
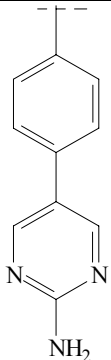
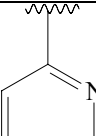
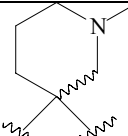
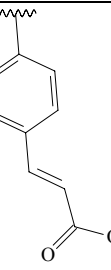
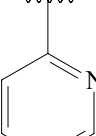
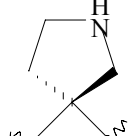
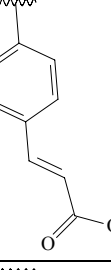
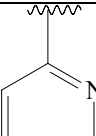

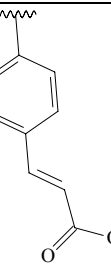
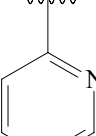
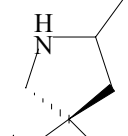
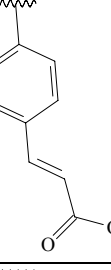
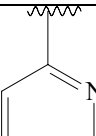
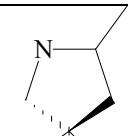
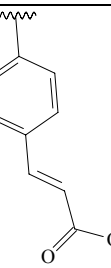
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2081	Me				;
2082	Me				;
2084	H				;
2086	H				;
2087	Me				;
2088	H				;

Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2089	H				;
2090	Me				;
2091	Me				;
2092	Me				;
2093	Me				;
2094	Me				;

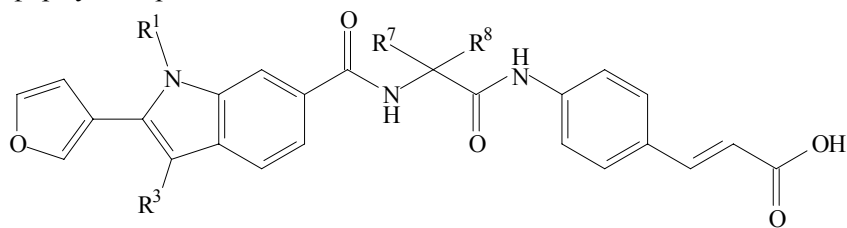
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2095	Me				;
2096	Me				;
2097	Me				;
2098	Me				;
2099	Me				;
2100	H				;

Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q		
2101	Me					;
2102	Me					;
2103	Me					;
2104	Me					;
2105	Me					;
2106	Me					;

Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2107	Me				;
2108	Me				;
2109	Me				;
2110	Me				;
2111	Me				;
2112	Me				;

Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2113	Me				;
2114	Me				;
2115	Me				;
2116	Me				;
2117	Me				; и
2118	Me				.

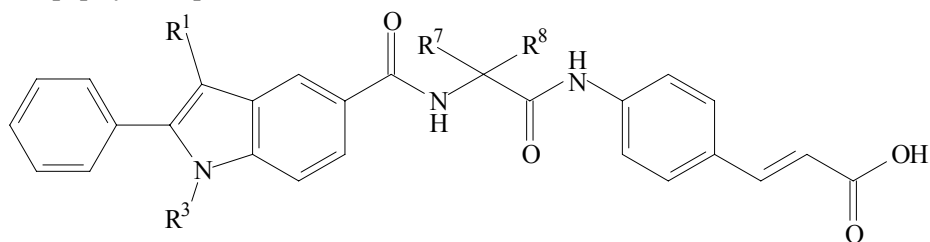
36. 1-банд бўйича формула бирикмаси:



бунда R^1 , R^3 , R^7 ва R^8 куйидагича аниқланади:

Бирикма №	R^1	R^3	R^7 R^8	
3001	H			;
3002	H			;
3003	Me			; и
3004	Me			.

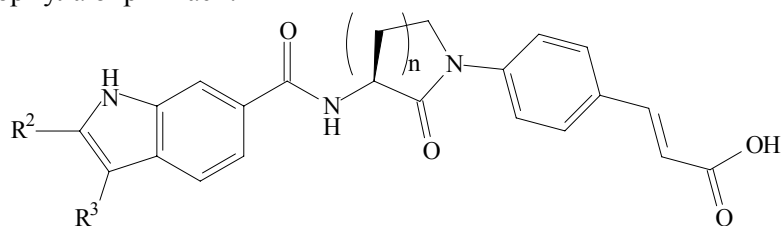
37. 1-банд бўйича формула бирикмаси:



бунда R^1 , R^3 , R^7 ва R^8 куйидагича аниқланади:

Бирикма №	R^1	R^3	R^7 R^8	
4001	Me			и
4002	H			.

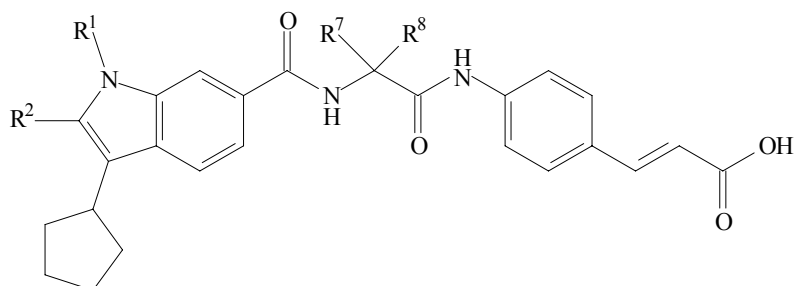
38. 1-банд бўйича формула бирикмаси:



бунда R^2 , R^3 ва n қуйидагича аниқланади:

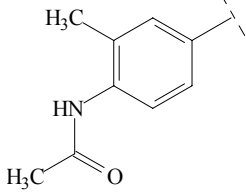
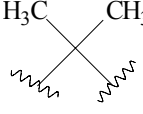
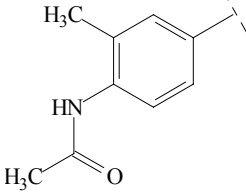
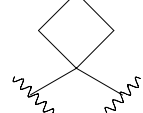
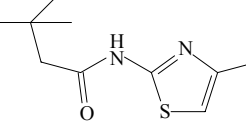
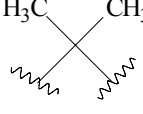
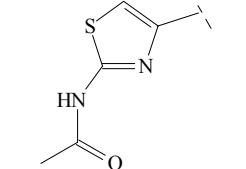
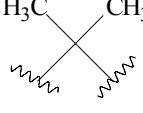
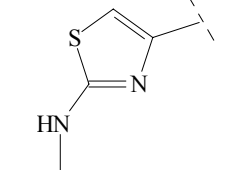
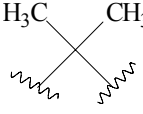
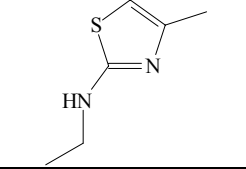
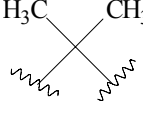
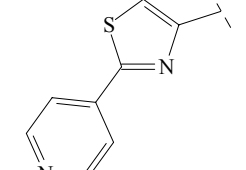
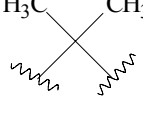
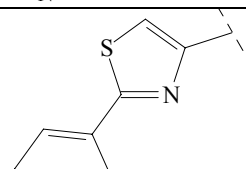
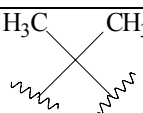
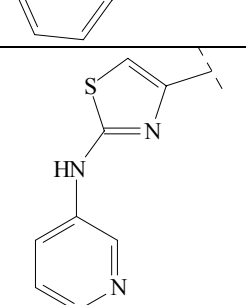
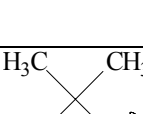
Бирикма №	R^2	R^3	n	
5001			1	.

39. 1-банд бўйича формула бирикмаси:

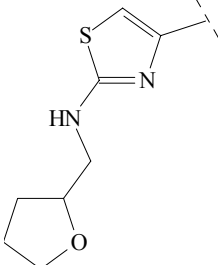
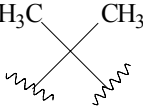
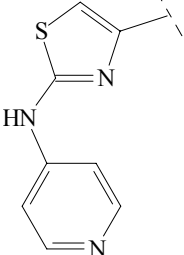
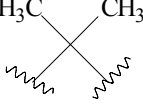
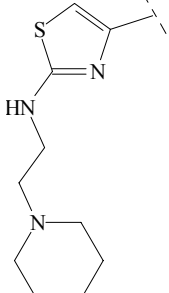
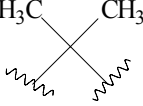
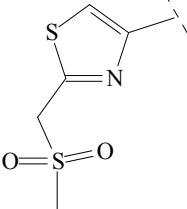
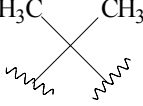
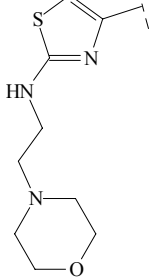
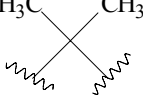
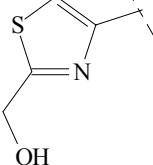
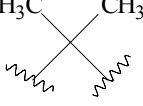
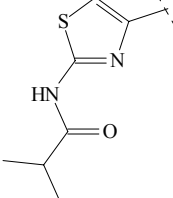
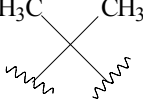


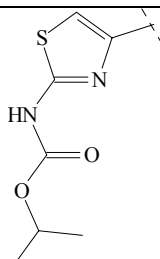
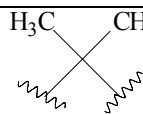
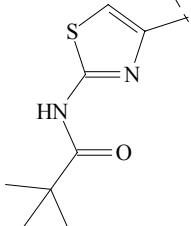
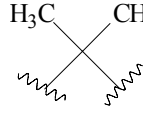
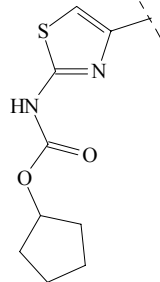
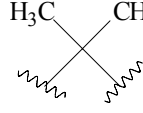
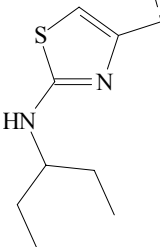
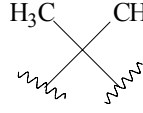
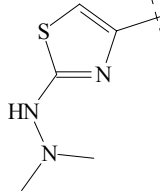
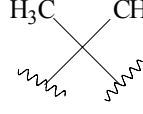
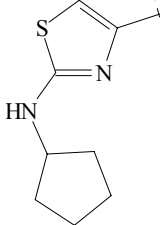
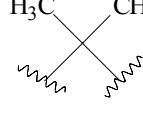
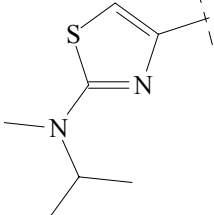
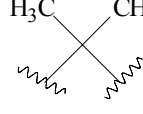
бунда R^1 , R^2 , R^7 ва R^8 қуйидагича аниқланади:

Бирикма №	R^1	R^2	R^7 , R^8	
6001	CH_3			;
6002	CH_3			;
6003	CH_3			;
6004	CH_3			;

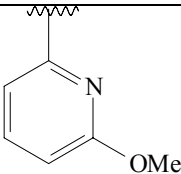
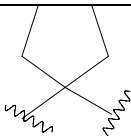
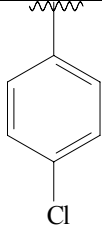
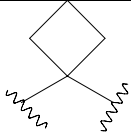
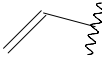
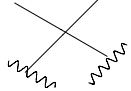
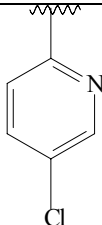
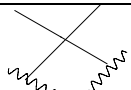
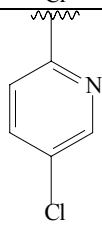
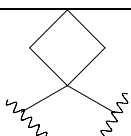
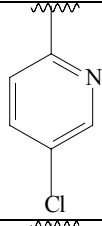
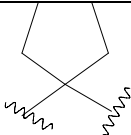
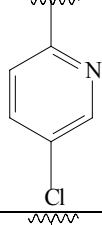
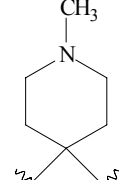
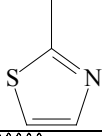
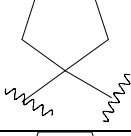
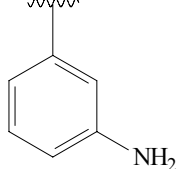
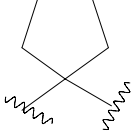
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6005	CH ₃			;
6006	CH ₃			;
6007	CH ₃			;
6008	CH ₃			;
6009	CH ₃			;
6010	CH ₃			;
6011	CH ₃			;
6012	CH ₃			;
6013	CH ₃			;

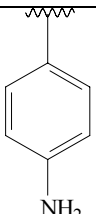
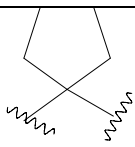
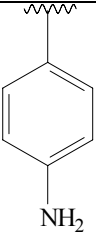
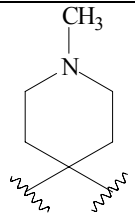
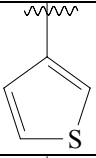
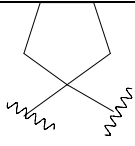
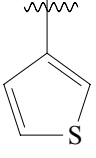
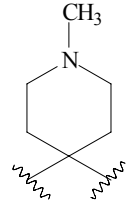
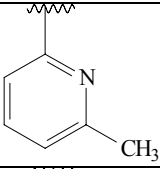
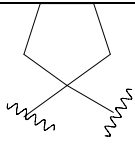
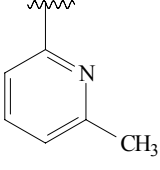
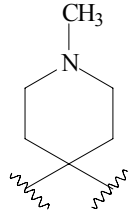
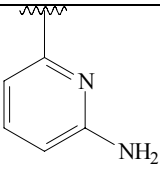
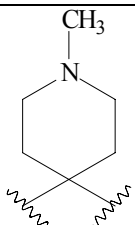
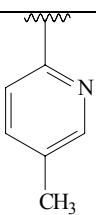
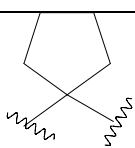
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6013	CH ₃			;
6014	CH ₃			;
6015	CH ₃			;
6016	CH ₃			;
6017	CH ₃			;
6018	CH ₃			;
6019	CH ₃			;
6020	CH ₃			;

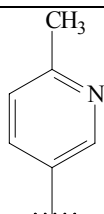
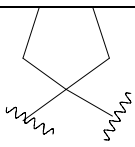
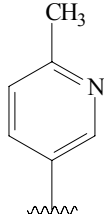
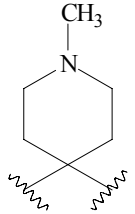
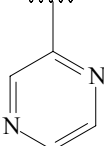
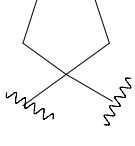
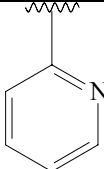
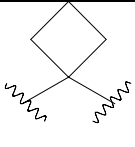
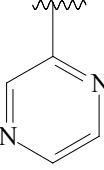
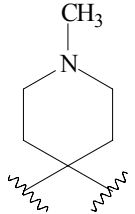
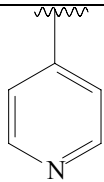
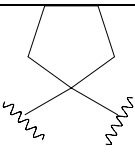
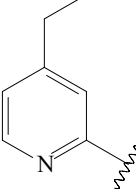
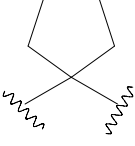
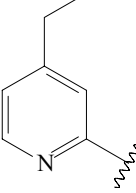
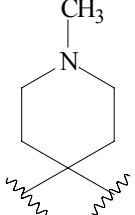
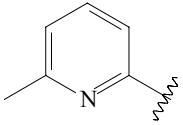
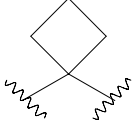
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6021	CH ₃			;
6022	CH ₃			;
6023	CH ₃			;
6024	CH ₃			;
6025	CH ₃			;
6026	CH ₃			;
6027	CH ₃			;

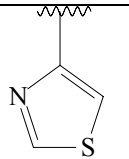
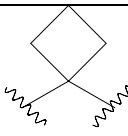
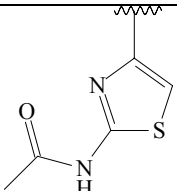
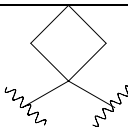
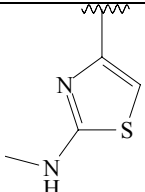
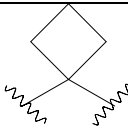
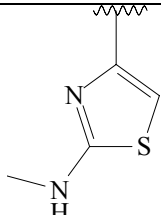
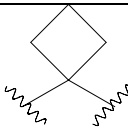
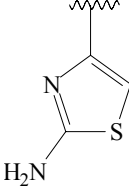
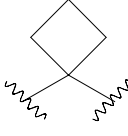
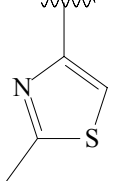
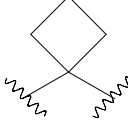
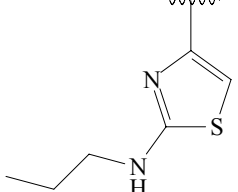
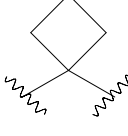
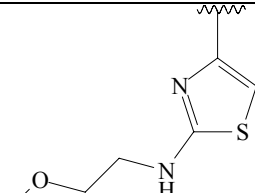
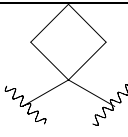
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6028	CH ₃			;
6029	CH ₃			;
6030	CH ₃			;
6031	CH ₃			;
6032	CH ₃			;
6033	CH ₃			;
6034	CH ₃			;

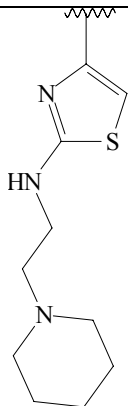
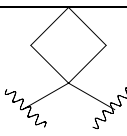
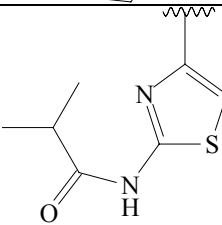
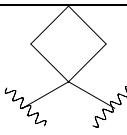
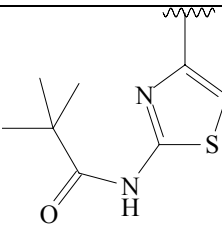
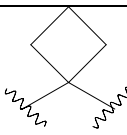
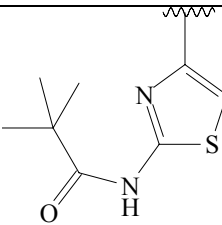
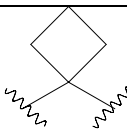
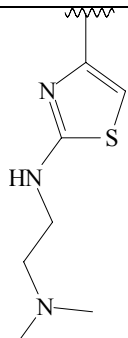
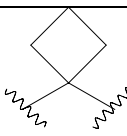
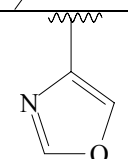
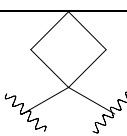
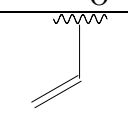
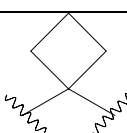
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6035	CH ₃			;
6036	CH ₃			;
6037	CH ₃			;
6038	CH ₃			;
6039	CH ₃			;
6040	CH ₃			;
6041	CH ₃			;
6042	CH ₃			;
6043	CH ₃			;

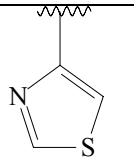
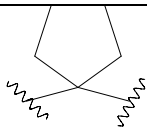
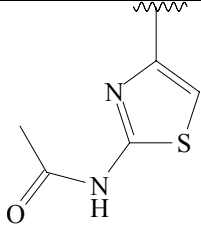
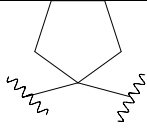
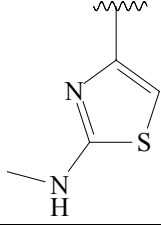
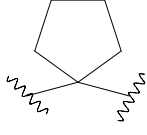
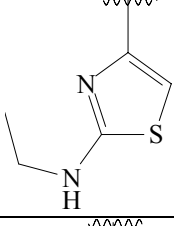
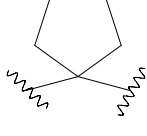
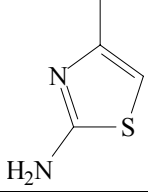
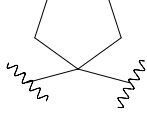
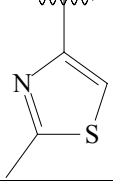
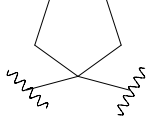
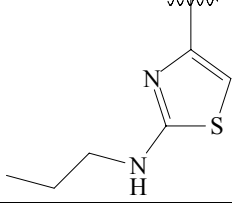
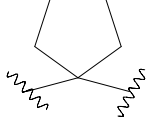
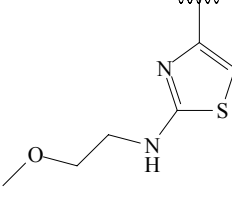
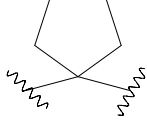
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6044	CH ₃			;
6045	CH ₃			;
6046	CH ₃			;
6047	CH ₃			;
6048	CH ₃			;
6049	CH ₃			;
6050	CH ₃			;
6051	CH ₃			;
6052	CH ₃			;

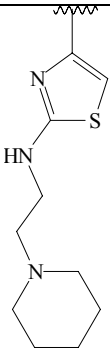
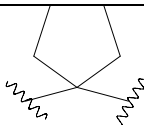
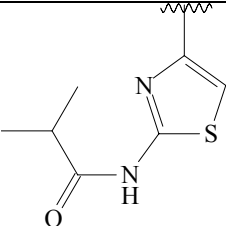
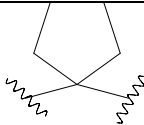
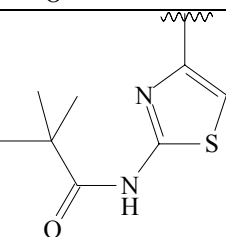
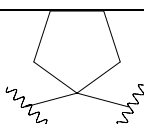
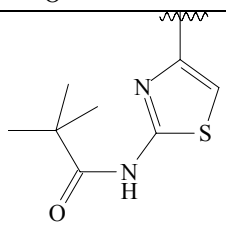
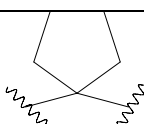
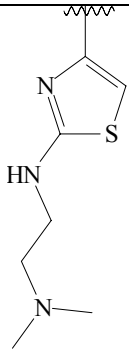
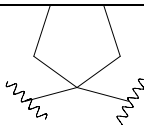
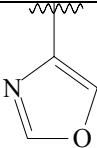
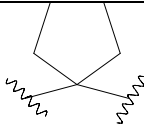
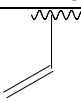
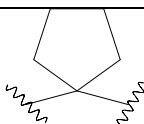
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6053	CH ₃			;
6054	CH ₃			;
6055	CH ₃			;
6056	CH ₃			;
6057	CH ₃			;
6058	CH ₃			;
6059	CH ₃			;
6060	CH ₃			;

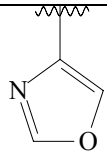
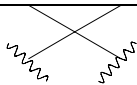
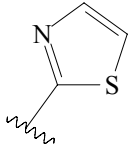
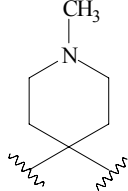
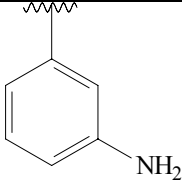
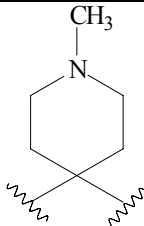
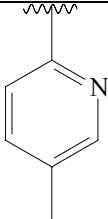
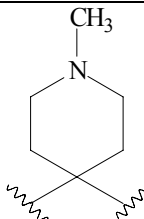
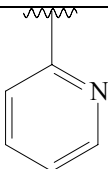
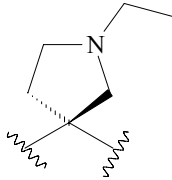
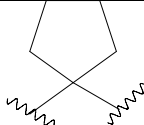
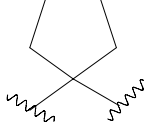
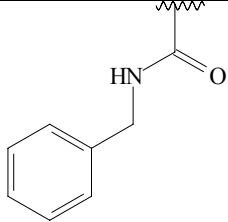
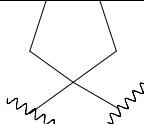
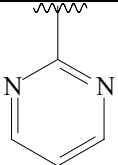
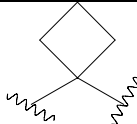
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6061	CH ₃			;
6062	CH ₃			;
6063	CH ₃			;
6064	CH ₃			;
6065	CH ₃			;
6066	CH ₃			;
6067	CH ₃			;
6068	CH ₃			;
6069	CH ₃			;

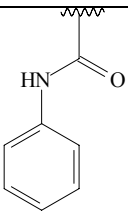
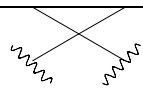
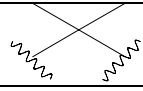
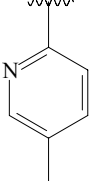
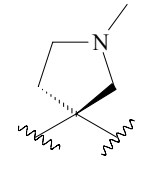
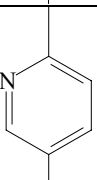
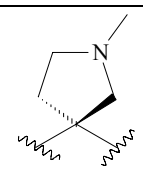
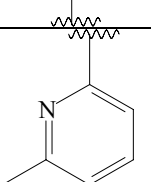
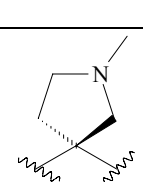
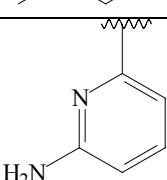
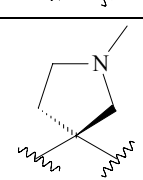
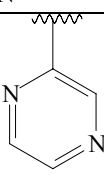
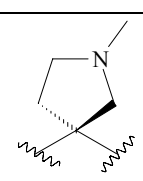
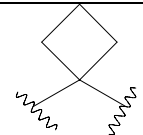
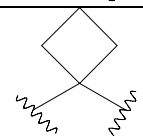
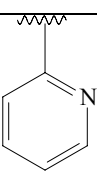
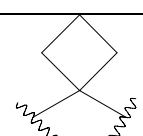
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6070	CH ₃			;
6071	CH ₃			;
6072	CH ₃			;
6073	CH ₃			;
6074	CH ₃			;
6075	CH ₃			;
6076	CH ₃			;
6077	CH ₃			;

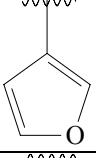
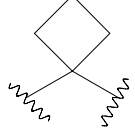
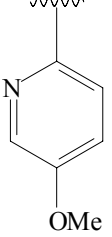
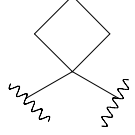
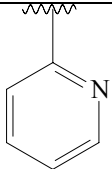
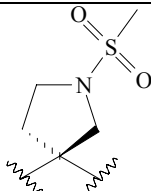
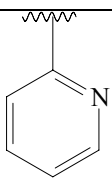
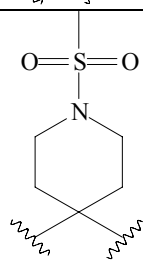
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6078	CH ₃			;
6079	CH ₃			;
6080	CH ₃			;
6081	CH ₃			;
6082	CH ₃			;
6083	CH ₃			;
6084	CH ₃			;

Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6085	CH ₃			;
6086	CH ₃			;
6087	CH ₃			;
6088	CH ₃			;
6089	CH ₃			;
6090	CH ₃			;
6091	CH ₃			;
6092	CH ₃			;

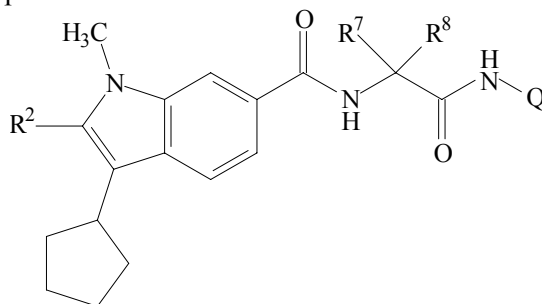
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6093	CH ₃			;
6094	CH ₃			;
6095	CH ₃			;
6096	CH ₃			;
6097	CH ₃			;
6098	CH ₃			;
6099	CH ₃			;

Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6100	CH ₃			;
6101	CH ₃			;
6102	CH ₃			;
6103	CH ₃			;
6105	CH ₃			;
6106	CH ₃	CONHCHH ₃		;
6107	CH ₃	CON(CH ₃) ₂		;
6110	CH ₃			;
6111	CH ₃			;

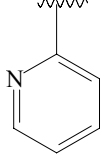
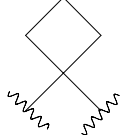
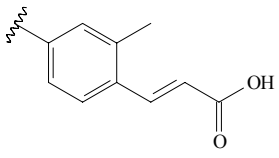
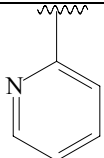
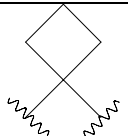
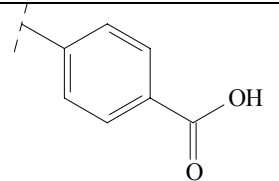
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6112	CH ₃			;
6113	CH ₃	CONH ₂		;
6114	CH ₃			;
6115	CH ₃			;
6116	CH ₃			;
6117	CH ₃			;
6118	CH ₃			;
6119	CH ₃	H		;
6120	CH ₃	Br		;
6121	H			;

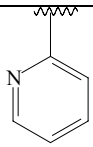
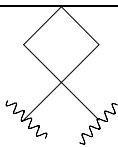
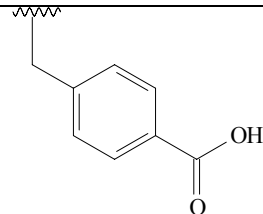
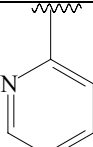
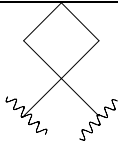
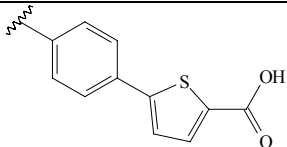
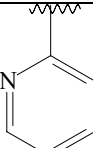
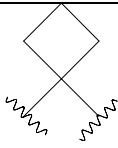
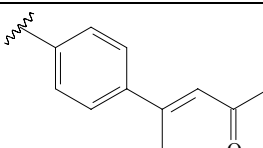
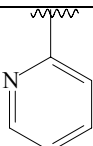
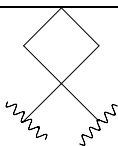
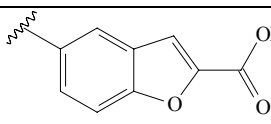
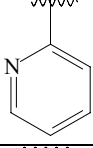
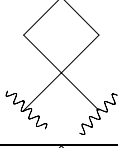
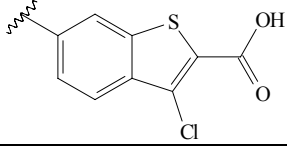
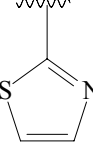
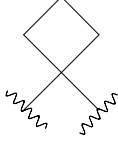
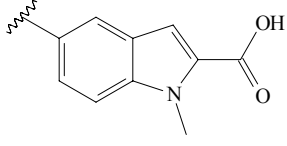
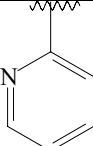
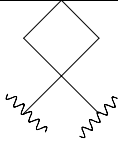
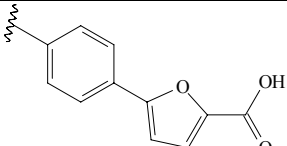
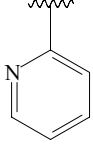
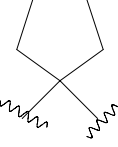
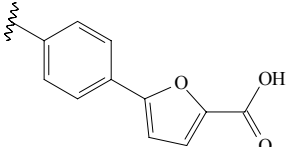
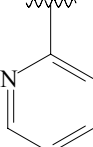
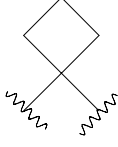
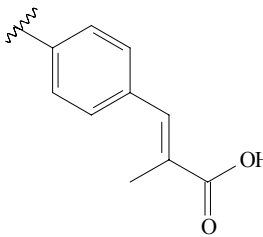
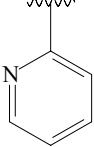
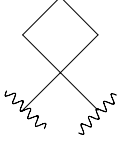
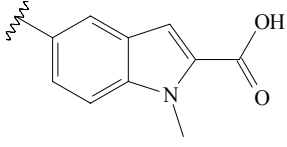
Бирикма №	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6122	CH ₃			;
6123	CH ₃			;
6124	CH ₃			; и
6125	CH ₃			.

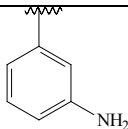
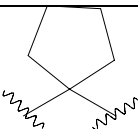
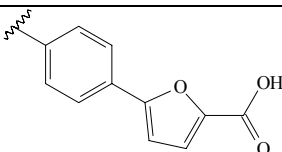
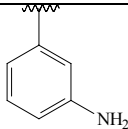
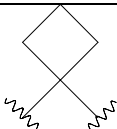
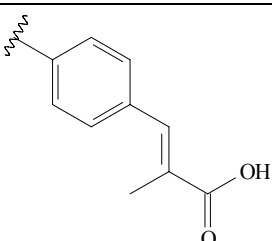
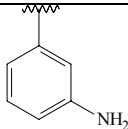
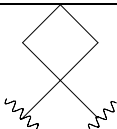
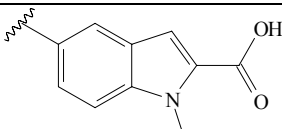
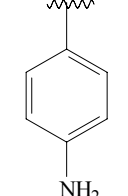
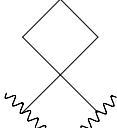
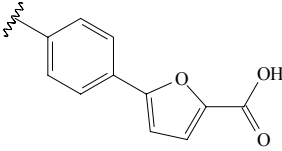
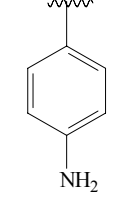
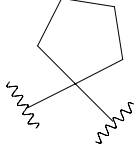
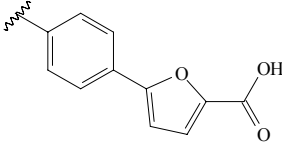
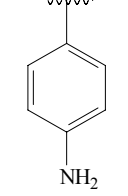
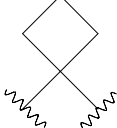
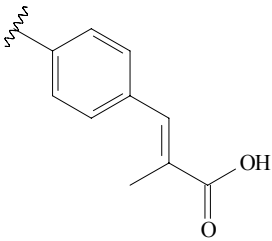
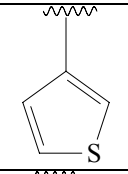
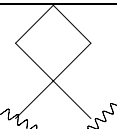
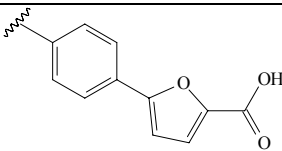
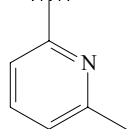
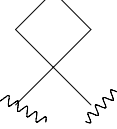
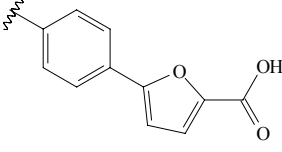
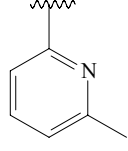
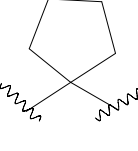
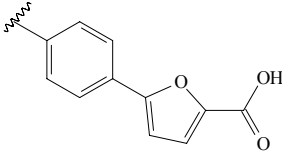
40. 1-банд бўйича формула бирикмаси:



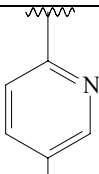
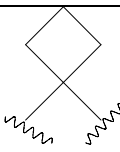
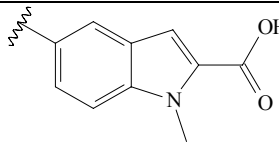
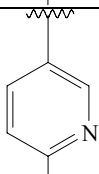
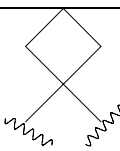
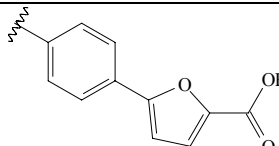
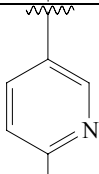
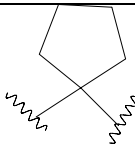
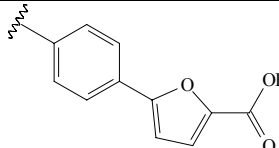
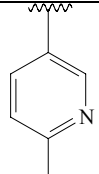
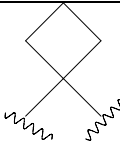
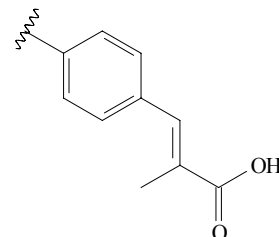
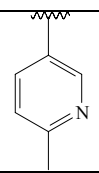
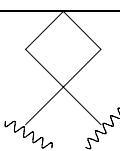
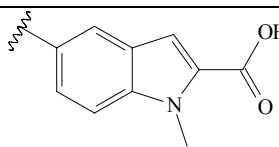
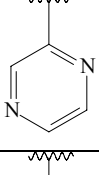
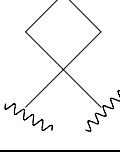
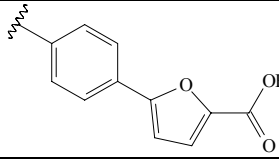
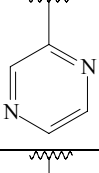
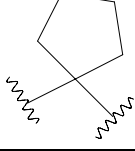
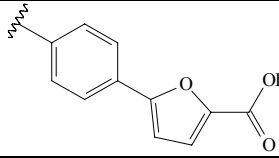
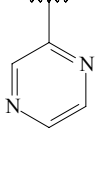
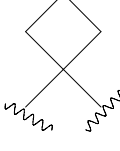
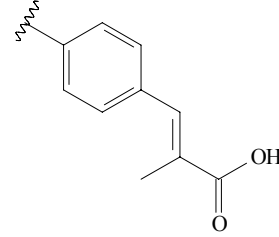
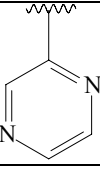
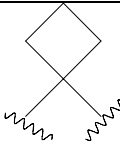
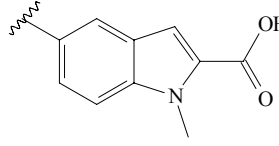
бунда R², R⁷, R⁸ ва Q қуйидагича аниқланади:

Бирикма рақами	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7001				;
7002				;

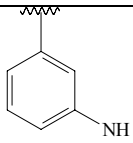
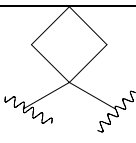
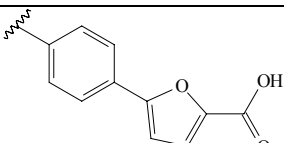
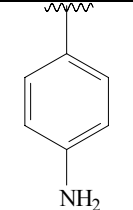
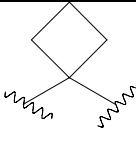
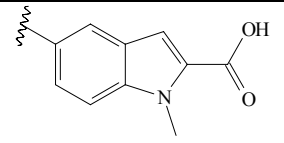
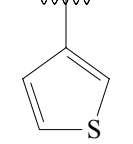
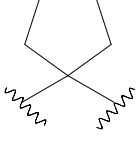
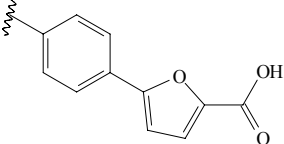
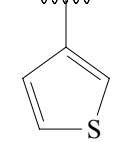
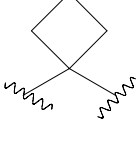
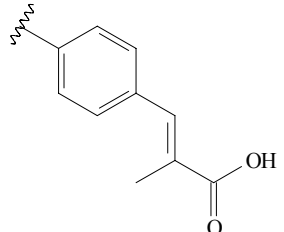
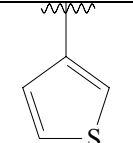
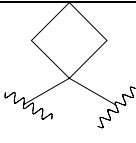
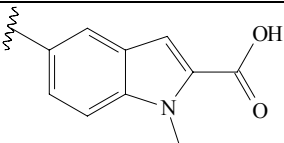
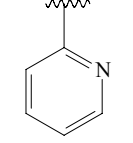
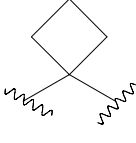
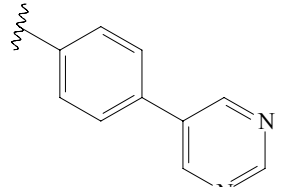
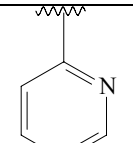
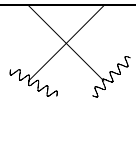
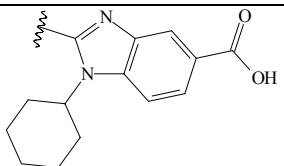
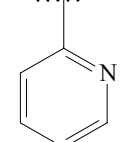
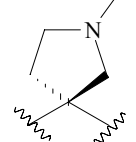
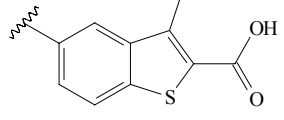
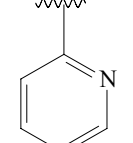
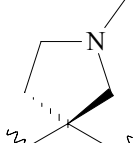
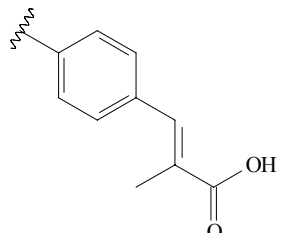
Бирикма рақами	R^2	R^7 R^8	Q	
7003				;
7004				;
7005				;
7006				;
7007				;
7008				;
7009				;
7010				;
7011				;
7012				;

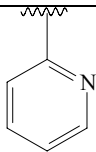
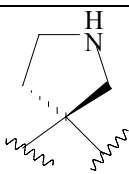
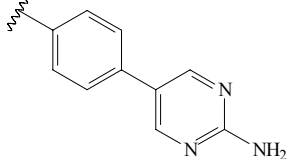
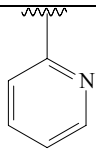
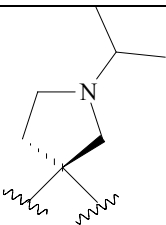
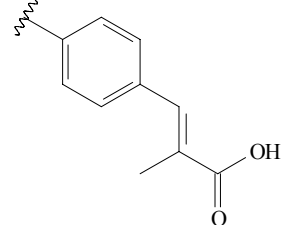
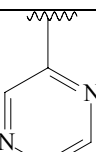
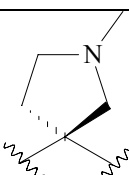
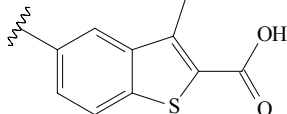
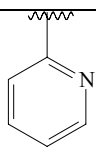
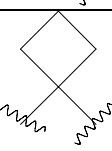
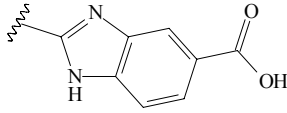
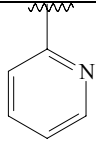
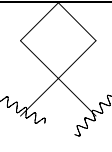
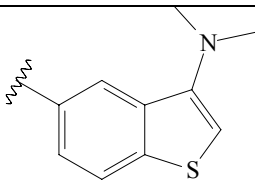
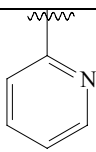
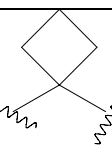
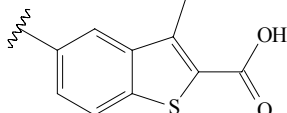
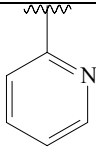
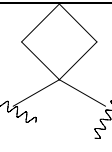
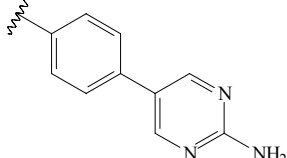
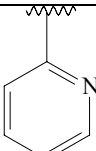
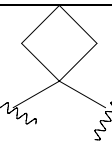
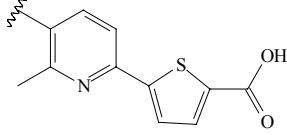
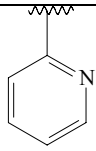
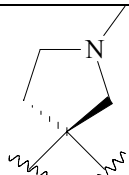
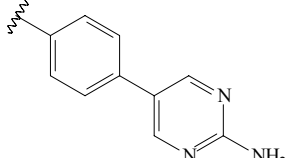
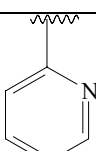
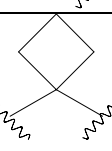
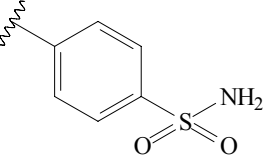
Бирикма рақами	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7013				;
7014				;
7015				;
7016				;
7017				;
7018				;
7019				;
7020				;
7021				;

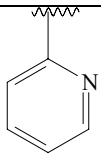
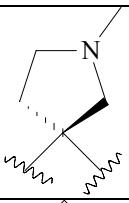
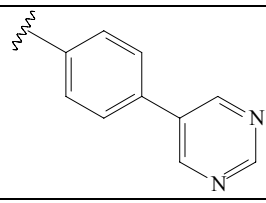
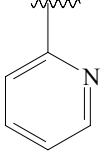
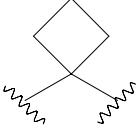
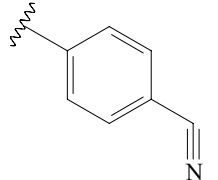
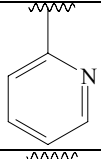
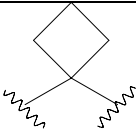
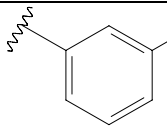
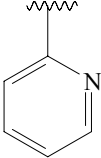
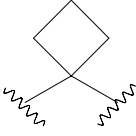
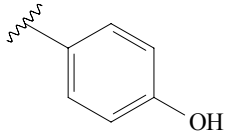
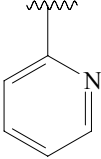
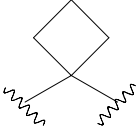
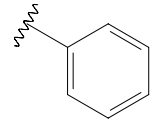
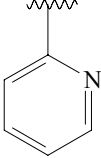
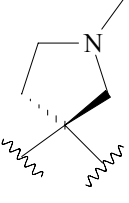
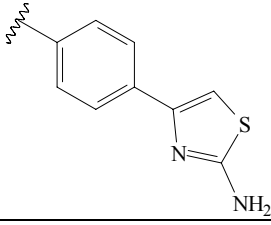
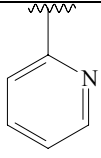
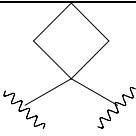
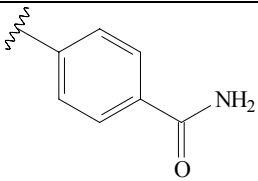
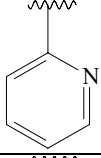
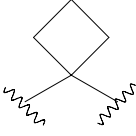
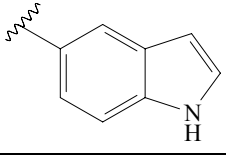
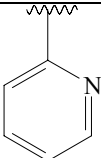
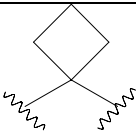
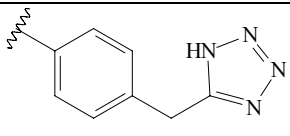
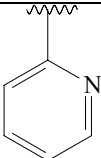
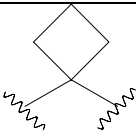
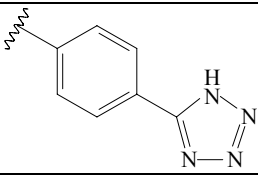
Бирикма рақами	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7022				;
7023				;
7024				;
7025				;
7026				;
7027				;
7028				;
7029				;
7030				;

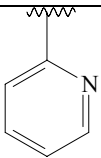
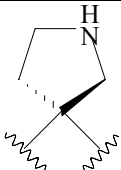
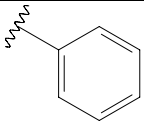
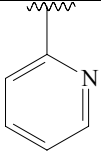
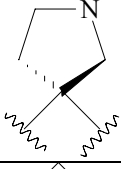
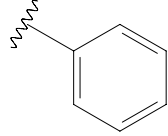
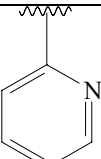
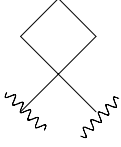
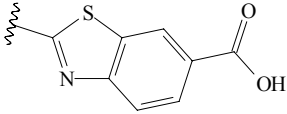
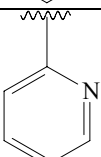
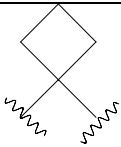
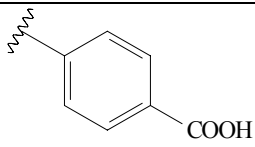
Бирикма рақами	R^2	R^7 R^8	Q	
7031				;
7032				;
7033				;
7034				;
7035				;
7036				;
7037				;
7038				;
7039				;

Бирикма рақами	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7040				;
7041				;
7042				;
7043				;
7044				;
7045				;
7046				;
7047				;
7048				;
7049				;

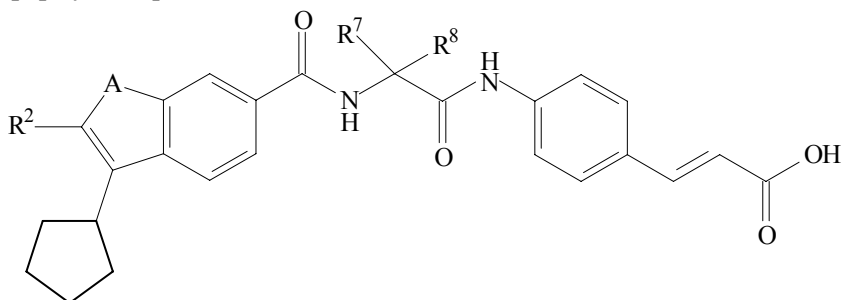
Бирикма рақами	R^2	R^7 R^8	Q	
7050				;
7051				;
7052				;
7053				;
7054				;
7055				;
7056				;
7057				;
7058				;

Бирикма рақами	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7059				;
7060				;
7061				;
7062				;
7063				;
7064				;
7065				;
7066				;
7067				;
7068				;

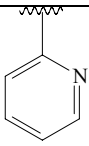
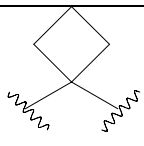
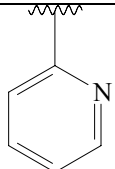
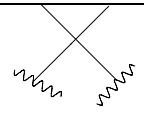
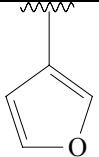
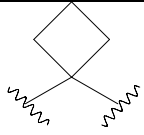
Бирикма раками	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7069				;
7070				;
7071				;
7072				;
7073				;
7075				;
7076				;
7077				;
7078				;
7079				;

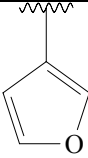
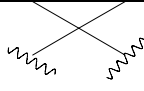
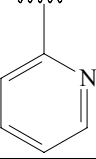
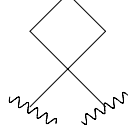
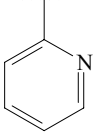
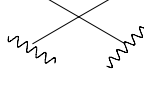
Бирикма рақами	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7080				;
7081				;
7082				; и
7083				.

41. 1-банд бўйича формула бирикмаси:

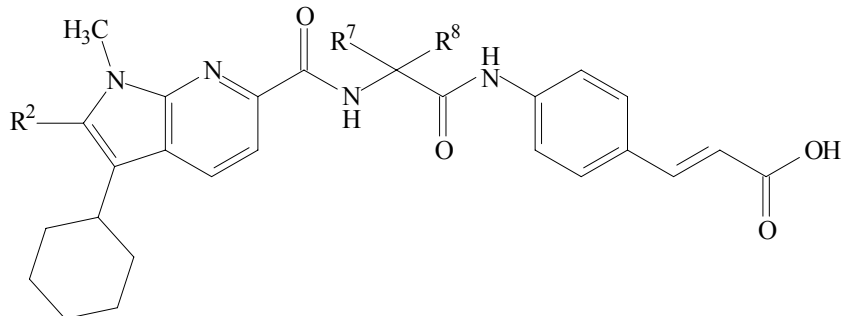


бунда A, R², R⁷ ва R⁸ қуйидагича аниқланади:

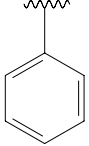
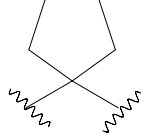
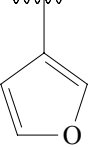
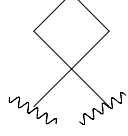
Бирикма №	A	R ²	R ⁷ R ⁸	
8001	S			;
8002	S			;
8003	S			;

Бирикма №	A	R ²	R ⁷ R ⁸	
8004	S			;
8005	O			; и
8006	O			.

42. 1-банд бўйича формула бирикмаси:



бунда R², R⁷ ва R⁸ қуйидагича аниқланади:

Бирикма №	R ²	R ⁷ R ⁸	
9001			; и
9002			.

43. 1-банд бўйича (I) формулани бирикма ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи С (HCV) гепатит вируси билан кодланган NS5B-ферменти РНК-боғлиқ РНК-полимераза фаоллиги ингибитори сифатида .

44. 1-банд бўйича (I) формулани бирикма ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузи С гепатит вируси репликацияси ингибитори сифатида.

45. Ўз ичига 1-банд бўйича (I) формулани бирикма ёки унинг фармацевтик мувофиқ тузининг самарали миқдорини ва фармацевтик мувофиқ

ташувчини олган С гепатит вируси репликациясини ингибирлан учун фармацевтик композиция.

46. 45-банд бўйича ўз ичига қўшимча равишда иммуномодуловчи агент олган композиция.

47. 46-банд бўйича композицияда ушбу иммуномодуловчи агентлар α-, β-, δ- γ- и ω-интерферонни ўз ичига олган гуруҳдан танланган.

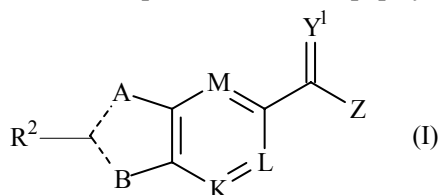
48. 45-банд бўйича ўз ичига қўшимча равишда бошқа вирусга қарши агент олган композиция.

49. 48-банд бўйича композицияда ушбу вирусга қарши агент рибавирин ва амантадиндан танланган.

50. 45-банд бўйича ўз ичига қўшимча равишда яна битта С гепатит вируси полимеразаси ингибиторини олган композиция.

51. 45-банд бўйича ўз ичига қўшимча равишда қуйидаги ингибиторларни олган композиция: С гепатит вируси хеликазаси, С гепатит вируси протеазаси, С гепатит вируси металлопротеазаси ёки HCV IRES (IRES *инглизчада. Internal Ribosome Entry Site* - рибосоманинг ички кириш сайти).

1. Изомер, энантиомер, диастереомер или таутомер соединения, представленного формулой (I)



в которой:

А представляет собой O, S, NR¹ или CR¹, где R¹ выбирают из группы, состоящей из H, (C₁₋₆)алкила,

- означает либо простую, либо двойную связь; R² выбирают из: галогена, R²¹, OR²¹, SR²¹, COOR²¹, SO₂N(R²²)₂, N(R²²)₂, CON(R²²)₂, NR²²C(O)R²² или NR²²C(O)NR²², где R²¹ и каждый R²² независимо представляют собой H, (C₁₋₆)алкил, галогеналкил, (C₂₋₆)алкенил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₂₋₆)алкинил, (C₅₋₇)циклоалкенил, 6- или 10-членный арил или Нет, причем указанные R²¹ и R²² необязательно замещены радикалом R²⁰;

или оба R²² ковалентно связаны друг с другом с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, с атомом азота, к которому они присоединены;

В представляет собой NR³ или CR³, при условии, что один из А или В означает либо CR¹, либо CR³,

где R³ выбирают из (C₃₋₇)циклоалкила и (C₅₋₇)циклоалкенила,

К представляет собой CR⁴, где R⁴ представляет собой H,

L означает CR⁵, где R⁵ имеет те же самые значения, что и R⁴,

определенный выше;

М означает N или CR⁷, где R⁷ имеет те же самые значения, что и R⁴, определенный выше;

Y¹ означает O или S;

Z означает N(R^{6a})R⁶, где R^{6a} означает H и

R⁶ представляет собой (C₃₋₆)циклоалкил, (C₂₋₆)алкенил, 6-членный арил, Нет, (C₁₋₆)алкил-арил, (C₁₋₆)алкил-Нет, где все указанные циклоалкил, алкенил, арил, Нет, алкил-арил, или алкил-Нет необязательно замещены радикалом R⁶⁰;

где R⁶⁰ означает:

- 1-4 заместителя, выбранных из группы включающей:

а) (C₁₋₆) алкил, C₃₋₇спироциклоалкил, необязательно содержащий 1 или 2 гетероатома или (C₂₋₆)алкенил, все указанные заместители необязательно замещены R¹⁵⁰;

в) OR¹⁰⁴, где R¹⁰⁴ означает H или (C₁₋₆)алкил, указанный алкил необязательно замещен R¹⁵⁰;

д) NR¹¹¹R¹¹², где R¹¹¹ означает H или (C₁₋₆)алкил, и R¹¹² означает (C₁₋₆)алкил или арил, указанные алкил и арил необязательно замещены R¹⁵⁰;

и) COR¹²⁷, где R¹²⁷ означает (C₁₋₆)алкил;

к) COOR¹²⁸, где R¹²⁸ означает H;

л) CONR¹²⁹R¹³⁰, где R¹²⁹ и R¹³⁰ независимо означают H, (C₁₋₆)алкил, арил или Нет, указанные алкил, арил и Нет, обязательно замещены R¹⁵⁰;

м) арил или Нет, все необязательно замещены R¹⁵⁰,

где R¹⁵⁰ означает:

-1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей:

а) (C₁₋₆)алкил или (C₂₋₆)алкенил, все необязательно замещены R¹⁶⁰;

д) NR¹¹¹R¹¹², где R¹¹¹ означает H и R¹¹² означает H;

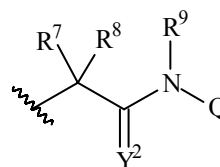
к) COOR¹²⁸, где R¹²⁸ означает H; и

л) CONR¹²⁹R¹³⁰, где R¹²⁹ и R¹³⁰ независимо означают H,

где R¹⁶⁰ означает 1 или 2 заместителя, выбранных из группы, включающей

COOR¹⁶¹ или CON(R¹⁶²)₂, где R¹⁶¹ и каждый R¹⁶² независимо означают H,

или Z представляет собой N(R^{6a})R⁶, где R^{6a} является таким, как определено выше, и R⁶ означает:



где R⁷ и R⁸ каждый независимо представляет собой H или (C₁₋₆)алкил, где указанный алкил необязательно замещен радикалом R⁷⁰; где R⁷⁰ означает

д) NR¹¹¹R¹¹², где R¹¹¹ означает H или (C₁₋₆)алкил и R¹¹² означает H или (C₁₋₆)алкил, или

R⁷ и R⁸ ковалентно связаны друг с другом с образованием второго (C₃₋₇)циклоалкила или 4-, 5- или 6-членного гетероцикла, содержащего гетероатом, который из выбирают из O, N и S;

Y² представляет собой O или S;

R⁹ представляет собой H или

R⁹ ковалентно связан либо с R⁷, либо с R⁸ с образованием 5- или 6-членного гетероцикла;

Q представляет собой 6- или 10-членный арил, Het или (C₁₋₆) алкил-арил, каждый из которых необязательно замещен радикалом R¹⁰⁰,

где R¹⁰⁰ означает

- один заместитель, выбранный из галогена или циано; или

- 1-4 заместителя, выбранных из группы, включающей:

а) (C₁₋₆) алкил, C₃₋₇циклоалкил, (C₂₋₆)алкенил или (C₂₋₈)алкинил, все указанные заместители необязательно замещены R¹⁵⁰;

в) OR¹⁰⁴, где R¹⁰⁴ означает H;

г) SO₂N(R¹⁰⁸)₂, где каждый R¹⁰⁸ независимо означает H;

д) NR¹¹¹R¹¹², где R¹¹¹ означает H или (C₁₋₆)алкил и R¹¹² означает (C₁₋₆)алкил;

е) NR¹¹⁶COR¹¹⁷, где R¹¹⁶ и R¹¹⁷ каждый означает H или (C₁₋₆)алкил,

з) NR¹²¹COCOR¹²², где R¹²¹ означает H и R¹²² означает OR¹²³ или N(R¹²⁴)₂, где

R¹²³ и каждый R¹²⁴ независимо означает H или (C₁₋₆)алкил или R¹²⁴ означает OH;

к) COOR¹²⁸, где R¹²⁸ означает H;

л) CONR¹²⁹R¹³⁰, где R¹²⁹ и R¹³⁰ независимо означают H;

м) Het необязательно замещены R¹⁵⁰,

где R¹⁵⁰ означает :

- 1 заместитель, выбранный из циано или

- 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей:

д) NR¹¹¹R¹¹², где R¹¹¹ означает H и R¹¹² означает H;

и) COOR¹²⁷, где R¹²⁷ означает (C₁₋₆)алкил;

к) тетразол или COOR¹²⁸, где R¹²⁸ означает H,

л) COOR¹²⁹R¹³⁰, где R¹²⁹ и R¹³⁰ независимо означают H,

или его соли, его производные;

где Het означает 5- или 6-членный гетероцикл, содержащий 1-4 гетероатома, которые выбирают из O, N и S или -9 или 10-членный гетеробифидел, содержащий 1-5 гетероатомов, выбранных из O, N и S, а каждый из R²⁰ определяют как:

- 1-4 заместителя, которые выбирают из: галогена, OPO₃H, NO₂, циано, азидо, C(=NH)NH₂, C(=NH)NH(C₁₋₆)алкила или C(=NH)NHCO(C₁₋₆)алкила; или

- 1-4 заместителя, которые выбирают из:

а) (C₁₋₆)алкила или галогеналкила, (C₃₋₇)циклоалкила, C₃₋₇спироциклоалкила, необязательно содержащего 1 или 2 гетероатома, (C₂₋₆)алкенила, (C₂₋₈)алкинила, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкила, каждый из которых необязательно замещен радикалом R¹⁵⁰;

б) OR¹⁰⁴, где R¹⁰⁴ представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил или (C₁₋₆)ал-

кил)Het, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил или (C₁₋₆)алкил)Het необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

в) OCOR¹⁰⁵, где R¹⁰⁵ представляет собой (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, Het, (C₁₋₆)алкиларил или (C₁₋₆)алкил)Het, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил или (C₁₋₆)алкил)Het необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

г) SR¹⁰⁸, SO₂N(R¹⁰⁸)₂ или SO₂N(R¹⁰⁸)C(O)R¹⁰⁸, где каждый R¹⁰⁸ независимо представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил или (C₁₋₆)алкил)Het, или оба R¹⁰⁸ ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил или (C₁₋₆)алкил)Het или гетероцикл необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

д) NR¹¹¹R¹¹², где R¹¹¹ представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил или (C₁₋₆)алкил)Het, и R¹¹² представляет собой H, CN, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил, (C₁₋₆)алкил)Het, COOR¹¹⁵ или SO₂R¹¹⁵, в которых R¹¹⁵ представляет собой (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил или (C₁₋₆)алкил)Het, или оба R¹¹¹ и R¹¹² ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил или (C₁₋₆)алкил)Het или гетероцикл необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

е) NR¹¹⁶COR¹¹⁷, где R¹¹⁶ и R¹¹⁷ каждый представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил или (C₁₋₆)алкил)Het, причем указанные (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил или (C₁₋₆)алкил)Het необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

ж) NR¹¹⁸CONR¹¹⁹R¹²⁰, где R¹¹⁸, R¹¹⁹ и R¹²⁰ каждый представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆)алкиларил или (C₁₋₆)алкил)Het, или R¹¹⁸ ковалентно связан с радикалом R¹¹⁹ и с атомом азота, к которому они присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла; или R¹¹⁹ и R¹²⁰ ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла;

указанные алкил, циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)-циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het или гетероцикл необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

з) NR¹²¹COCOR¹²², где R¹²¹ и R¹²² каждый представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, 6- или 10-членный арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, причем указанные алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

или R¹²² представляет собой OR¹²³ или N(R¹²⁴)₂, где R¹²³ и каждый R¹²⁴ независимо представляют собой H, (C₁₋₆алкил), (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, или R¹²⁴ представляет собой OH или O(C₁₋₆алкил) или оба R¹²⁴ ковалентно связаны друг с другом с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het и гетероцикл необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

и) COR¹²⁷, где R¹²⁷ представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

к) COOR¹²⁸, где R¹²⁸ представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, причем указанные (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил и (C₁₋₆алкил)Het необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

л) CONR¹²⁹R¹³⁰, где R¹²⁹ и R¹³⁰ независимо представляют собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, или оба R¹²⁹ и R¹³⁰ ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил, (C₁₋₆алкил)Het и гетероцикл необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

м) арила, Het, (C₁₋₆алкил)арила или (C₁₋₆алкил)-Het, каждый из которых необязательно замещен радикалом R¹⁵⁰, где R¹⁵⁰ определяют как:

- 1-3 заместителя, которые выбирают из: галогена, OPO₃H, NO₂, циано, азидо, C(=NH)NH₂, C(=NH)NH(C₁₋₆) алкил или

C(=NH)NHCO(C₁₋₆) алкил; или

- 1-3 заместителя, которые выбирают из:

а) (C₁₋₆) алкила или галогеналкила, (C₃₋₇)циклоалкила, C₃₋₇спироциклоалкила, необязательно содержащего 1 или 2 гетероатома, (C₂₋₆)алкенила, (C₂₋₈)алкинила, (C₁₋₆) алкил-(C₃₋₇)циклоалкила, каждый из которых необязательно замещен радикалом R¹⁶⁰;

б) OR¹⁰⁴, где R¹⁰⁴ представляет собой H, (C₁₋₆алкил), (C₃₋₇)циклоалкил, или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰;

в) OCOR¹⁰⁵, где R¹⁰⁵ представляет собой (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰;

г) SR¹⁰⁸, SO₂N(R¹⁰⁸)₂ или SO₂N(R¹⁰⁸)C(O)R¹⁰⁸, где каждый R¹⁰⁸ независимо представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, или оба R¹⁰⁸ ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het или гетероцикл необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰;

д) NR¹¹¹R¹¹², где R¹¹¹ представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, и R¹¹² представляет собой H, CN, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил, (C₁₋₆алкил)Het, COOR¹¹⁵ или SO₂R¹¹⁵, где R¹¹⁵ представляет собой (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, или оба R¹¹¹ и R¹¹² ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, или гетероцикл необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰;

е) NR¹¹⁶COR¹¹⁷, где R¹¹⁶ и R¹¹⁷ каждый представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, причем указанные (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰;

ж) NR¹¹⁸CONR¹¹⁹R¹²⁰, где R¹¹⁸, R¹¹⁹ и R¹²⁰ каждый представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоал-

кил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het или R¹¹⁸ ковалентно присоединен к радикалу R¹¹⁹ и к атому азота, к которому они присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, или R¹¹⁹ и R¹²⁰ ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het или гетероцикл необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰.

з) NR¹²¹COCOR¹²², где R¹²¹ и R¹²² каждый представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, 6- или 10-членный арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, причем указанные алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het необязательно замещены R¹⁶⁰, или R¹²² представляет собой OR¹²³ или N(R¹²⁴)₂, где R¹²³ и каждый R¹²⁴ независимо представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, или R¹²⁴ представляет собой OH или O(C₁₋₆алкил) или оба R¹²⁴ ковалентно связаны друг с другом с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰,

и) COR¹²⁷, где R¹²⁷ представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰;

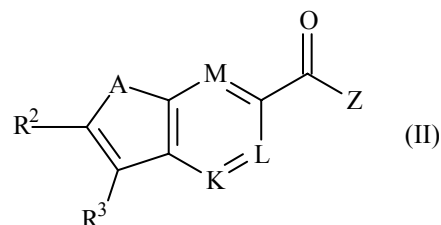
к) тетразола, COOR¹²⁸, где R¹²⁸ представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, причем указанные (C₁₋₆) алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил и (C₁₋₆алкил)Het необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰; и

л) CONR¹²⁹R¹³⁰, где R¹²⁹ и R¹³⁰ независимо представляют собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, или оба R¹²⁹ и R¹³⁰ ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆

алкил)арил, (C₁₋₆алкил)Het и гетероцикл необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰; и где R¹⁶⁰ определяют как 1 или 2 заместителя, которые выбирают из заместителей:

тетразол, галоген, CN, C₁₋₆алкил, галогеналкил, COOR¹⁶¹, SO₃H, SR¹⁶¹, SO₂R¹⁶¹, OR¹⁶¹, N(R¹⁶²)₂, SO₂N(R¹⁶²)₂, NR¹⁶²COR¹⁶² или CON(R¹⁶²)₂, где R¹⁶¹ и каждый R¹⁶² независимо представляют собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆) алкил-(C₃₋₇)циклоалкил; или оба R¹⁶² ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, или его соль.

2. Соединение по п.1 формулы (II):

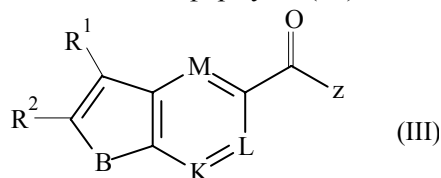


в которой А означает О, S или NR¹, и R¹, R², R³, К, L, М и Z являются такими, как определено в п. 1.

3. Соединение по п. 2, в котором А означает NR¹.

4. Соединение по п. 3, в котором М, К и L означают СН.

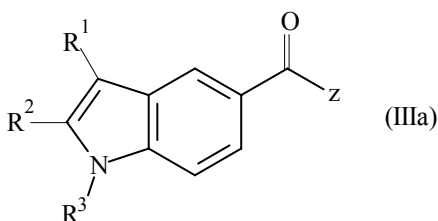
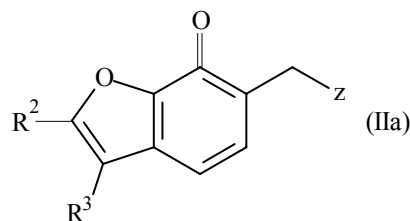
5. Соединение по п.1 формулы (III):

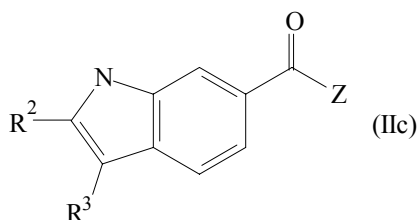
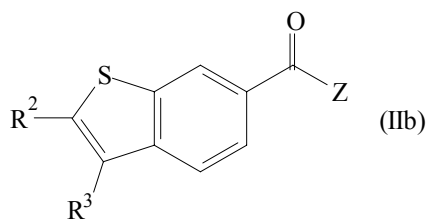


в которой В означает NR³, и R¹, R², R³, К, L, М и Z являются такими, как определено в п. 1.

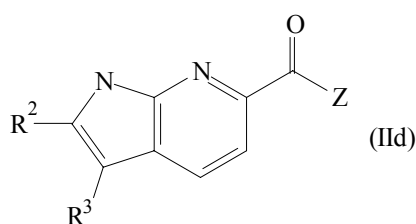
6. Соединение по п. 5, в котором М, К и L означают СН.

7. Соединение по п.1. формул: (IIa), (IIIa), (IIb), (IIc) или IIд





или



в которой R^1 , R^2 , R^3 и Z являются такими, как определено в п. 1.

8. Соединение по п. 1, в котором R^1 означает H, CH_3 , изопропил или изобутил.

9. Соединение по п. 8, в котором R^1 означает H, CH_3 .

10. Соединение по п. 9, в котором R^1 означает CH_3 .

11. Соединение по п. 1, в котором R^2 означает $\text{CON}(\text{R}^{22})_2$, где каждый R^{22} независимо представляет собой H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{5-7}) циклоалкенил, 6 или 10-членный арил или Het, или оба R^{22} связаны друг с другом с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла с атомом азота, к которому они присоединены; или R^2 выбирают из: H, галогена, (C_{1-6}) алкила, галогеналкила, (C_{2-6}) алкенила, (C_{5-7}) циклоалкенила, 6- или 10-членного арила или Het; где каждый указанный алкил, галогеналкил, (C_{2-6}) алкенил, (C_{5-7}) циклоалкенил, арил или Het необязательно замещены радикалом R^{20} , где R^{20} определяют следующим образом:

- 1-4 заместителя, которые выбирают из: галогена, NO_2 , циано, азидо, $\text{C}(\text{=NH})\text{NH}_2$, $\text{C}(\text{=NH})\text{NH}(\text{C}_{1-6})$ алкила или $\text{C}(\text{=NH})\text{NHCO}(\text{C}_{1-6})$ алкила; или 1-4 заместителя, которые выбирают из следующих заместителей:

а) (C_{1-6}) алкил или галогеналкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{2-6}) алкенил, (C_{2-8}) алкинил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, каждый из которых необязательно замещен радикалом R^{150} ;

б) OR^{104} , где R^{104} представляет собой H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, или (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил или (C_{1-6}) алкил)Het, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил или (C_{1-6}) алкил)Het необязательно замещены радикалом R^{150} ;

в) OCOR^{105} , где R^{105} представляет собой (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, Het, (C_{1-6}) алкиларил или (C_{1-6}) алкил)Het, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил или (C_{1-6}) алкил)Het необязательно замещены радикалом R^{150} ;

г) SR^{108} , $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{108})_2$ или $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{108})\text{C}(\text{O})\text{R}^{108}$, где каждый R^{108} независимо представляет собой H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил или (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил или (C_{1-6}) алкил)Het, или оба R^{108} ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил или (C_{1-6}) алкил)Het, или гетероцикл необязательно замещены радикалом R^{150} ;

д) $\text{NR}^{111}\text{R}^{112}$, где R^{111} представляет собой H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил или (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил или (C_{1-6}) алкил)Het, и R^{112} представляет собой H, CN, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил или (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил, (C_{1-6}) алкил)Het, COOR^{115} или $\text{SO}_2\text{R}^{115}$, где R^{115} представляет собой (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, или (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил или (C_{1-6}) алкил)Het, или оба R^{111} и R^{112} ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил или (C_{1-6}) алкил)Het, или гетероцикл необязательно замещены радикалом R^{150} ;

е) $\text{NR}^{116}\text{COR}^{117}$, где R^{116} и R^{117} каждый представляет собой H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил или (C_{1-6}) алкил)Het, причем указанные (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил или (C_{1-6}) алкил)Het необязательно замещены радикалом R^{150} ;

ж) $\text{NR}^{118}\text{CONR}^{119}\text{R}^{120}$, где R^{118} , R^{119} и R^{120} каждый представляет собой H, (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{1-6}) алкил- (C_{3-7}) циклоалкил, арил, Het, (C_{1-6}) алкиларил или (C_{1-6}) алкил)Het, или R^{118} ковалентно связан с радикалом R^{119} и с атомом азота, к которому они присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла; или R^{119} и R^{120} ковалентно связаны

друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла; указанные алкил, циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, или гетероцикл необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

з) NR¹²¹COCOR¹²², где R¹²¹ и R¹²² каждый представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, 6- или 10-членный арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, причем указанные алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

или R¹²² представляет собой OR¹²³ или N(R¹²⁴)₂, где R¹²³ и каждый R¹²⁴ независимо представляют собой H, (C₁₋₆алкил), (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, или R¹²⁴ представляет собой OH или O(C₁₋₆алкил), или оба R¹²⁴ ковалентно связаны друг с другом с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het и гетероцикл необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

и) COR¹²⁷, где R¹²⁷ представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

к) COOR¹²⁸, где R¹²⁸ представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, причем указанные (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил и (C₁₋₆алкил)Het необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

л) CONR¹²⁹R¹³⁰, где R¹²⁹ и R¹³⁰ независимо представляют собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, или оба R¹²⁹ и R¹³⁰ ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил, алкил-циклоалкил, арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил, (C₁₋₆алкил)Het и гетероцикл необязательно замещены радикалом R¹⁵⁰;

м) арил, Het, (C₁₋₆алкил)арил или (C₁₋₆алкил)Het, каждый из которых необязательно замещен радикалом R¹⁵⁰, где R¹⁵⁰ представляет собой:

- 1-3 заместителя, которые выбирают из галогена, NO₂, циано или азидо; или

- 1-3 заместителя, которые выбирают из следующих заместителей:

а) (C₁₋₆) алкил или галогеналкил, (C₃₋₇)циклоалкил, (C₂₋₆)алкенил, (C₂₋₈)алкинил, (C₁₋₆) алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, каждый из которых необязательно замещен радикалом R¹⁶⁰;

б) OR¹⁰⁴, где R¹⁰⁴ представляет собой H, (C₁₋₆алкил) или (C₃₋₇)циклоалкил, причем указанные алкил или циклоалкил необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰;

г) SR¹⁰⁸, SO₃H, SO₂N(R¹⁰⁸)₂ или SO₂N(R¹⁰⁸)C(O)R¹⁰⁸, где каждый R¹⁰⁸ независимо представляет собой H, (C₁₋₆)алкил, (C₃₋₇)циклоалкил или (C₁₋₆)алкил-(C₃₋₇)циклоалкил, арил, Het, или оба R¹⁰⁸ ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил, арил, Het и гетероцикл необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰;

д) NR¹¹¹R¹¹², где R¹¹¹ представляет собой H, (C₁₋₆)алкил или (C₃₋₇)циклоалкил, а R¹¹² представляет собой H, (C₁₋₆)алкил или (C₃₋₇)циклоалкил, COOR¹¹⁵ или SO₂R¹¹⁵, где R¹¹⁵ представляет собой (C₁₋₆)алкил или (C₃₋₇)циклоалкил, или оба R¹¹¹ и R¹¹² ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил и гетероцикл необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰;

е) NR¹¹⁶COR¹¹⁷, где R¹¹⁶ и R¹¹⁷ каждый представляет собой H, (C₁₋₆)алкил или (C₃₋₇)циклоалкил, причем указанные (C₁₋₆)алкил и (C₃₋₇)циклоалкил необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰;

ж) NR¹¹⁸CONR¹¹⁹R¹²⁰, где R¹¹⁸, R¹¹⁹ и R¹²⁰ каждый представляет собой H, (C₁₋₆)алкил или (C₃₋₇)циклоалкил, или R¹¹⁸ ковалентно связан с радикалом R¹¹⁹ и с атомом азота, к которому они присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, или R¹¹⁹ и R¹²⁰ ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил и гетероцикл необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰;

з) NR¹²¹COCOR¹²², где R¹²¹ представляет собой H, (C₁₋₆)алкил или (C₃₋₇)циклоалкил, причем указанные алкил и циклоалкил необязательно замещены радикалом R¹⁶⁰;

или R¹²² означает OR¹²³ или N(R¹²⁴)₂, где R¹²³ и каждый R¹²⁴ независимо представляет собой H, (C₁₋₆алкил) или (C₃₋₇)циклоалкил, или оба R¹²⁴ ковалентно связаны друг с другом с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщен-

ного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил и гетероцикл необязательно замещены радикалом R^{160} ;

и) COR^{127} , где R^{127} представляет собой H, (C_{1-6}) -алкил или (C_{3-7}) -циклоалкил, причем указанные алкил и циклоалкил необязательно замещены радикалом R^{160} ;

к) $COOR^{128}$, где R^{128} представляет собой H, (C_{1-6}) -алкил или (C_{3-7}) -циклоалкил, причем указанные (C_{1-6}) -алкил и (C_{3-7}) -циклоалкил необязательно замещены радикалом R^{160} ; и

л) $CONR^{129}R^{130}$, где R^{129} и R^{130} независимо представляют собой H, (C_{1-6}) -алкил или (C_{3-7}) -циклоалкил, или оба R^{129} и R^{130} ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла, причем указанные алкил, циклоалкил и гетероцикл необязательно замещены радикалом R^{160} ;

где R^{160} определяют как 1 или 2 заместителя, которые выбирают из галогена, CN, C_{1-6} -алкила, галогеналкила, $COOR^{161}$, OR^{161} , $N(R^{162})_2$, $SO_2N(R^{162})_2$, $NR^{162}COR^{162}$ или $CON(R^{162})_2$, где R^{161} и каждый R^{162} независимо представляют собой H, (C_{1-6}) -алкил, (C_{3-7}) -циклоалкил или (C_{1-6}) -алкил- (C_{3-7}) -циклоалкил; или оба R^{162} ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом 5-, 6- или 7-членного насыщенного гетероцикла.

12. Соединение по п. 11, в котором R^2 выбирают из арила или Het, каждый из которых необязательно монозамещен или дизамещен заместителями, которые выбирают из группы, состоящей из галогена, галогеналкила, N_3 или

а) (C_{1-6}) -алкила, необязательно замещенного OH или $O(C_{1-6})$ -алкилом;

б) (C_{1-6}) -алкокси; и

д) $NR^{111}R^{112}$, где оба R^{111} и R^{112} независимо представляют собой H, (C_{1-6}) -алкил, (C_{3-7}) -циклоалкил, или R^{112} представляет собой 6- или 10-членный арил, Het, (C_{1-6}) -алкил-арил или (C_{1-6}) -алкил-Het; или оба R^{111} и R^{112} ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом азотсодержащего гетероцикла, каждый из указанных алкила, циклоалкила, арила, Het, алкил-арила или алкил-Het необязательно замещен радикалом галогена или:

- OR^{2h} или $N(R^{2h})_2$, где каждый R^{2h} независимо представляет собой H, (C_{1-6}) -алкил, или оба R^{2h} ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с обра-

зованием при этом азотсодержащего гетероцикла;

е) $NHCOR^{117}$, где R^{117} представляет собой (C_{1-6}) -алкил;

и) CO-арил; и

л) $CONH_2$, $CONH(C_{1-6})$ -алкил, $CON(C_{1-6})$ -алкил) $_2$, CONH-арил, или $CONHC_{1-6}$ -алкил-арил.

13. Соединение по п. 12, где R^2 представляет собой арил или Het, каждый из которых необязательно монозамещен или дизамещен заместителями, выбранными из группы, состоящей из следующих заместителей: галоген, галогеналкил, или

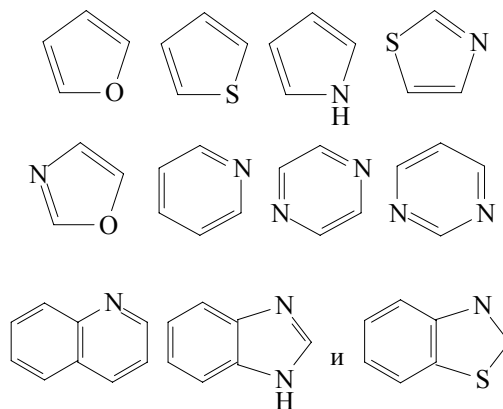
а) (C_{1-6}) -алкил, необязательно замещенный группой OH или $O(C_{1-6})$ -алкил;

б) (C_{1-6}) -алкокси; и

д) $NR^{111}R^{112}$, где оба R^{111} и R^{112} независимо представляют собой H, (C_{1-6}) -алкил, (C_{3-7}) -циклоалкил, или R^{112} представляет собой 6- или 10-членный арил, Het, (C_{1-6}) -алкил-арил или (C_{1-6}) -алкил-Het; или оба R^{111} и R^{112} ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом азотсодержащего гетероцикла, причем каждый указанный алкил, циклоалкил, арил, Het, алкил-арил или алкил-Het необязательно замещен галогеном или:

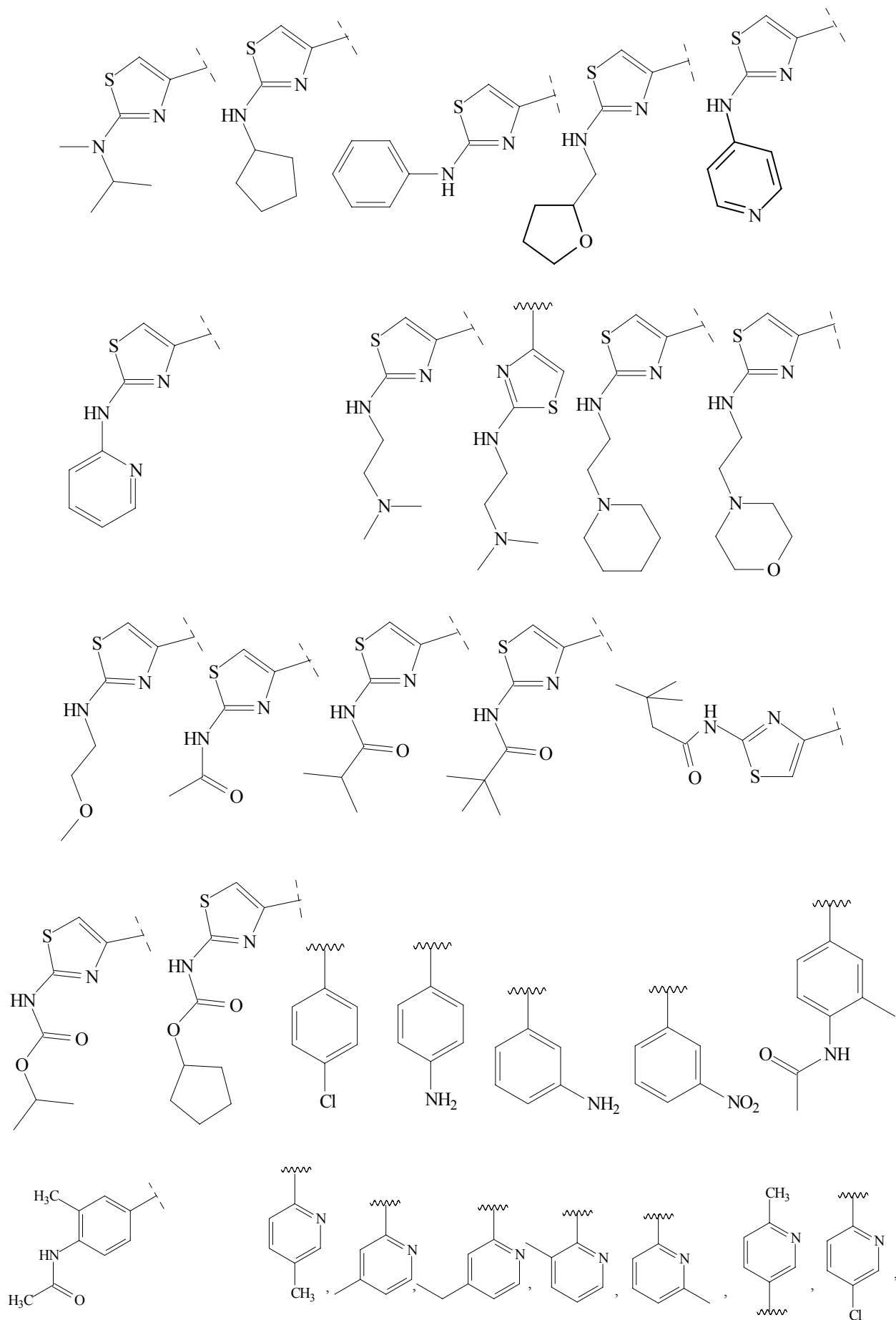
- OR^{2h} или $N(R^{2h})_2$, где каждый R^{2h} независимо представляет собой H, (C_{1-6}) -алкил, или оба R^{2h} ковалентно связаны друг с другом и с атомом азота, к которому они оба присоединены, с образованием при этом азотсодержащего гетероцикла.

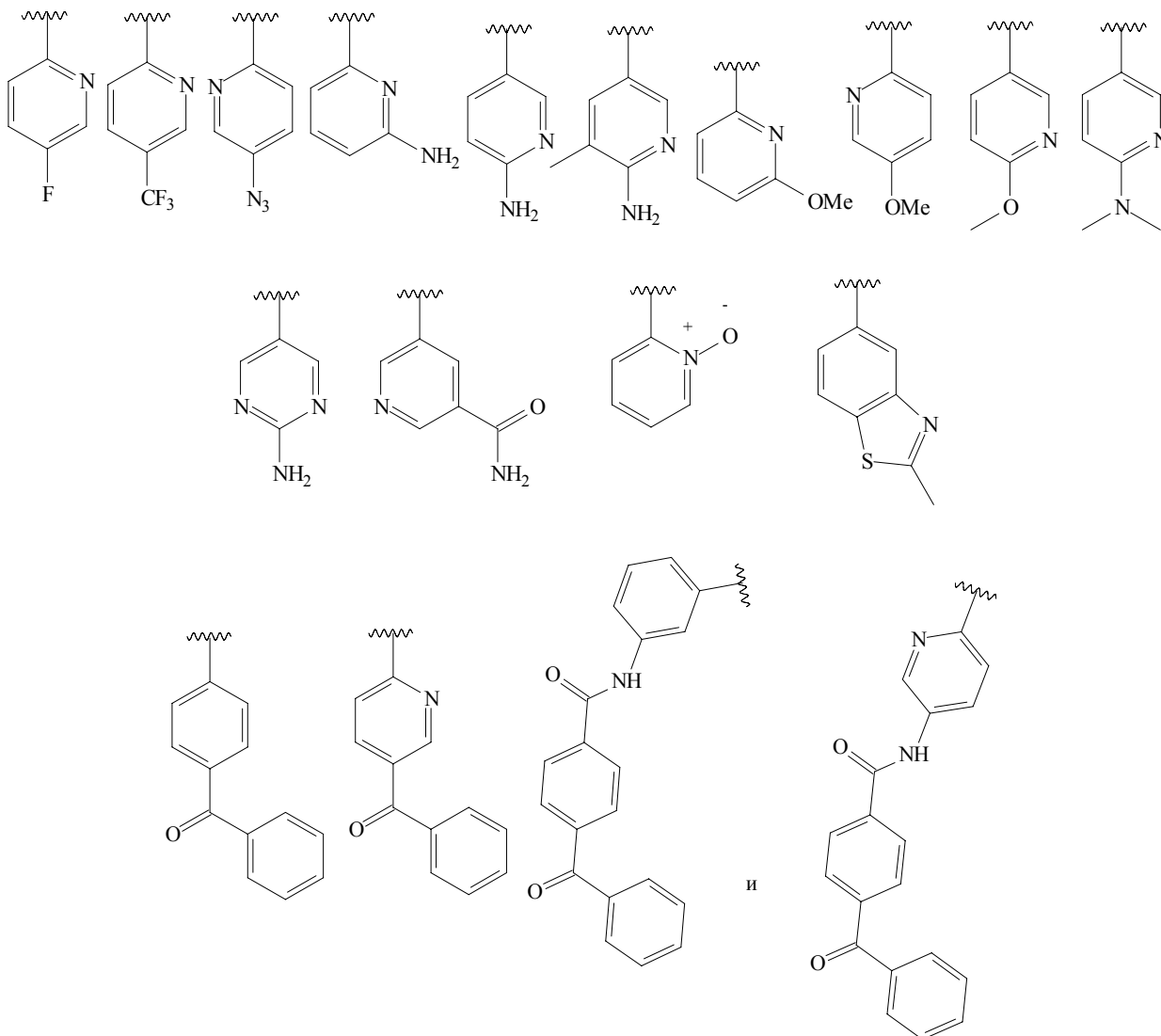
14. Соединение по п. 13, в котором R^2 означает фенил или гетероцикл, выбранный из:



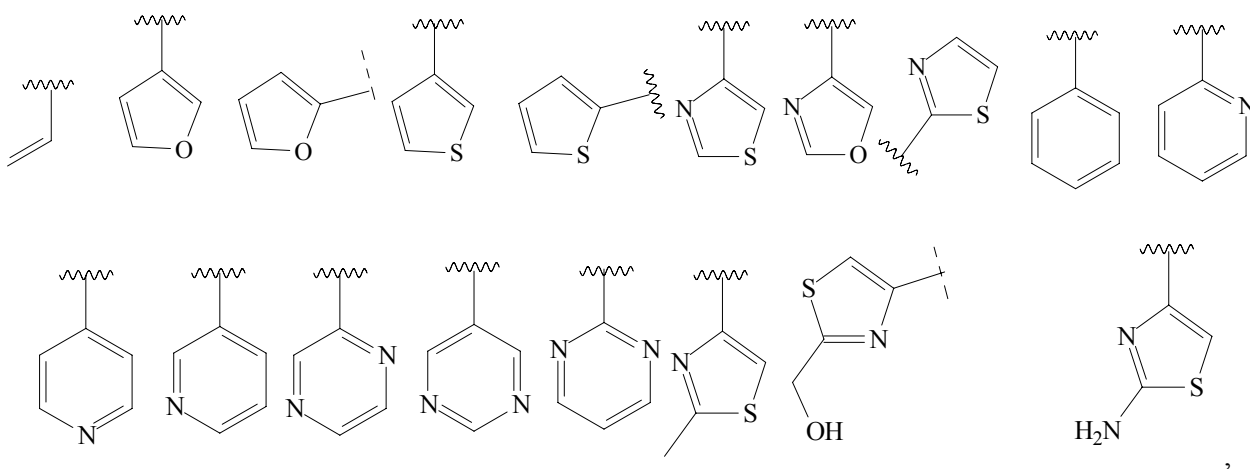
каждый из которых необязательно замещен таким образом, как определено в п. 13.

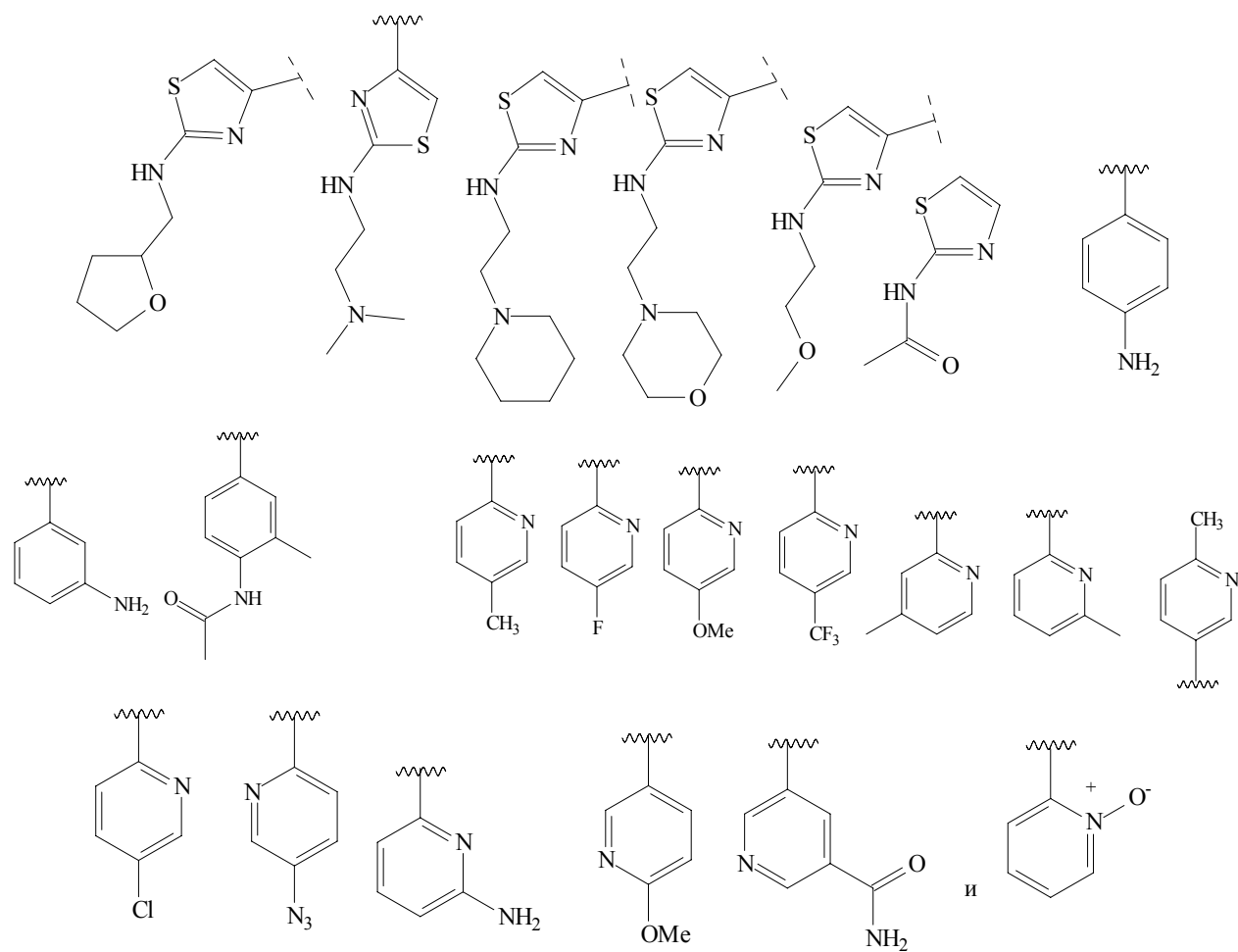
15. Соединение по п. 1, в котором R^2 выбирают из группы, состоящей из H, Br, $CONHCH_3$, $CON(CH_3)_2$, $CONH_2$, $CH=CH_2$,



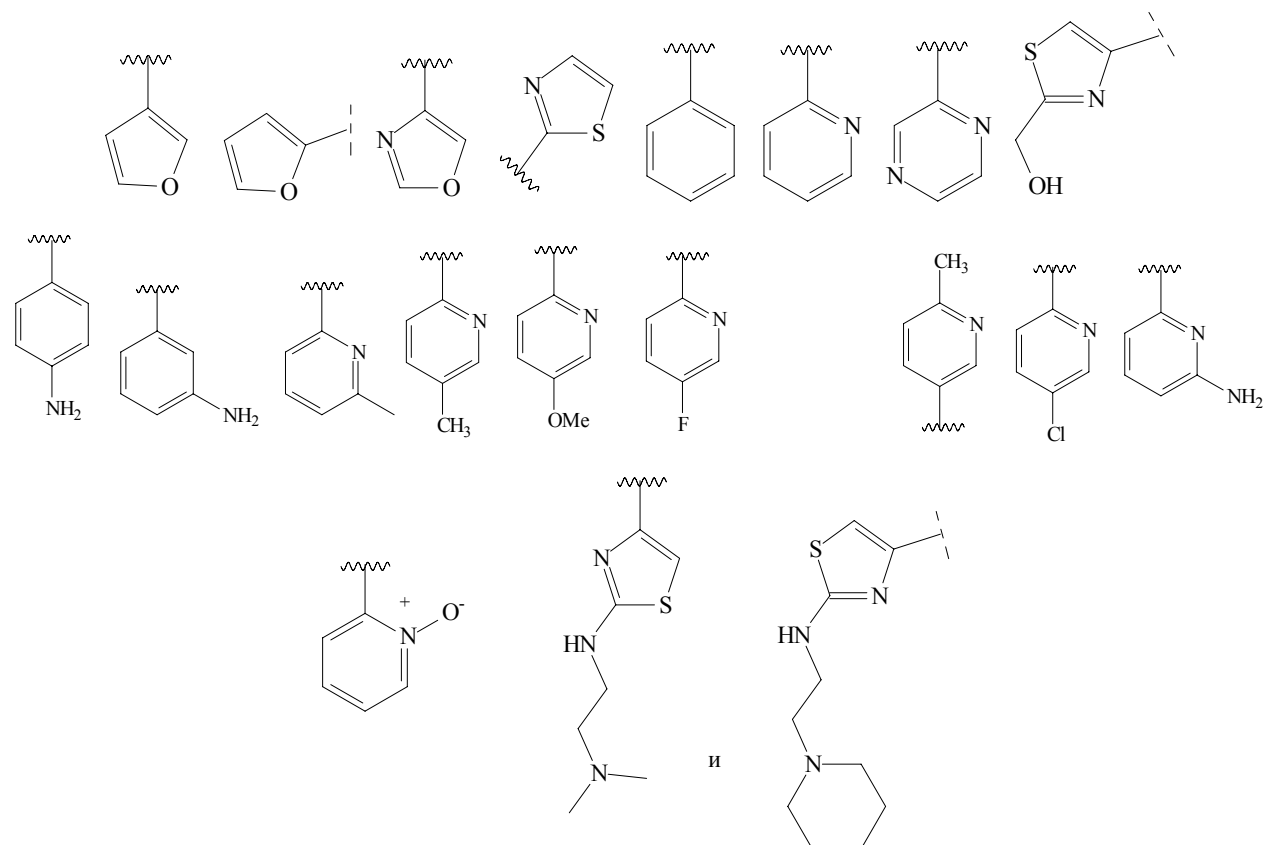


16. Соединение по п. 15, в котором R^2 выбирают из:





17. Соединение по п. 16, в котором R^2 выбирают из:



18. Соединение по п. 1, в котором R^3 обозначает (C_{3-7}) циклоалкил.

19. Соединение по п. 18, в котором R^3 означает цикlopентил или циклогексил.

20. Соединение по п. 1 формулы изобретения, в котором Y^1 означает O.

21. Соединение по п. 1 формулы изобретения, в котором Z означает $N(R^{6a})R^6$, где R^{6a} представляет собой H, а R^6 представляет собой (C_{2-6}) -алкенил, арил, Het, (C_{1-6}) алкил-арил, (C_{1-6}) алкил-Het, и где все указанные алкенил, арил, Het, алкил-арил или алкил-Het, необязательно замещены: - 1-4 заместителями, которые выбирают из следующих заместителей:

а) (C_{1-6}) алкил, C_{3-7} спироциклоалкил, необязательно содержащий 1 или 2 гетероатома или (C_{2-6}) алкенил, каждый из которых необязательно замещены радикалом R^{150} ;

б) OR^{104} , где R^{104} представляет собой H или (C_{1-6}) алкил, которые необязательно замещены радикалом R^{150} ;

д) $NR^{111}R^{112}$, где R^{111} представляет собой H или (C_{1-6}) алкил и R^{112} представляет собой (C_{1-6}) алкил или арил, Het, причем указанные алкил и арил необязательно замещены радикалом R^{150} ;

и) COR^{127} , где R^{127} представляет собой (C_{1-6}) алкил,

к) $COOR^{128}$, где R^{128} представляет собой H;

л) $CONR^{129}R^{130}$, где R^{129} и R^{130} независимо представляют собой H, (C_{1-6}) алкил, арил и Het, причем указанные алкил, арил и Het необязательно замещены радикалом R^{150} ;

м) арил или Het, каждый из которых необязательно замещен радикалом R^{150} ; где R^{150} обозначает

- 1-3 заместителя, которые выбирают из следующих заместителей:

а) (C_{1-6}) алкил или (C_{2-6}) алкенил, каждый из которых необязательно замещен радикалом R^{160} ;

д) $NR^{111}R^{112}$, где R^{111} представляет собой H, и R^{112} представляет собой H,

к) $COOR^{128}$, где R^{128} представляет собой H,

л) $CONR^{129}R^{130}$, где R^{129} и R^{130} независимо представляют собой H,

где R^{160} определяют как 1 или 2 заместителя, которые выбирают из $COOR^{161}$ или $CON(R^{162})_2$, где R^{161} и каждый R^{162} независимо представляют собой H.

22. Соединение по п. 21, в котором R^6 представляет собой C_{2-6} алкенил, фенил, (C_{1-6}) алкил-арил, (C_{1-6}) алкил-Het, где указанные алкенил, фенил и алкильная часть указанных алкил-арила или алкил-Het необязательно замещена 1-3 заместителями, которые выбирают из следующих заместителей:

а) (C_{1-6}) алкил, C_{3-7} спироциклоалкил, необязательно содержащий 1 или 2 гетероатома или (C_{2-6}) алкенил, каждый из которых необязательно замещен радикалом C_{1-6} алкил или NH_2 ;

д) NHR^{112} , где R^{112} представляет собой арил, причем указанные арил, Het, необязательно замещен радикалом R^{150} ;

к) $COOH$; и

л) $CONR^{129}R^{130}$, где R^{129} и R^{130} независимо представляют собой H, (C_{1-6}) арил-алкил или Het, причем указанные алкил, арил и Het, необязательно замещены радикалом R^{150} ;

м) фенил или Het, оба необязательно замещены радикалом R^{150} и

где R^{150} выбирают из:

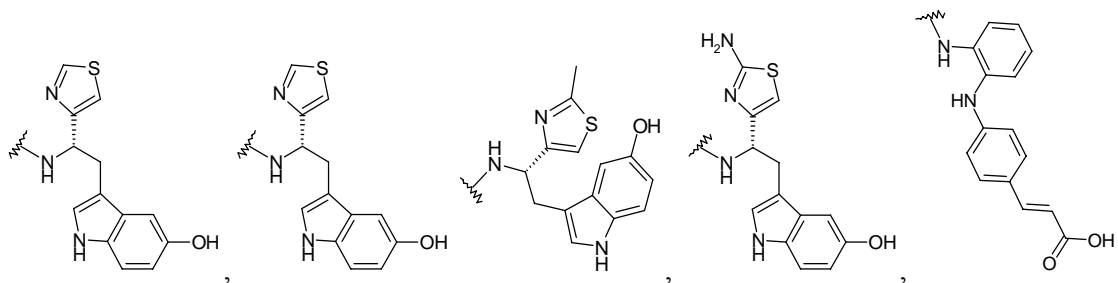
- 1 или 2 заместителей, которые выбирают из следующих заместителей:

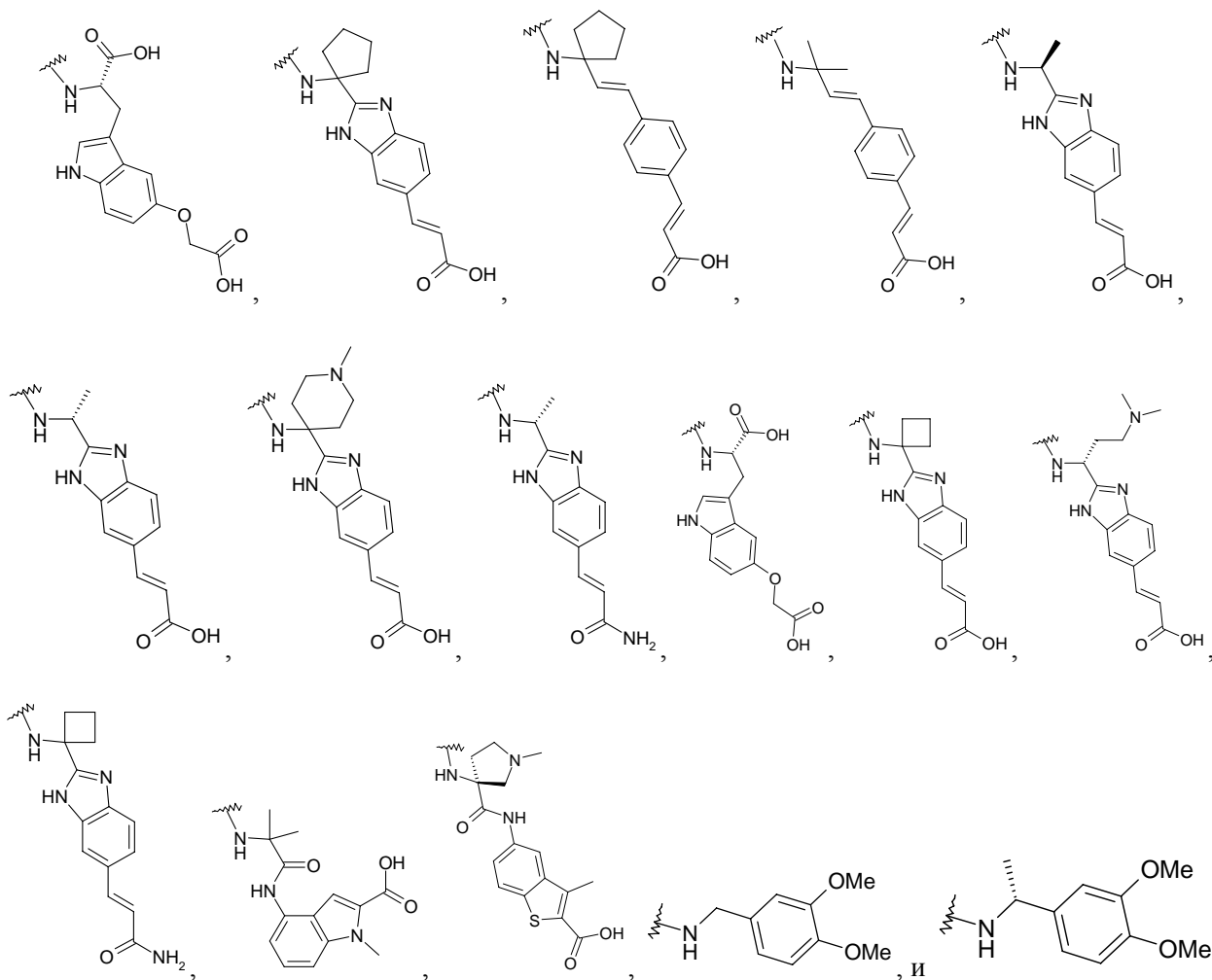
а) (C_{1-6}) алкил или (C_{2-6}) алкенил, оба необязательно замещены группой $COOH$ или $CONH_2$;

к) $COOH$;

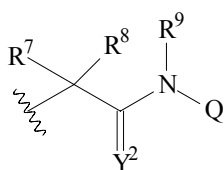
л) $CONH_2$.

23. Соединение по п. 1, в котором Z выбирают из:





24. Соединение по п. 1, где R⁶ представляет собой:



где R⁷ и R⁸ каждый независимо представляет собой H или (C₁₋₆)алкил, где указанный алкил необязательно замещен радикалом R⁷⁰; или R⁷ и R⁸ ковалентно связаны друг с другом с образованием при этом второго (C₃₋₇)циклоалкила или 4, 5- или 6-членного гетероцикла, содержащего 1 гетероатом, который выбирают из O, N и S;

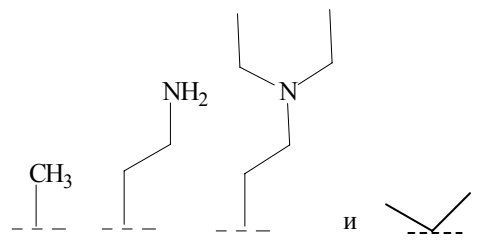
где R⁷⁰ означает:

д) NR¹¹¹R¹¹², где R¹¹¹ представляет собой H или (C₁₋₆)алкил и R¹¹² представляет собой H или (C₁₋₆)алкил.

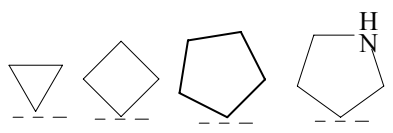
25. Соединение по пп. 1 или 24, в котором R⁷ и R⁸ каждый независимо представляет собой H или (C₁₋₆)алкил или R⁷ и R⁸ ковалентно связаны друг

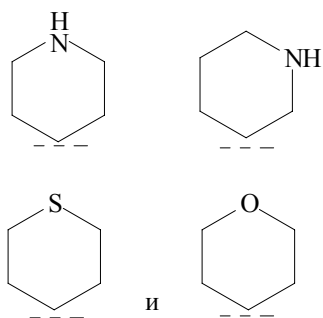
с другом с образованием при этом циклопропила, циклобутила, циклопентила, пирролидина, пиперидина, тетрагидрофурана, тетрагидропирана или пентаметилсульфида; где указанный алкил необязательно является монозамещенным заместителем, выбранным из:
а) (C₁₋₆)алкила
б) NH₂, N(CH₂CH₃)₂.

26. Соединение по п. 25, в котором R⁷ и R⁸ выбирают из:

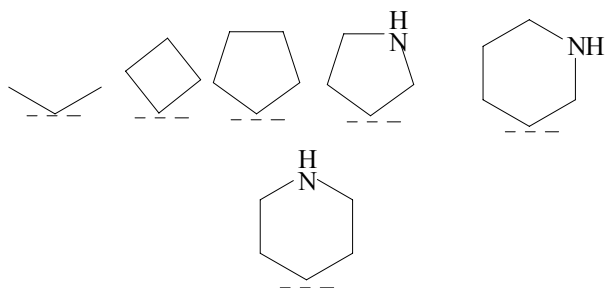


или R⁷ и R⁸ друг с другом образуют:





27. Соединение по п. 26, в котором R^7 и R^8 выбирают из:



28. Соединение по п. 24, в котором R^9 означает Н.

29. Соединение по п. 24, где Q представляет собой 6- или 10-членный арил, Нет или (C_{1-6}) арил, каждый из которых необязательно замещен:

- заместителем, который выбирают из галогена или циано; или

- 1-4 заместителями, которые выбирают из следующих заместителей:

а) (C_{1-6}) алкил, (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{2-6}) алкенил или (C_{2-8}) алкинил, (C_{1-6}) , каждый из которых необязательно замещен радикалом R^{150} ;

б) OR^{104} , где R^{104} представляет собой Н,

г) $SO_2N(R^{108})_2$, где каждый R^{108} независимо представляет собой Н,

д) $NR^{111}R^{112}$, где R^{111} представляет собой Н или (C_{1-6}) алкил, где R^{111} представляет собой Н или (C_{1-6}) алкил, а R^{112} представляет собой Н или (C_{1-6}) алкил,

е) $NR^{116}COR^{117}$, где R^{116} и R^{117} каждый представляет собой Н или (C_{1-6}) алкил,

з) $NR^{121}COCOR^{122}$, где R^{121} представляет собой Н и R^{122} представляет собой OR^{123} или $N(R^{124})_2$,

где R^{123} и каждый R^{124} независимо представляет собой Н или (C_{1-6}) алкил) или R^{124} означает ОН, к) $COOR^{128}$, где R^{128} представляет собой Н, л) $CONR^{129}R^{130}$, где R^{129} и R^{130} независимо представляют собой Н и

м) Нет, необязательно замещенный радикалом R^{150} , где R^{150} выбирают из:

- 1 заместителя, который выбирают из циано или - 1-3 заместителей, которые выбирают из следующих заместителей:

д) $NR^{111}R^{112}$, где R^{111} представляет собой Н и R^{112} представляет собой Н,

к) тетразола или $COOR^{128}$, где R^{128} представляет собой Н, и

л) $CONR^{129}R^{130}$, где R^{129} и R^{130} независимо представляют собой Н.

30. Соединение по п. 29, где Q означает 6- или 10-членный арил или Нет, оба необязательно замещены:

- атомом галогена или циано или

- 1-3 заместителями, которые выбирают из следующих заместителей:

а) (C_{1-6}) алкил, первый (C_{3-7}) циклоалкил, (C_{2-6}) алкенил или (C_{2-8}) алкинил, каждый из которых необязательно замещен радикалом R^{150} ;

б) OR^{104} , где R^{104} означает Н,

г) SO_2NHR^{108} , где R^{108} означает Н;

д) $NR^{111}R^{112}$, где оба R^{111} и R^{112} независимо представляют собой Н или (C_{1-6}) алкил;

е) $NHCOR^{117}$, где R^{117} означает Н или (C_{1-6}) алкил;

з) $NHCOCOR^{122}$, где R^{122} означает OR^{123} или $N(R^{124})_2$, где R^{123} и каждый R^{124} независимо представляет собой Н или (C_{1-6}) алкил;

к) $COOR^{128}$, где R^{128} означает Н;

л) $CONHR^{130}$, где R^{130} означает Н;

м) Нет, необязательно замещенный радикалом R^{150} , где R^{150} выбирают из:

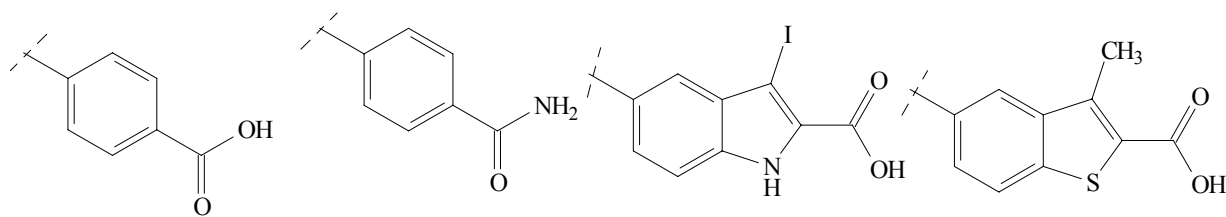
- 1-3 заместителей, которые выбирают из:

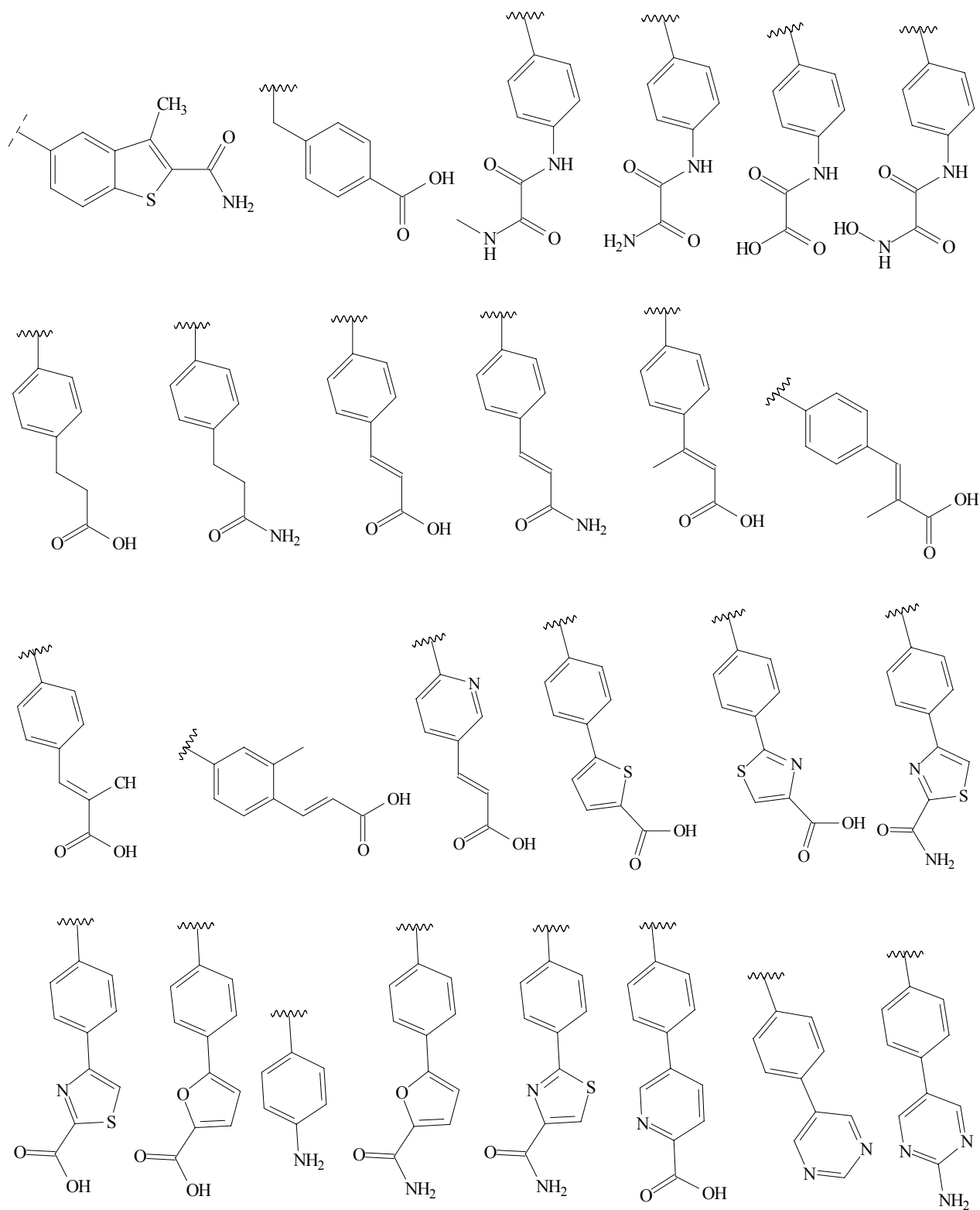
д) $NR^{111}R^{112}$, где оба R^{111} и R^{112} независимо представляет собой Н;

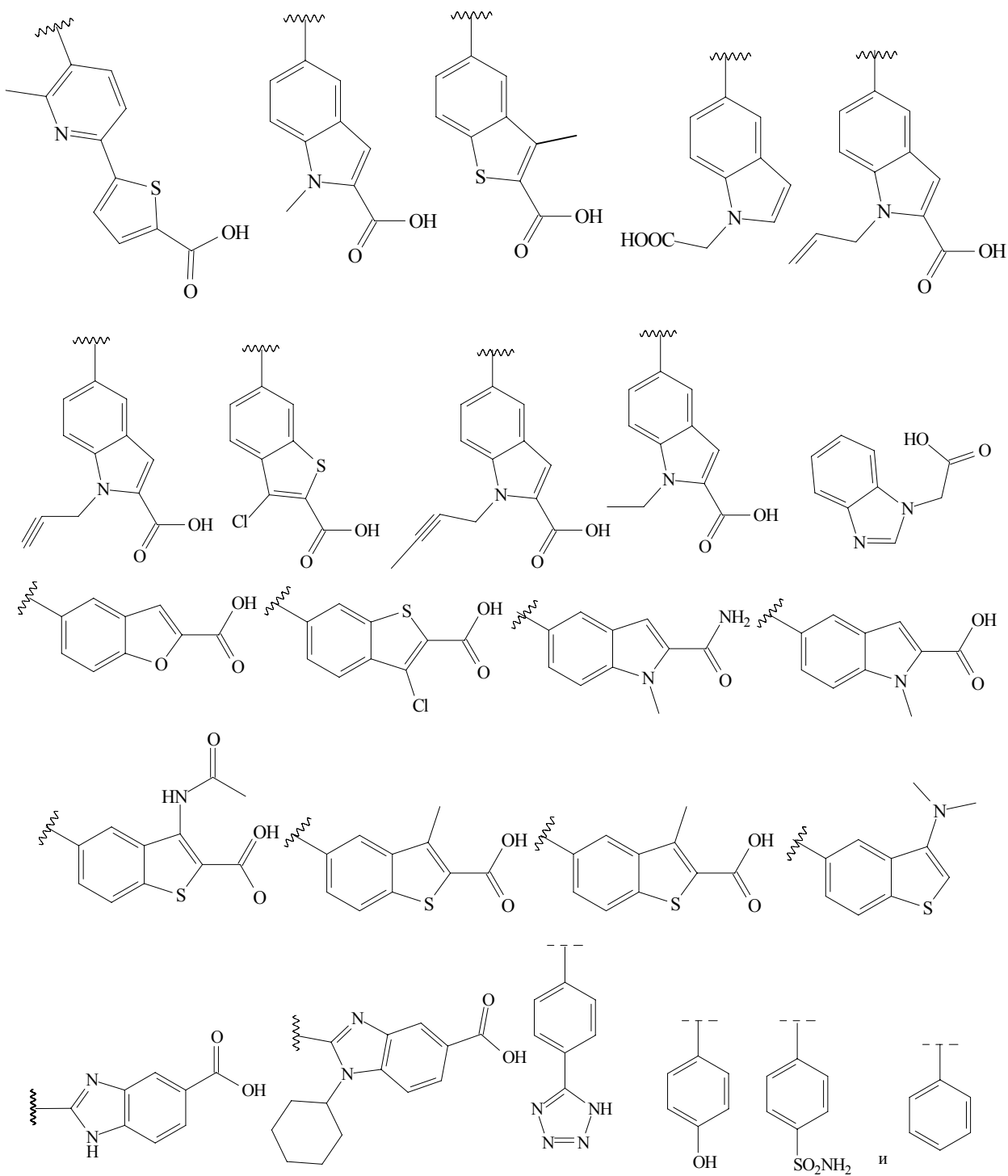
к) $COOR^{128}$, где R^{128} означает Н и

л) $CONHR^{130}$, где R^{130} означает Н.

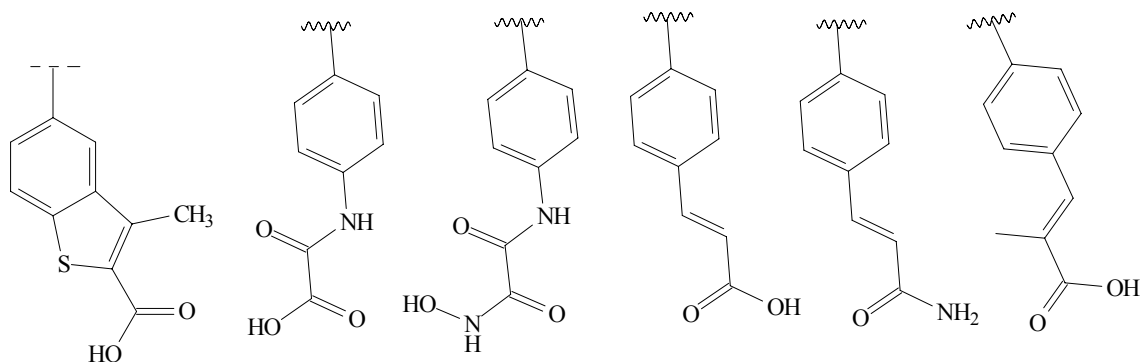
31. Соединение по п. 23, в котором Q выбирают из следующих заместителей:

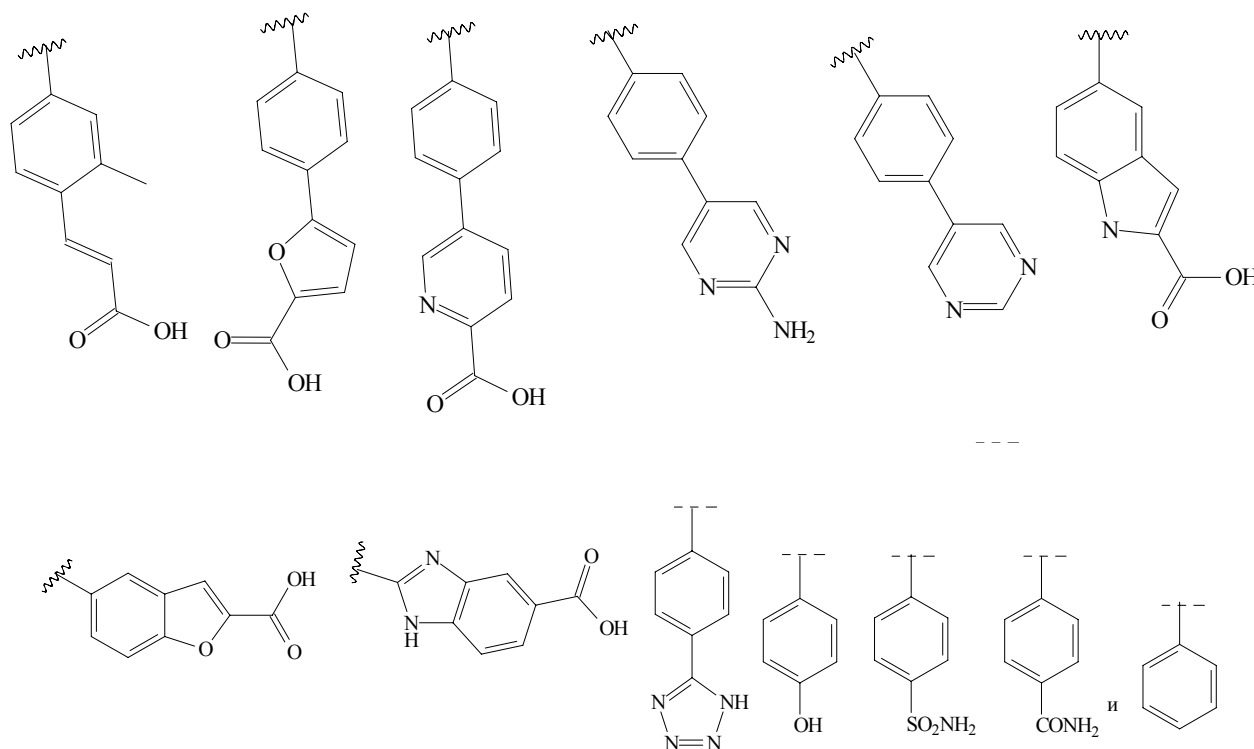




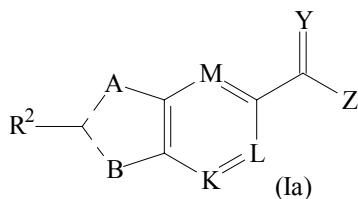


32. Соединение по п. 31 формулы изобретения, в котором Q выбирают из следующих заместителей:





33. Соединение по п. 1, представленное формулой Ia:



в которой

A означает O, S, NR¹ или CR¹;

B означает NR³ или CR³;

R¹ выбирают из группы, состоящей из H, (C₁₋₆)-алкила, бензила и (C₁₋₆-алкил)-5- или 6-членного гетероцикла, содержащего 1-4 гетероатома, которые выбирают из O, N и S,

где указанный бензил и указанные гетероцикл необязательно замещены 1-4 заместителями, которые выбирают из группы, состоящей из COOH; R² выбирают из группы, состоящей из H, галогена, (C₁₋₆)-алкила, (C₃₋₇)-циклоалкила, фенила, 5- или 6-членного гетероцикла, содержащего 1-4 гетероатома, которые выбирают из O, N и S, пиридин-N-оксида и 9- или 10-членного гетеробикацикла, содержащего 1-4 гетероатома, которые выбирают из O, N и S,

указанные фенил, гетероцикл и гетеробикацикл необязательно замещены 1-4 заместителями, которые выбирают из группы, состоящей из: галогена, C(галоген)₃, (C₁₋₆)-алкила, OH, O(C₁₋₆-алкила), NH₂ и N(C₁₋₆-алкил)₂;

R³ означает (C₃₋₇)-циклоалкил;

M представляет собой N или CR⁴, где R⁴ означает H,

K и L означают CH;

- означает либо простую, либо двойную связь;

Y означает O или S;

Z означает NR⁶R^{6a};

R⁶ выбирают из группы, состоящей из (C₁₋₆)-алкила, (C₃₋₆)-циклоалкила, (C₆₋₁₀)-арила, (C₆₋₁₀)-арил-(C₁₋₆)-алкила, (C₂₋₆)-алкенила, (C₃₋₆)-циклоалкил-(C₂₋₆)-алкенила и (C₁₋₆)-алкил-5- или 6-членный гетероцикла, содержащего 1-4 гетероатома, которые выбирают из O, N и S,

где все указанные циклоалкил, арил, алкенил, гетероцикл необязательно замещены 1-4 заместителями, которые выбирают из COOH, (C₁₋₆)-алкила, 5- или 6-членного гетероцикла, содержащего 1-4 гетероатома, которые выбирают из O, N и S,

где указанные алкил и гетероцикл необязательно замещены 1-4 заместителями, которые выбирают из (C₁₋₆-алкила), NH₂ и N(C₁₋₆-алкил)₂; и

указанный 9- или 10-членный гетеробикацикл, содержащий 1-4 гетероатома, которые выбирают из O, N и S, необязательно замещен 1-4 заместителями, выбранными из заместителей:

(C₂₋₄-алкенил)COOH и -O-(C₁₋₆)-алкил COOH, и 6-членный арил, необязательно замещенный 1-4 заместителями, которые выбирают из следующих заместителей:

(C₂₋₄-алкенил)COOH и (C₁₋₄)-алкокси, и где указанный алкил необязательно замещен 1-4 заместителями, выбранными из 5- или 6-членного ге-

тероцикла, имеющего 1-4 гетероатома, выбранного из группы, включающей O, N и S, где указанный гетероцикл необязательно замещен 1-4 заместителями,

выбранными из группы, включающей (C₁₋₆)алкила, NH₂ и N(C₁₋₆ алкил)₂;

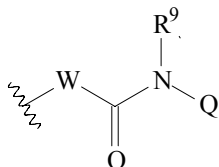
9- или 10-членный гетеробидцикл имеет 1-4 гетероатома, выбранных из O, N и S, указанный гетеробидцикл необязательно замещен 1-4 заместителями, выбранными из 1-4 заместителей, которые выбираются из

(C₂₋₄алкенил)COOH и -O-(C₁₋₆)алкила COOH и 6-членный арил необязательно замещен 1-4 заместителями, выбранными из

(C₂₋₄алкенил)COOH, OH и (C₁₋₄)алкокси;

R^{6a} представляет собой H или

R⁶ означает



где W означает CR⁷R⁸, где R⁷ и R⁸ каждый независимо представляет собой H или (C₁₋₆алкил) или R⁷ и R⁸ ковалентно связаны друг с другом с образованием при этом группы (C₃₋₇циклоалкил), 4-, 5- или 6-членного гетероцикла, содержащего 1-4 гетероатома, выбранных из O, N и S; или один из R⁷ или R⁸ ковалентно присоединен к радикалу R⁹ с образованием пирролидина;

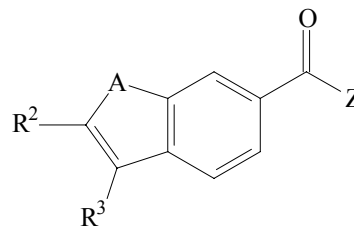
где указанные алкил, циклоалкил и гетероцикл, необязательно замещены 1-4 заместителями, которые выбирают из группы, состоящей из : (C₁₋₆алкила), NH₂ и N(C₁₋₆алкил)₂, R⁹ представляет собой H и

Q выбирают из группы, состоящей из 6-членного арила, 5- или 6-членного гетероцикла, содержащего 1-4 гетероатома, которые выбирают из O, N и S, и 9- или 10-членного гетеробидцикла, содержащего 1-4 гетероатома, которые выбирают из O, N и S;

где все указанные арил, гетероцикл и гетеробидцикл необязательно замещены 1-4 заместителями, которые выбирают из следующих заместителей: OH, COOH, (C₁₋₆)алкил, (C₁₋₆)алкилCOOH, (C₁₋₆ алкил)(C₂₋₄ алкинил), галоген, (C₂₋₄)алкенил, 5- или 6-членный второй гетероцикл, содержащий 1-4 гетероатома, которые выбирают из O, N и S,

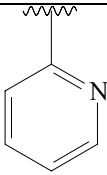
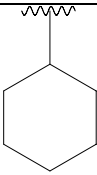
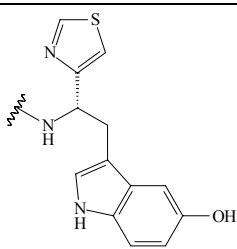
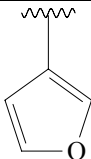
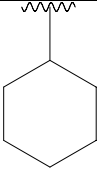
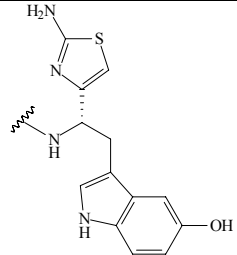
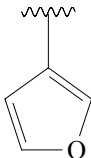
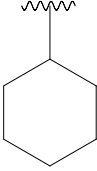
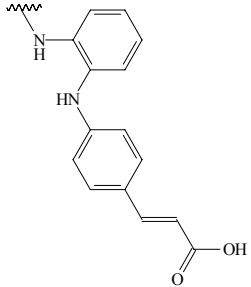
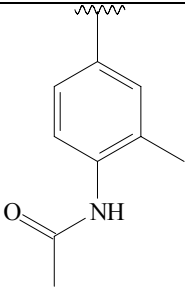
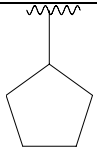
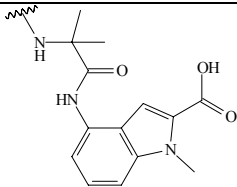
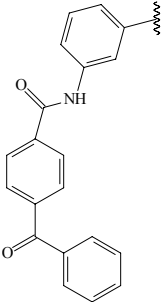
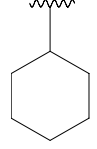
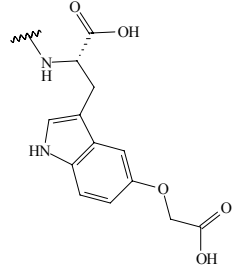
где указанный второй гетероцикл необязательно замещен 1-4 заместителями, которые выбирают из следующих заместителей COOH; NH₂, сульфонида и -CONH₂, (C₂₋₄алкенил)COOH, где указанный алкенил необязательно замещен одним или двумя заместителями (C₁₋₆алкил), тетразолил, NH₂, -O(C₁₋₆алкил)COOH, циано, -NHCOCOON, -NHCOCOONHON, -NHCOCOONH₂, -NHCOCOONHCH₃, NH(C₁₋₆алкил)₂ и -NH(C₂₋₄)ацил или соль этого соединения.

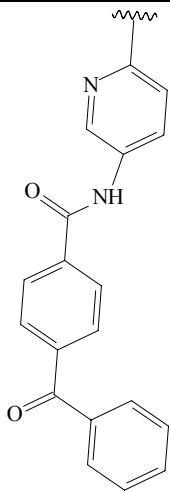
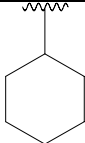
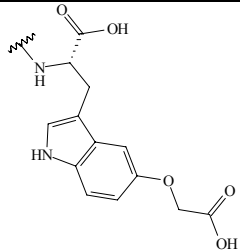
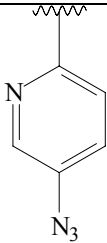
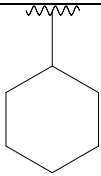
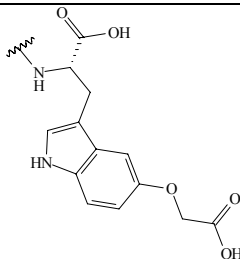
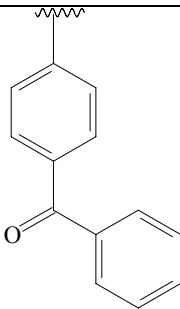
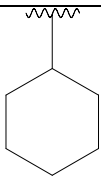
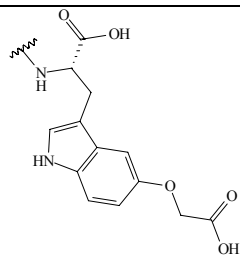
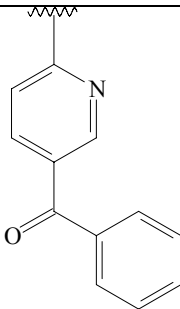
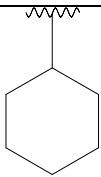
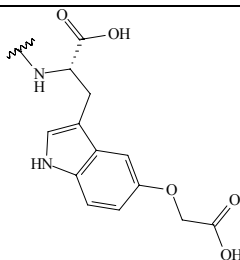
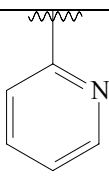
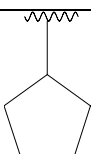
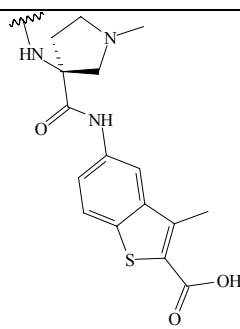
34. Соединение формулы по п.1:

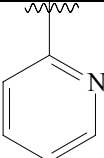
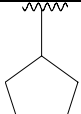
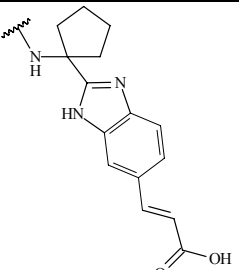
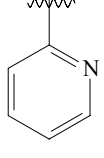
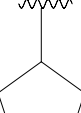
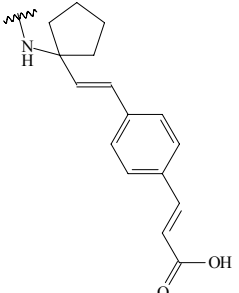
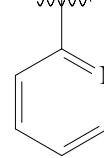
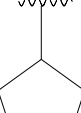
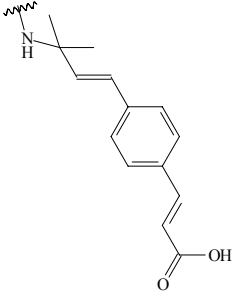
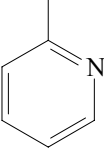
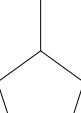
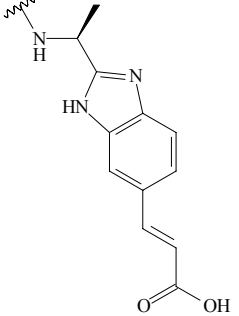
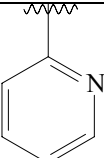
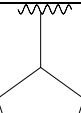
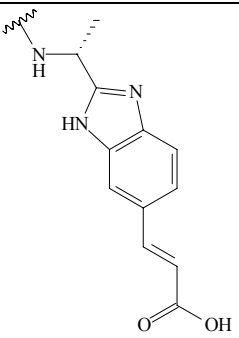
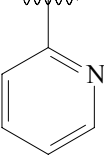
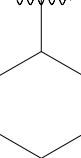
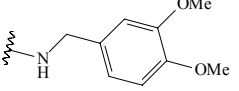


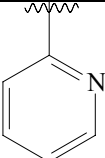
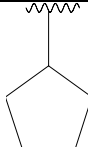
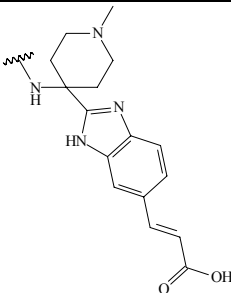
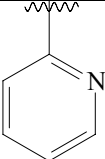
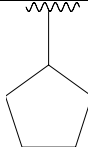
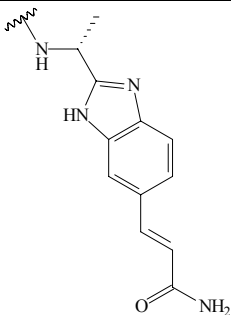
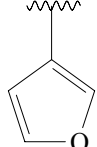
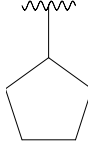
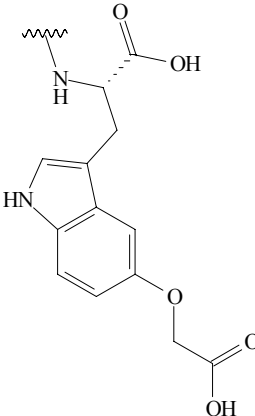
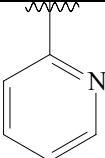
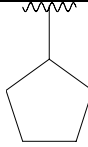
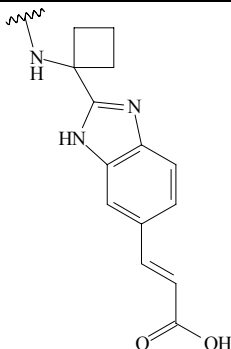
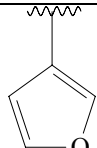
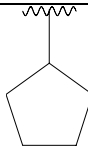
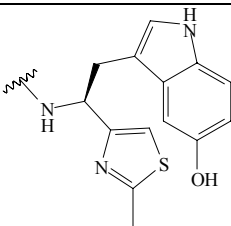
в которой A, R², R³ и Z определяют следующим образом:

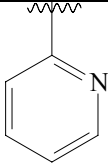
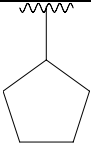
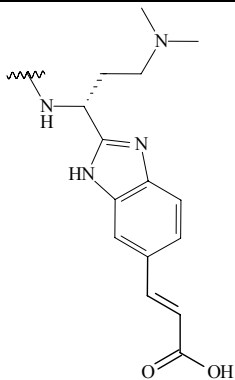
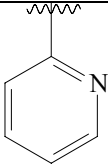
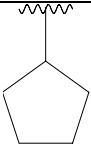
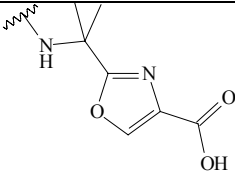
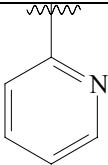
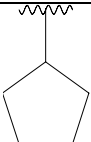
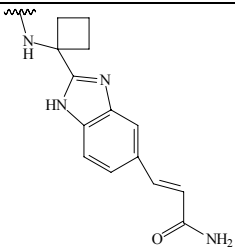
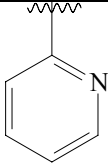
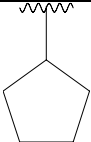
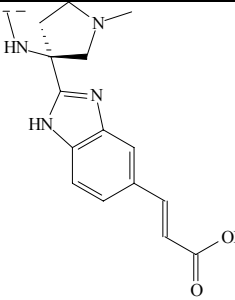
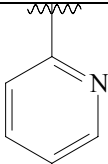
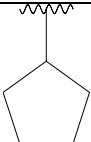
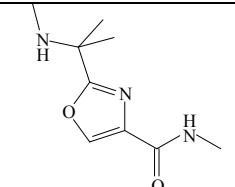
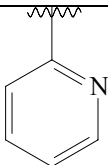
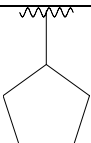
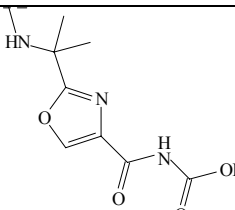
Номер соединения	A	R ²	R ³	Z
1001	NH			
1002	NH			

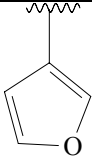
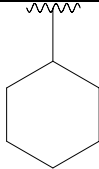
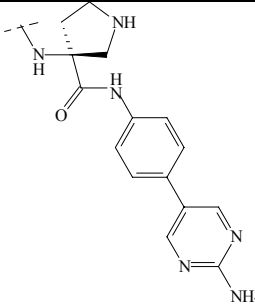
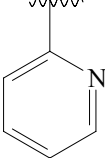
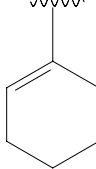
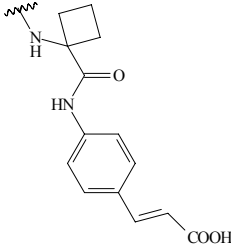
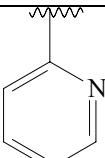
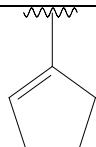
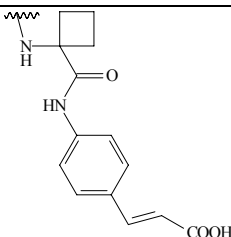
Номер соединения	A	R ²	R ³	Z
1003	NH			
1004	NH			
1005	NH			
1006	NMe			
1008	NMe			

Номер соединения	A	R ²	R ³	Z
1009	NMe			
1010	NMe			
1011	NMe			
1012	NMe			
1013	NMe			

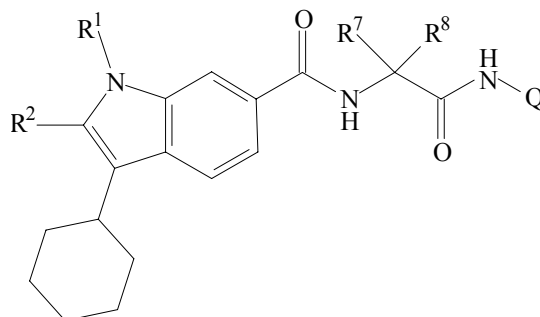
Номер соединения	A	R ²	R ³	Z
1014	NMe			
1015	NMe			
1016	NMe			
1017	NMe			
1018	NMe			
1019	NH			

Номер соединения	A	R ²	R ³	Z
1020	NMe			
1021	NMe			
1022	S			
1023	NMe			
1024	S			

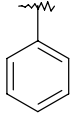
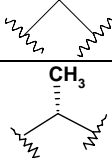
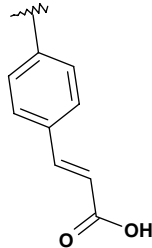
Номер соединения	A	R ²	R ³	Z
1025	NMe			
1026	NMe			
1027	NMe			
1028	NMe			
1029	NMe			
1030	NMe			

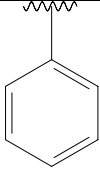
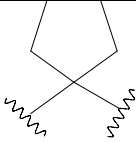
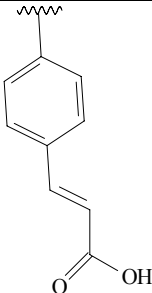
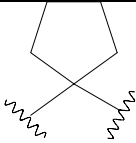
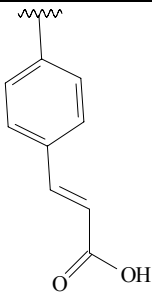
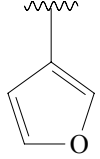
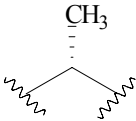
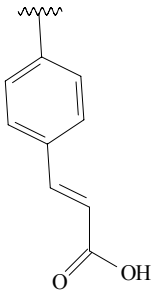
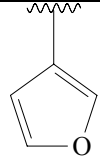
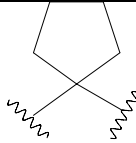
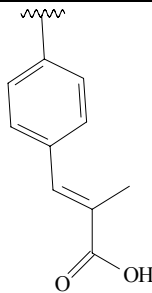
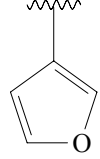
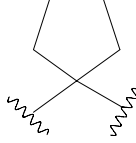
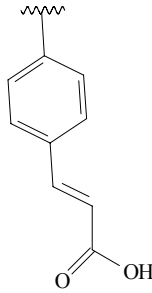
Номер соединения	A	R ²	R ³	Z
1031	NMe			
1032	NMe			
1033	NMe			

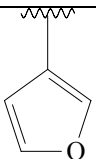
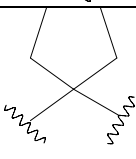
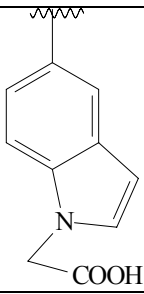
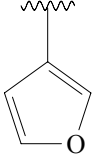
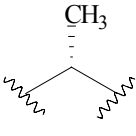
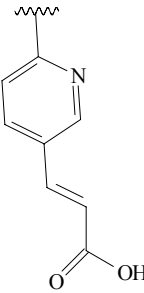
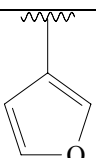
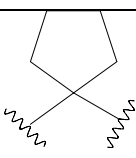
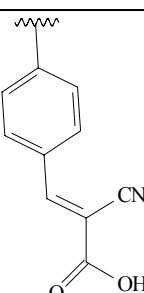
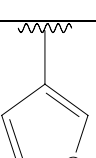
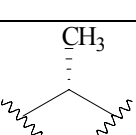
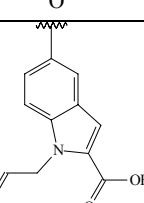
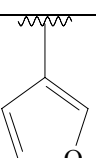
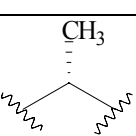
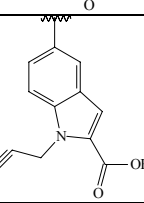
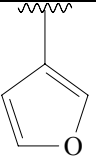
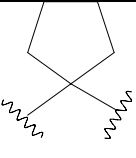
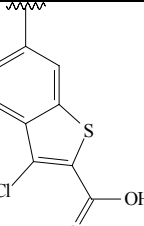
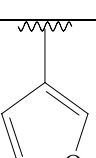
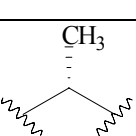
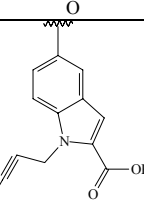
35. Соединение формулы по п.1:

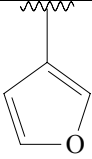
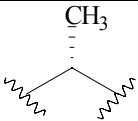
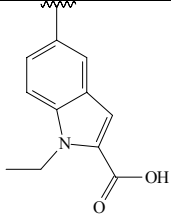
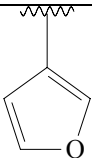
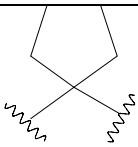
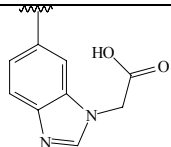
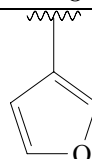
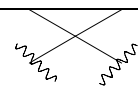
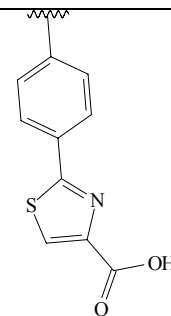
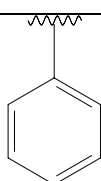
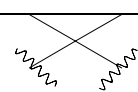
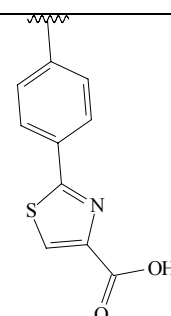
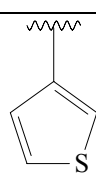
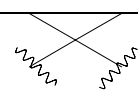
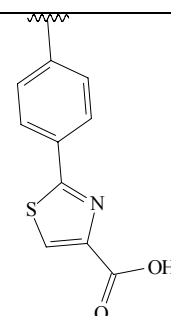
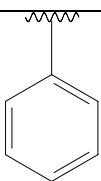
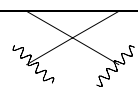
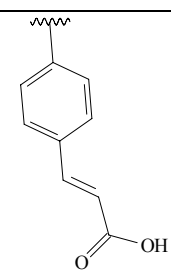


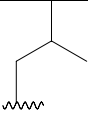
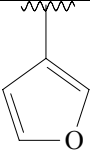
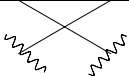
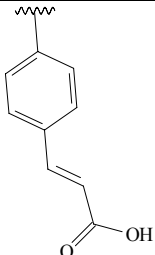

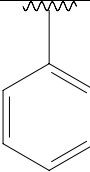

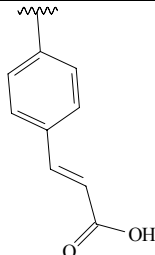

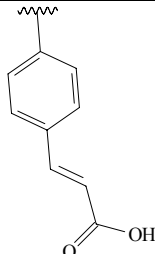
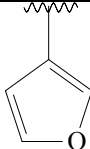

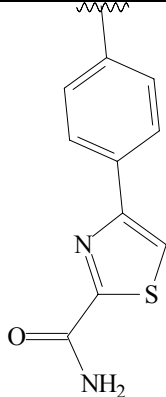
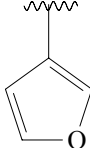
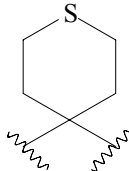
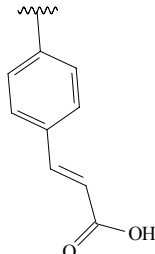
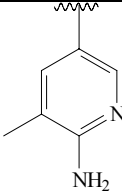

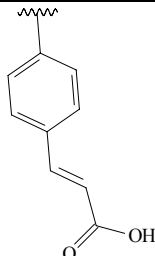
в которой R¹, R², R⁷, R⁸ и Q определяют следующим образом:

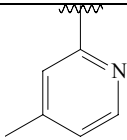
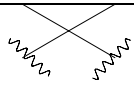
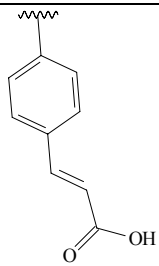
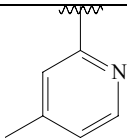
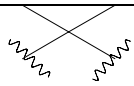
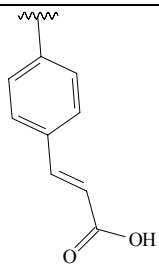
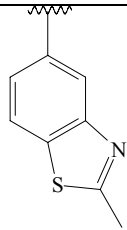
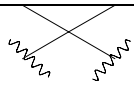
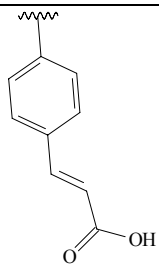
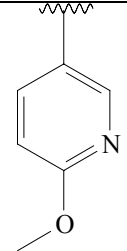
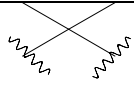
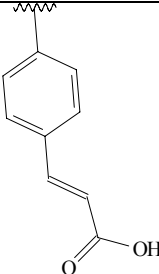
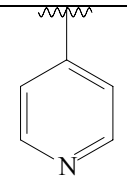
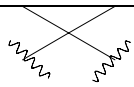
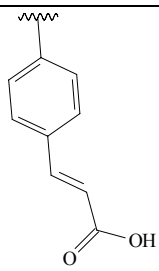
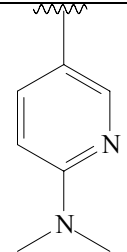
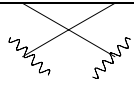
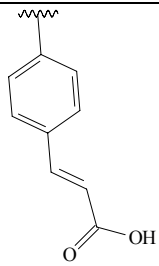
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2001	H				;

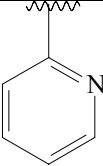
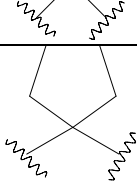
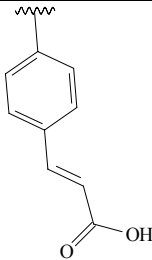
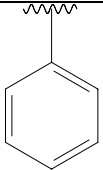
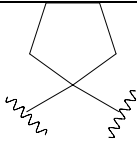
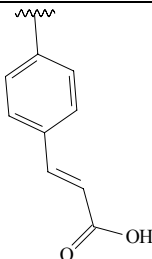
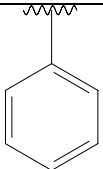
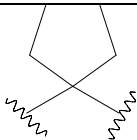
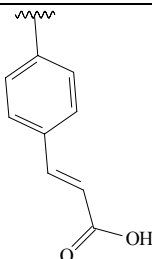
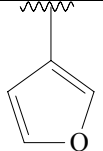
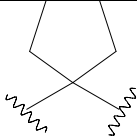
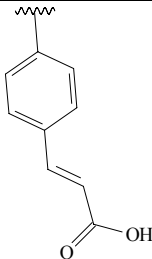
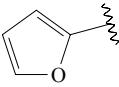
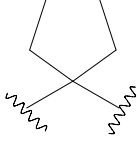
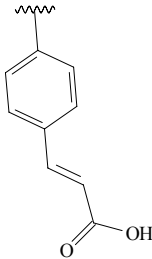
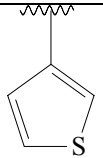
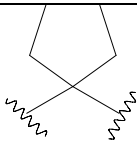
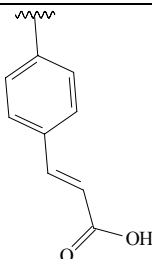
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2002	H				;
2003	H	Br			;
2004	H				;
2005	H				;
2006	Me				;

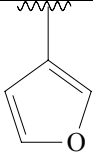
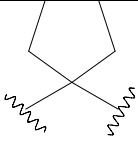
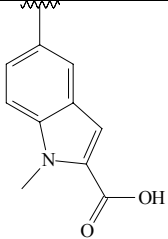
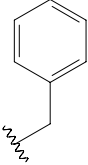
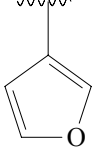
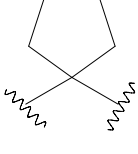
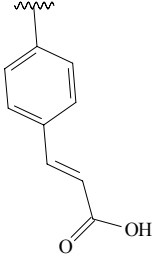
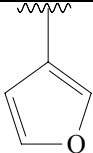
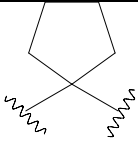
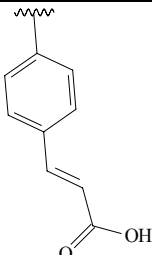
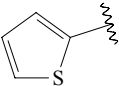
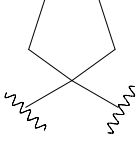
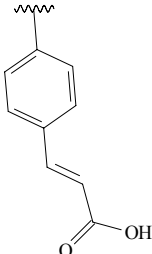
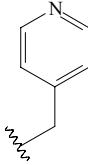
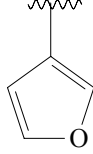
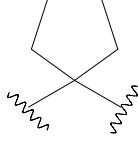
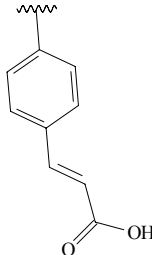
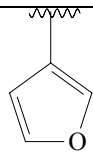
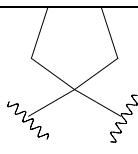
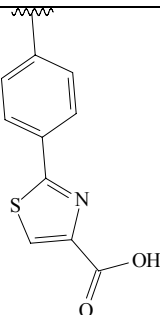
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2008	H				;
2009	H				;
2010	H				;
2011	H				;
2012	H				;
2013	H				;
2014	H				;

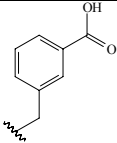
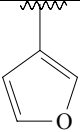
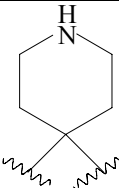
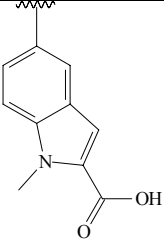
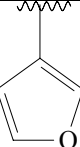
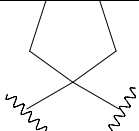
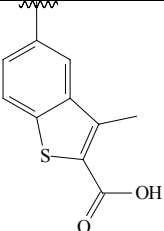
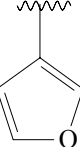
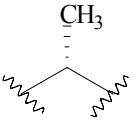
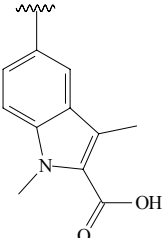
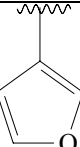
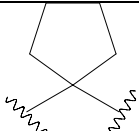
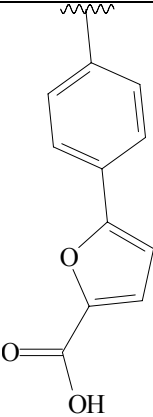
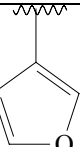
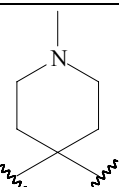
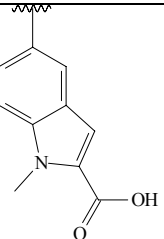
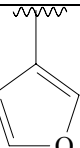

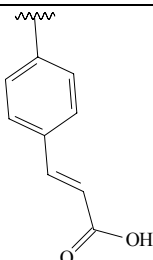
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2015	H				;
2016	H				;
2017	H				;
2018	H				;
2019	H				;
2020	Et				;

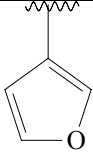
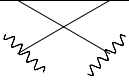
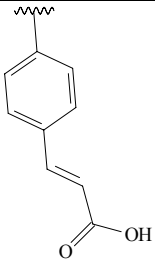
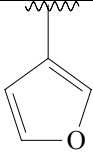
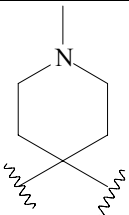
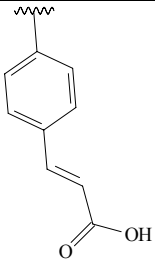
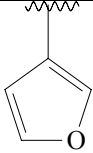
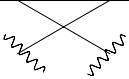
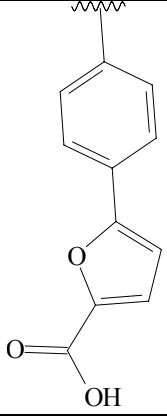
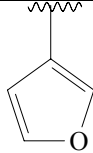

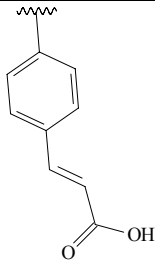
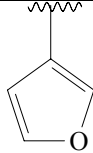
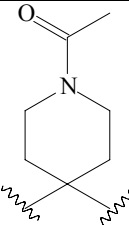
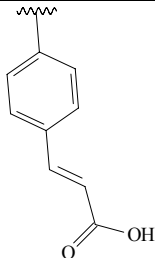
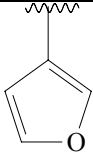
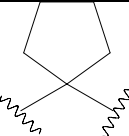
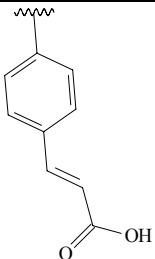
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2021					;
2022					;
2023	Me	H			;
2024	H				;
2025	H				;
2026	Me				;

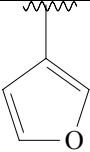
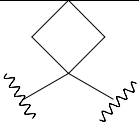
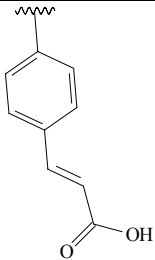
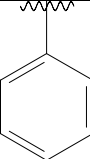
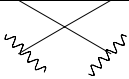
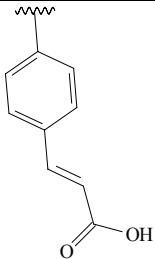
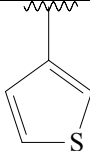

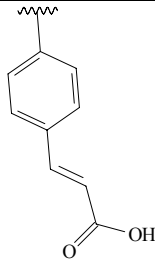
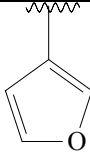
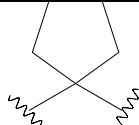
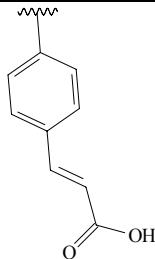
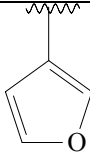
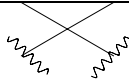
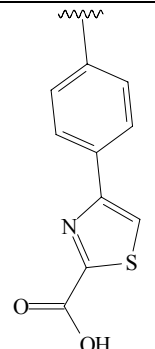
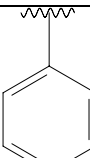
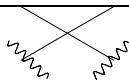
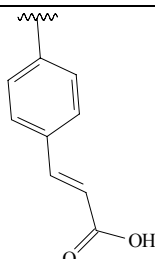
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2027	Me				;
2028	Me				;
2029	Me				;
2030	Me				;
2031	Me				;
2032	Me				;

Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2033	H				;
2034	Me				;
2035	H				;
2036	H				;
2037	H				;
2038	H				;

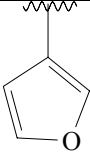
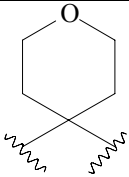
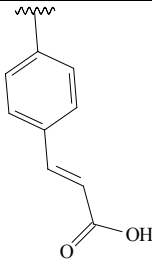
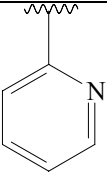
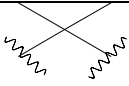
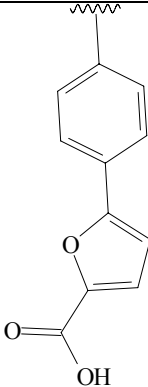
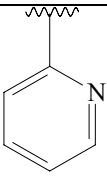
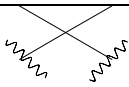
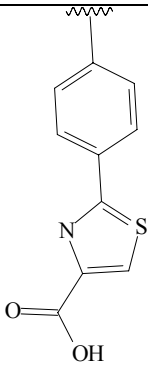
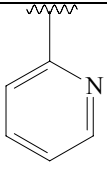
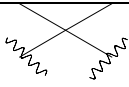
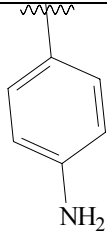
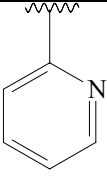
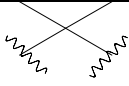
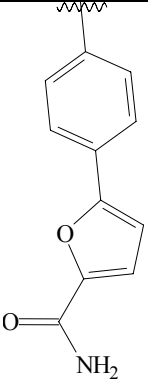
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2039	H				;
2040					;
2041	Me				;
2042	H				;
2043					;
2044	H				;

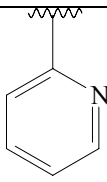
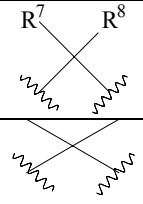
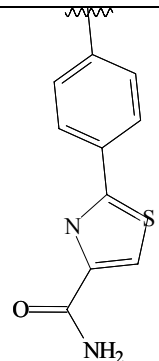
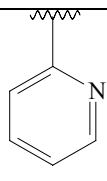
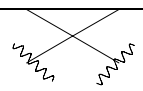
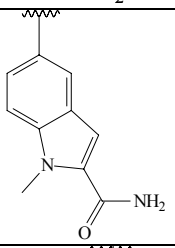
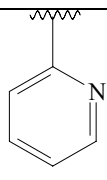
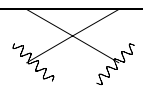
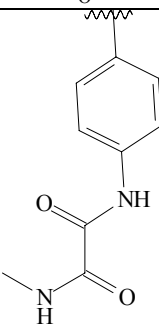
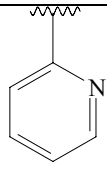
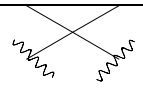
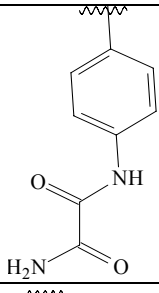
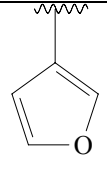
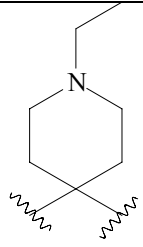
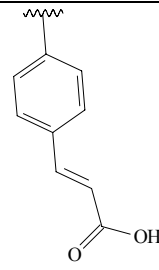
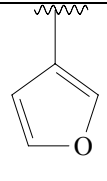
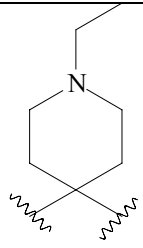
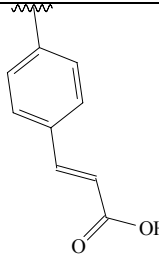
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2045					;
2046	H				;
2047	H				;
2048	H				;
2049	H				;
2050	H				;

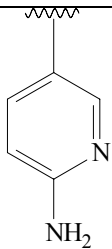
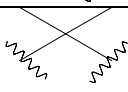
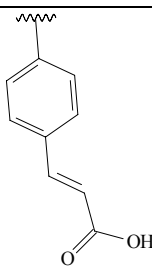
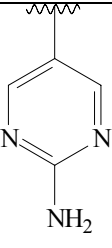
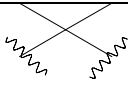
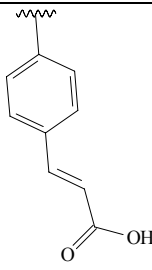
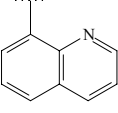
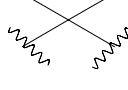
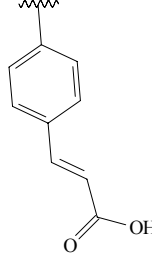
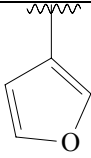
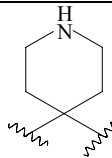
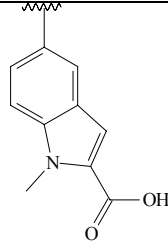
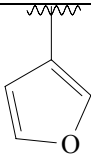
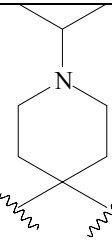
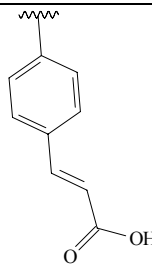
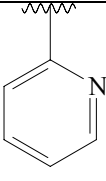
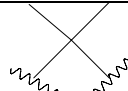
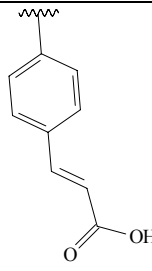
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2051	Me				;
2052	H				;
2053	H				;
2054	Et				;
2055	H				;
2056	H				;

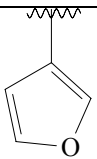
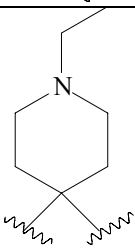
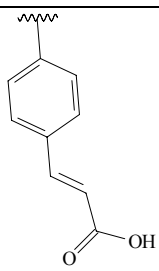
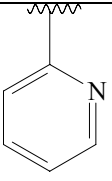
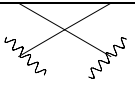
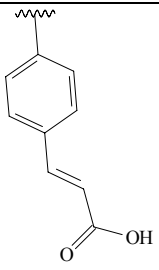
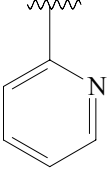
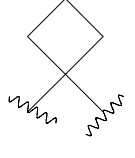
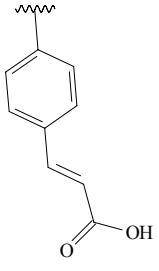
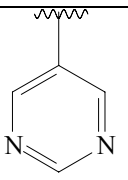
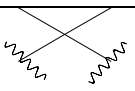
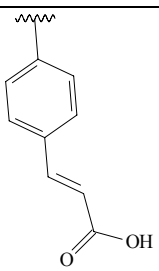
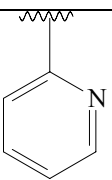
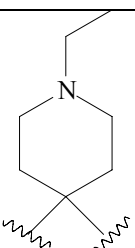
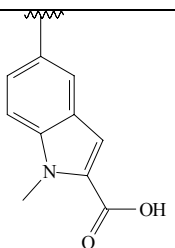
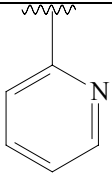
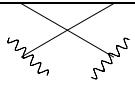
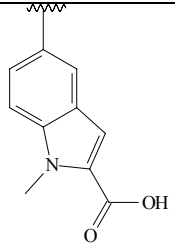
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2057	H				;
2058	H				;
2059	H				;
2060	H				;
2061	H				;
2062	Me				;

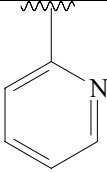

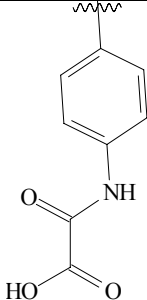
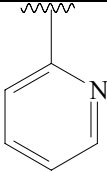

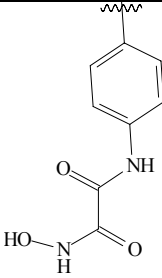
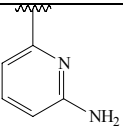

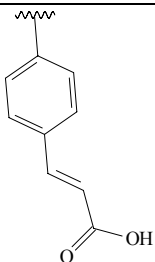
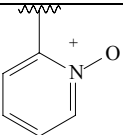

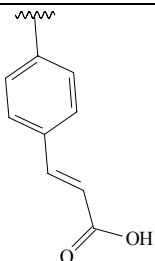
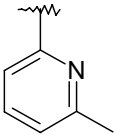

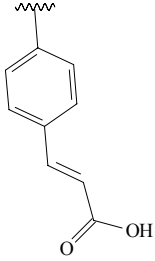
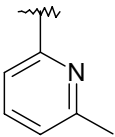
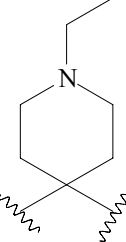
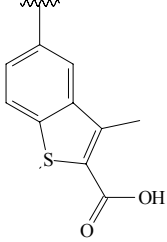
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2063					;
2064	H				;
2065	H				;
2066	Me				;
2067	H				;
2068	Me				;

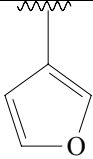
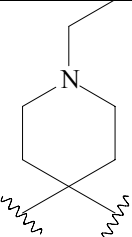
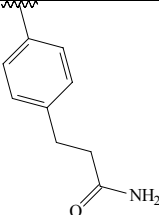
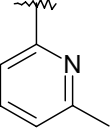
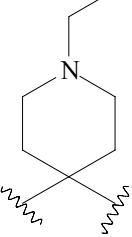
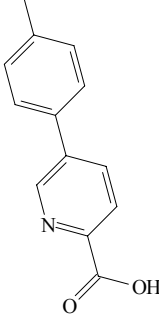
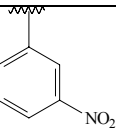
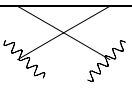
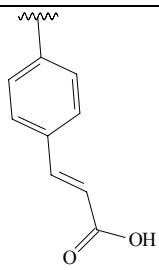
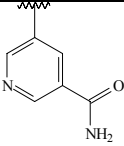
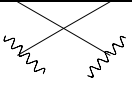
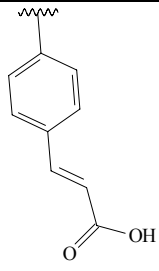
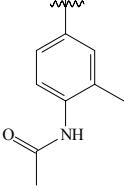
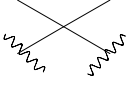
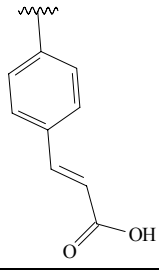
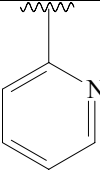
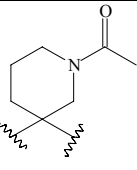
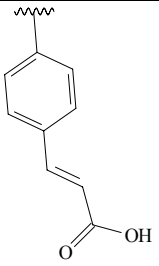
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2069	H				;
2070	Me				;
2071	Me				;
2072	Me				;
2073	Me				;

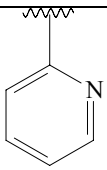
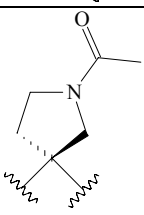
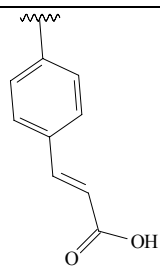
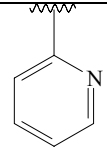
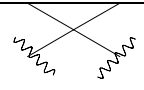
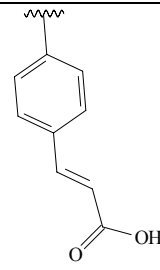
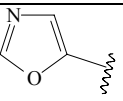
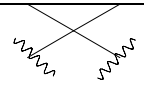
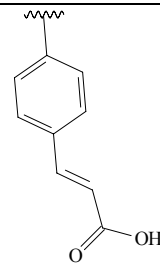
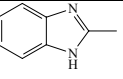
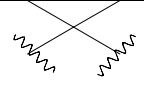
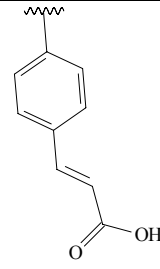
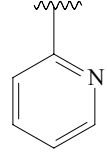
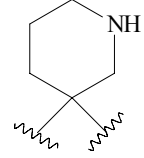
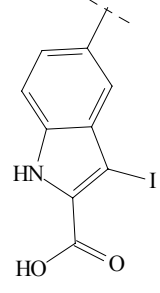
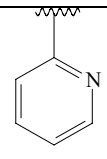
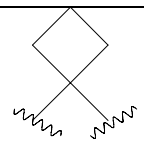
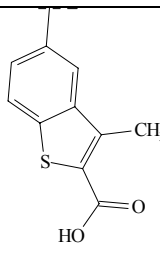
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2074	Me				;
2075	Me				;
2076	Me				;
2077	Me				;
2078	H				;
2079	H				;

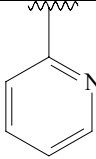
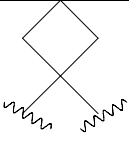
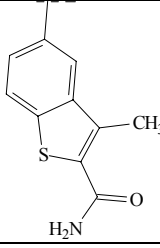
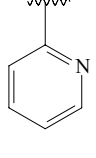
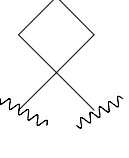
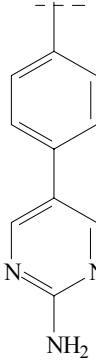
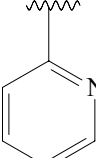
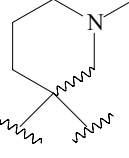
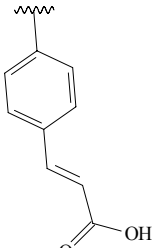
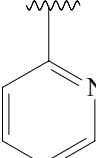
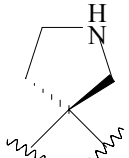
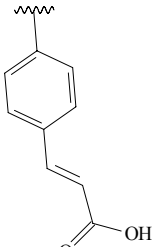
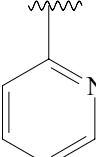
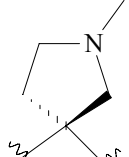
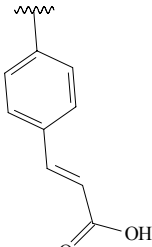
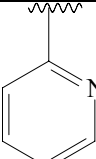
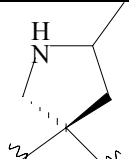
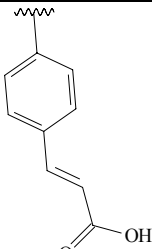
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2080	Me				;
2081	Me				;
2082	Me				;
2084	H				;
2086	H				;
2087	Me				;

Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2088	H				;
2089	H				;
2090	Me				;
2091	Me				;
2092	Me				;
2093	Me				;

Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2094	Me				;
2095	Me				;
2096	Me				;
2097	Me				;
2098	Me				;
2099	Me				;

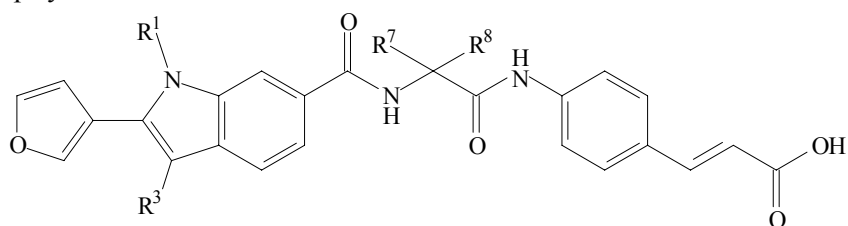
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2100	H				;
2101	Me				;
2102	Me				;
2103	Me				;
2104	Me				;
2105	Me				;

Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2106	Me				;
2107	Me				;
2108	Me				;
2109	Me				;
2110	Me				;
2111	Me				;

Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2112	Me				;
2113	Me				;
2114	Me				;
2115	Me				;
2116	Me				;
2117	Me				; И

Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
2118	Me				.

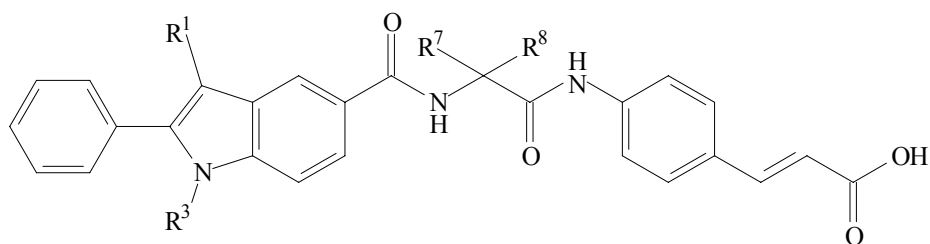
36. Соединение формулы по п. 1:



в которой R¹, R³, R⁷ и R⁸ определяют следующим образом:

Номер соединения	R ¹	R ³	R ⁷ R ⁸	
3001	H			;
3002	H			;
3003	Me			; и
3004	Me			.

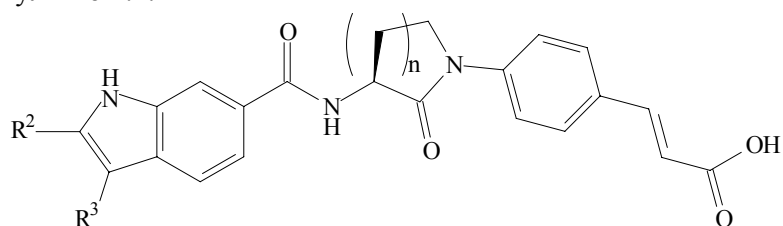
37. Соединение формулы по п. 1:



в которой R¹, R³, R⁷ и R⁸ определяют следующим образом:

Номер соединения	R ¹	R ³	R ⁷ R ⁸	
4001	Me			и
4002	H			.

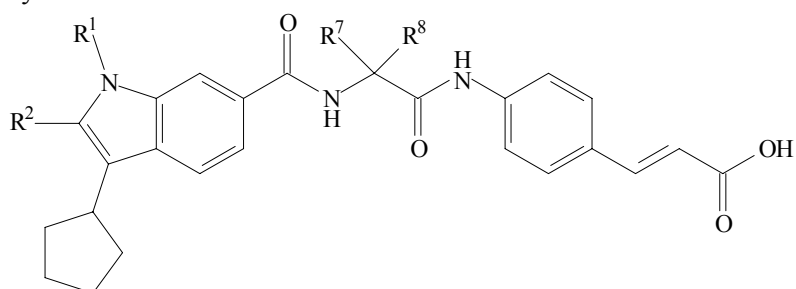
38. Соединение формулы по п.1:



в которой R², R³ и n определяют следующим образом:

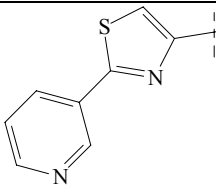
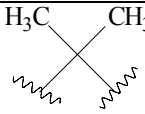
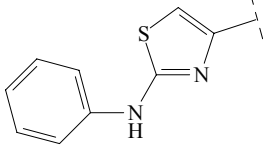
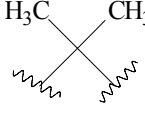
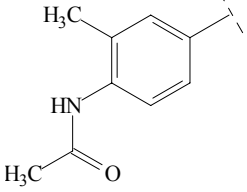
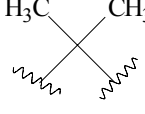
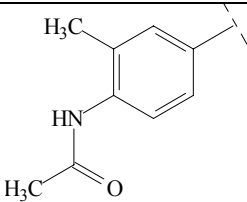
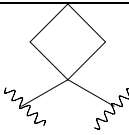
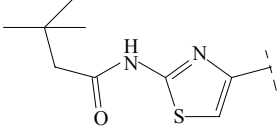
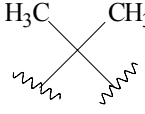
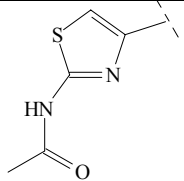
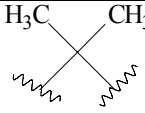
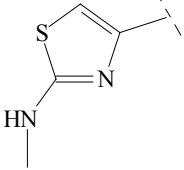
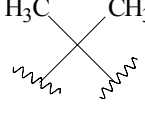
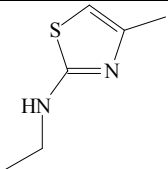
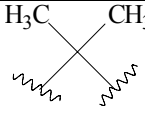
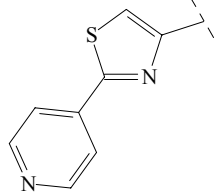
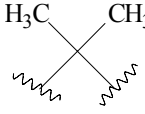
Номер соединения	R ²	R ³	n	
5001			1	.

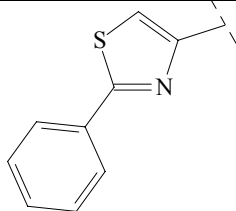
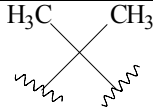
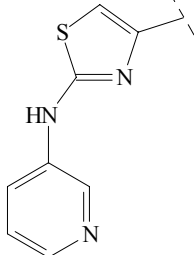
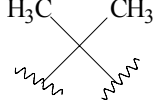
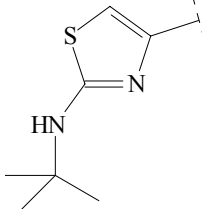
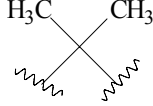
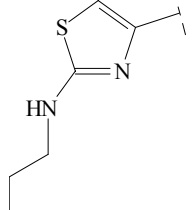
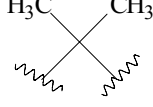
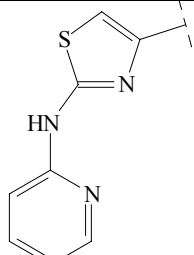
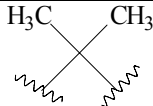
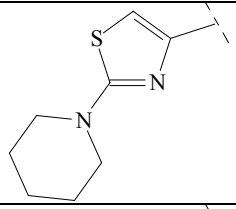
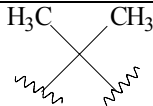
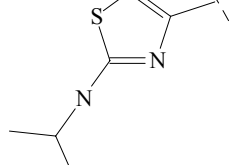
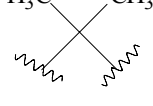
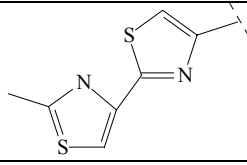
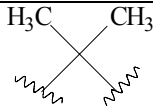
39. Соединение формулы по п.1:

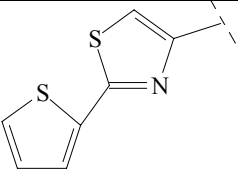
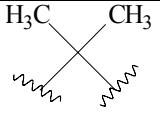
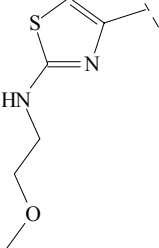
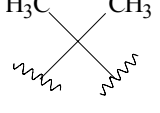
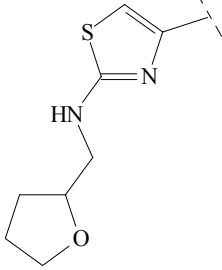
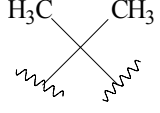
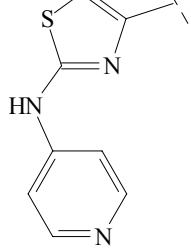
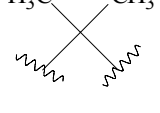
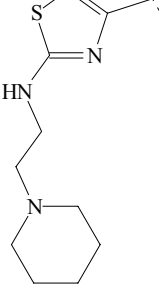
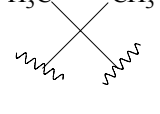
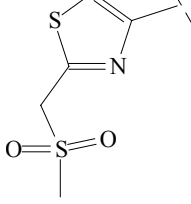
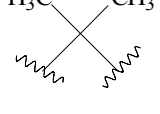


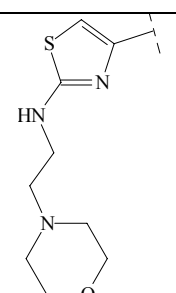
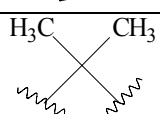
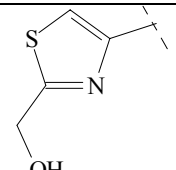
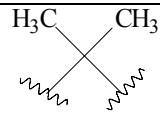
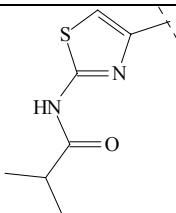
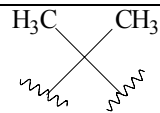
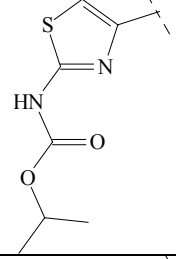
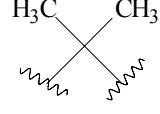
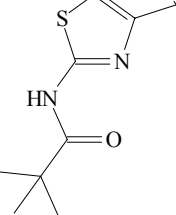
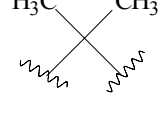
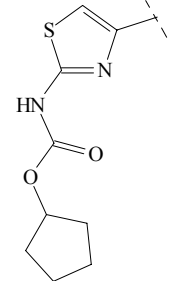
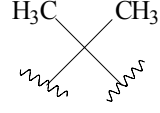
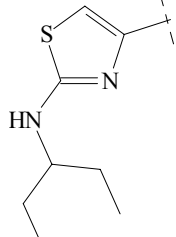
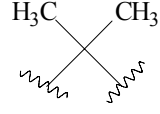
в которой R¹, R², R⁷ и R⁸ определяют следующим образом:

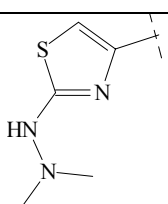
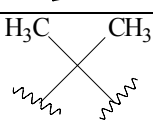
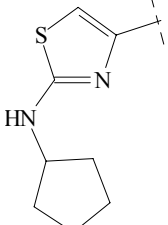
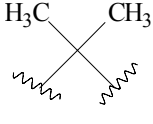
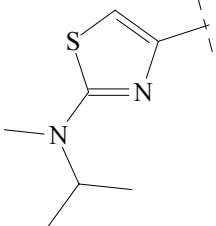
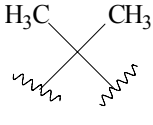
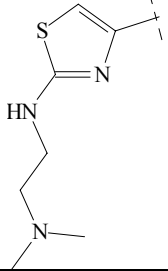
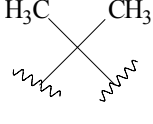
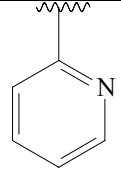
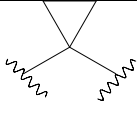
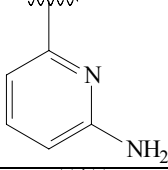
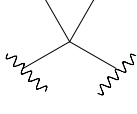
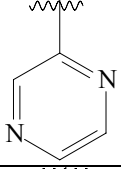
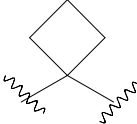
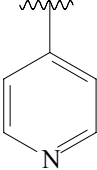
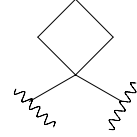
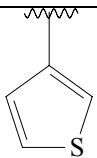
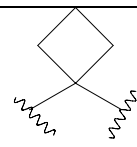
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6001	CH ₃			;
6002	CH ₃			;

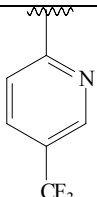
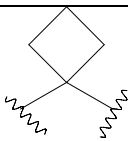
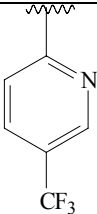
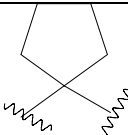
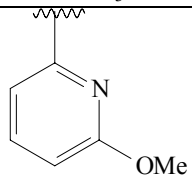
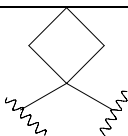
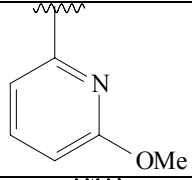
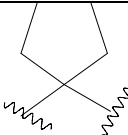
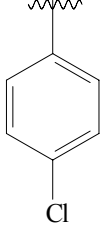
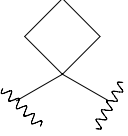
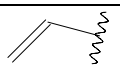
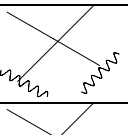
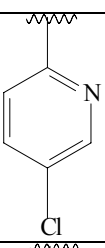
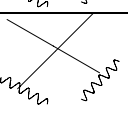
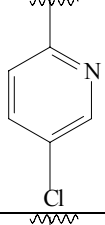
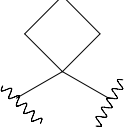
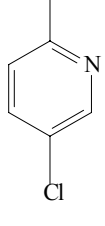
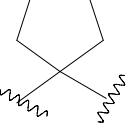
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6003	CH ₃			;
6004	CH ₃			;
6005	CH ₃			;
6006	CH ₃			;
6007	CH ₃			;
6008	CH ₃			;
6009	CH ₃			;
6010	CH ₃			;
6011	CH ₃			;

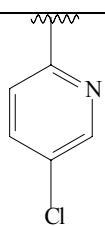
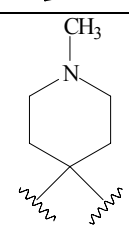
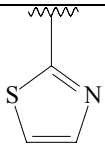
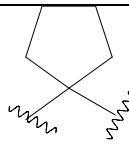
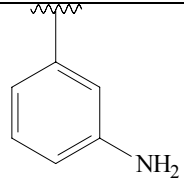
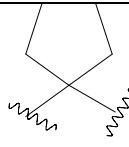
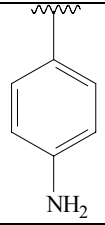
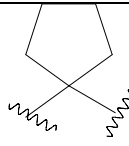
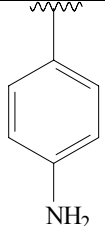
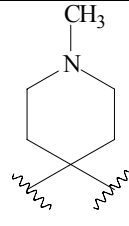
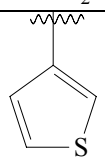
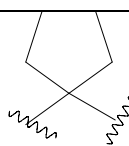
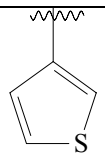
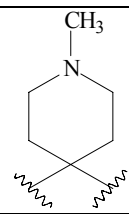
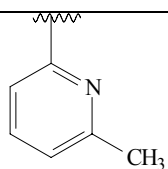
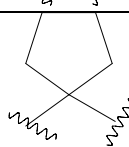
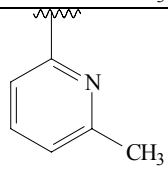
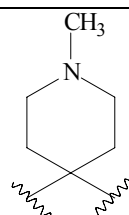
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6012	CH ₃			;
6013	CH ₃			;
6013	CH ₃			;
6014	CH ₃			;
6015	CH ₃			;
6016	CH ₃			;
6017	CH ₃			;
6018	CH ₃			;

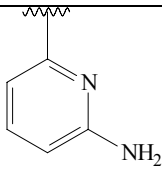
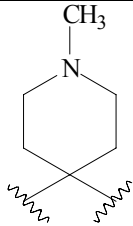
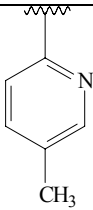
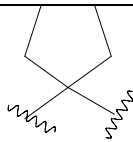
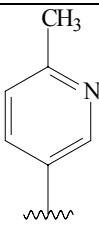
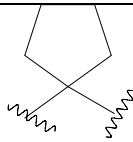
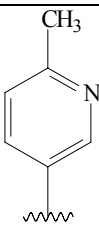
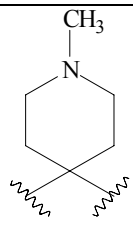
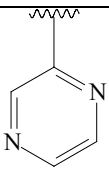
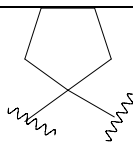
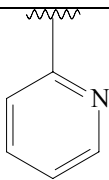
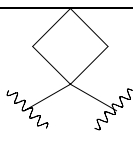
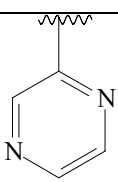
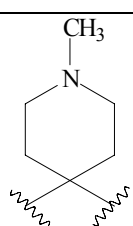
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6019	CH ₃			;
6020	CH ₃			;
6021	CH ₃			;
6022	CH ₃			;
6023	CH ₃			;
6024	CH ₃			;

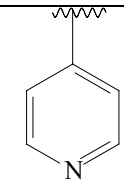
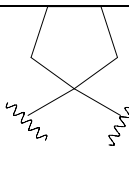
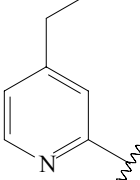
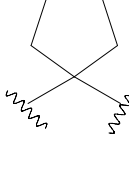
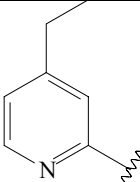
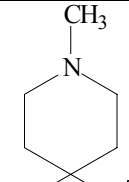
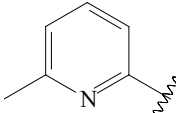
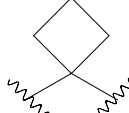
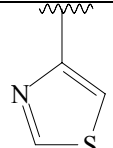
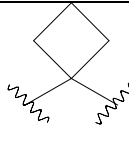
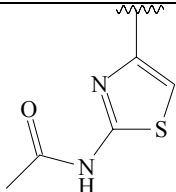
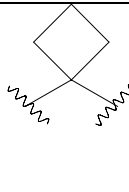
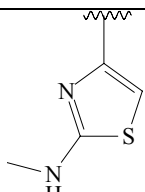
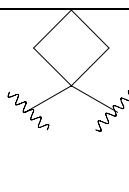
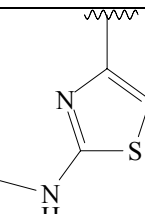
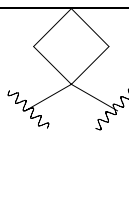
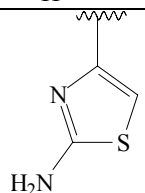
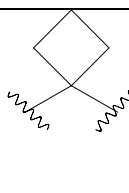
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6025	CH ₃			;
6026	CH ₃			;
6027	CH ₃			;
6028	CH ₃			;
6029	CH ₃			;
6030	CH ₃			;
6031	CH ₃			;

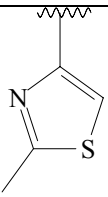
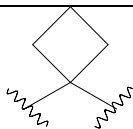
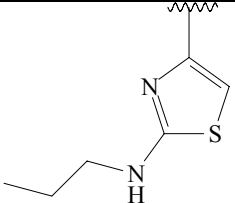
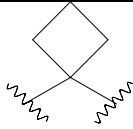
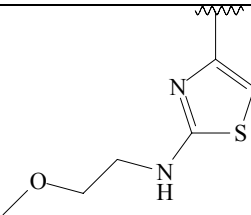
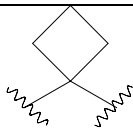
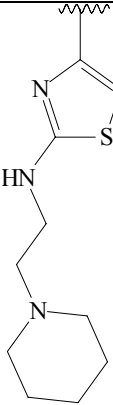
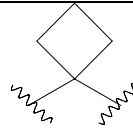
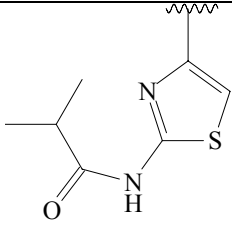
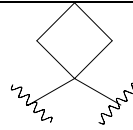
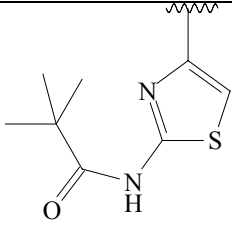
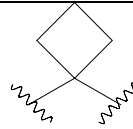
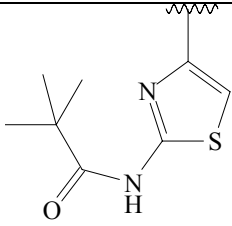
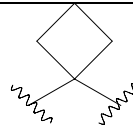
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6032	CH ₃			;
6033	CH ₃			;
6034	CH ₃			;
6035	CH ₃			;
6036	CH ₃			;
6037	CH ₃			;
6038	CH ₃			;
6039	CH ₃			;
6040	CH ₃			;

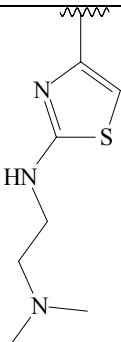
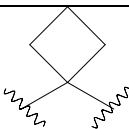
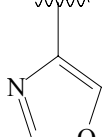
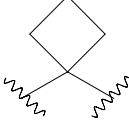
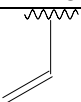
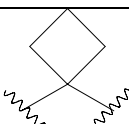
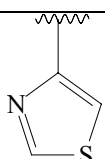
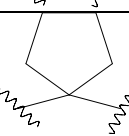
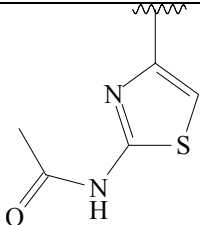
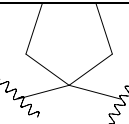
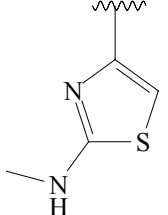
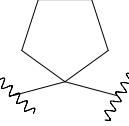
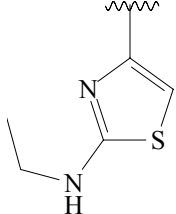
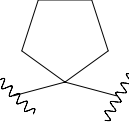
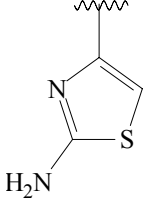
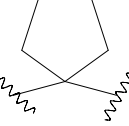
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6041	CH ₃			;
6042	CH ₃			;
6043	CH ₃			;
6044	CH ₃			;
6045	CH ₃			;
6046	CH ₃			;
6047	CH ₃			;
6048	CH ₃			;
6049	CH ₃			;

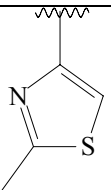
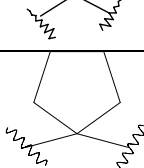
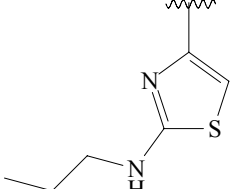
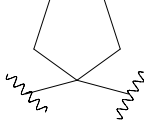
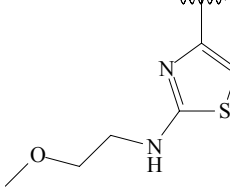
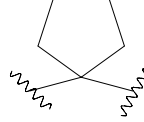
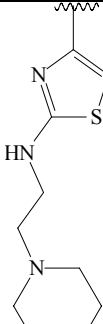
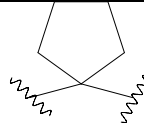
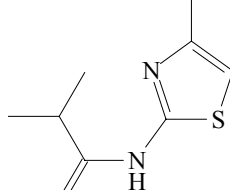
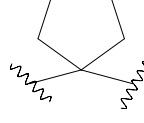
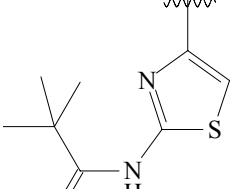
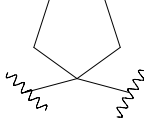
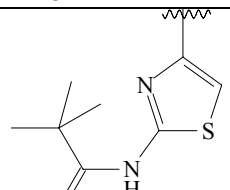
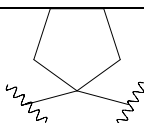
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6050	CH ₃			;
6051	CH ₃			;
6052	CH ₃			;
6053	CH ₃			;
6054	CH ₃			;
6055	CH ₃			;
6056	CH ₃			;
6057	CH ₃			;
6058	CH ₃			;

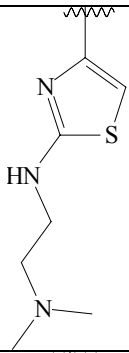
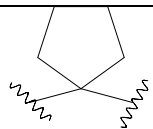
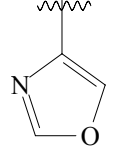
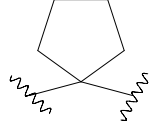
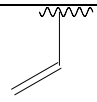
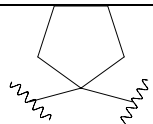
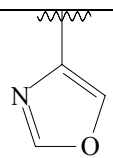
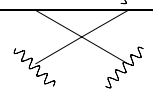
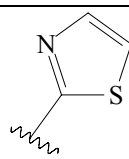
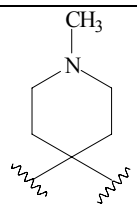
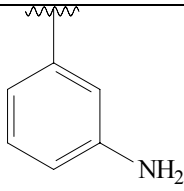
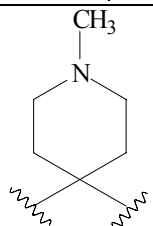
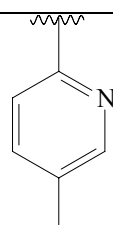
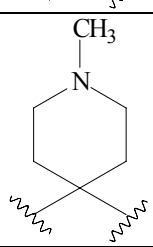
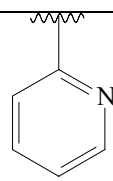
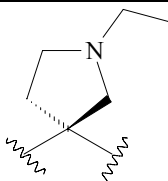
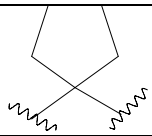
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6059	CH ₃			;
6060	CH ₃			;
6061	CH ₃			;
6062	CH ₃			;
6063	CH ₃			;
6064	CH ₃			;
6065	CH ₃			;

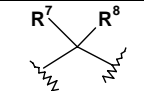
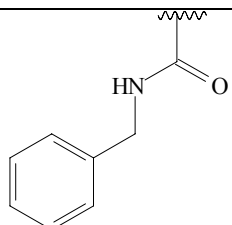
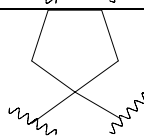
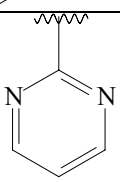
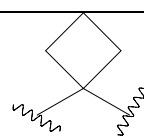
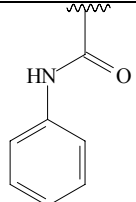
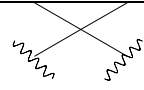
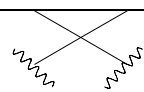
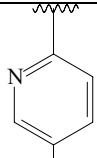
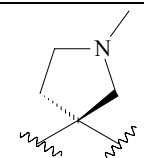
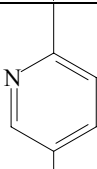
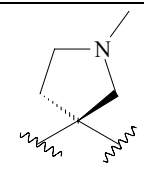
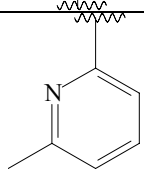
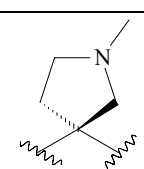
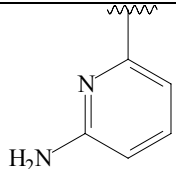
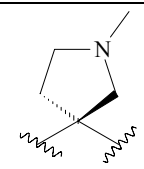
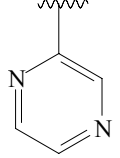
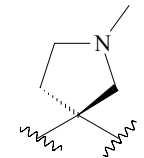
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6066	CH ₃			;
6067	CH ₃			;
6068	CH ₃			;
6069	CH ₃			;
6070	CH ₃			;
6071	CH ₃			;
6072	CH ₃			;
6073	CH ₃			;
6074	CH ₃			;

Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6075	CH ₃			;
6076	CH ₃			;
6077	CH ₃			;
6078	CH ₃			;
6079	CH ₃			;
6080	CH ₃			;
6081	CH ₃			;

Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6082	CH ₃			;
6083	CH ₃			;
6084	CH ₃			;
6085	CH ₃			;
6086	CH ₃			;
6087	CH ₃			;
6088	CH ₃			;
6089	CH ₃			;

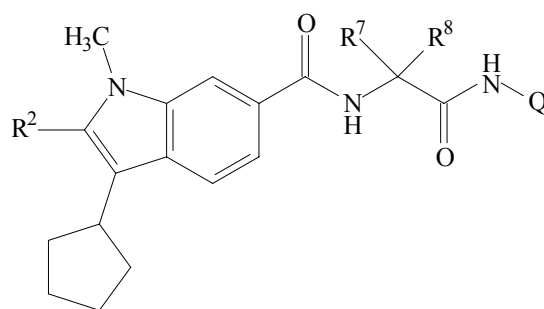
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6090	CH ₃			;
6091	CH ₃			;
6092	CH ₃			;
6093	CH ₃			;
6094	CH ₃			;
6095	CH ₃			;
6096	CH ₃			;

Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6097	CH ₃			;
6098	CH ₃			;
6099	CH ₃			;
6100	CH ₃			;
6101	CH ₃			;
6102	CH ₃			;
6103	CH ₃			;
6105	CH ₃			;
6106	CH ₃	CONHCHH ₃		;

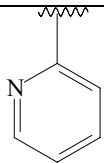
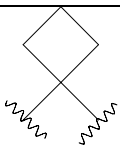
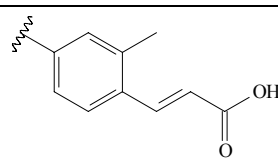
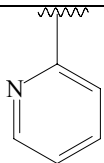
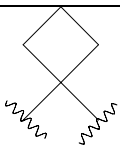
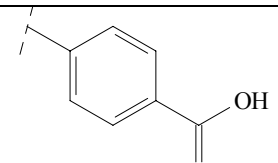
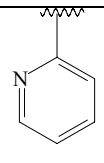
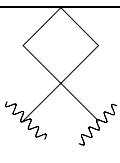
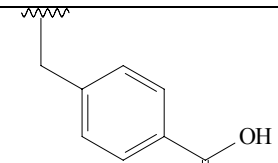
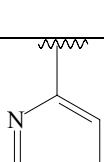
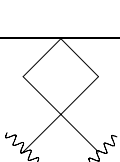
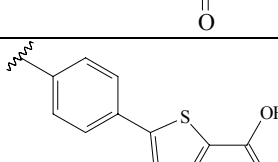
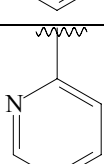
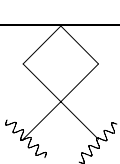
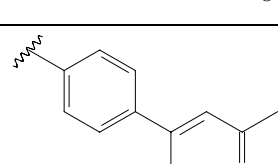
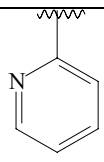
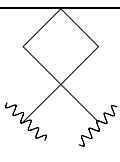
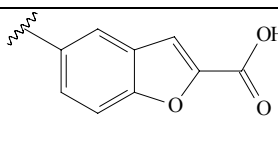
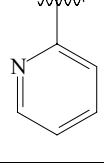
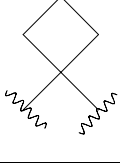
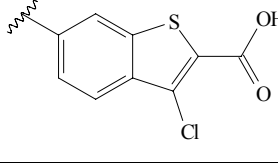
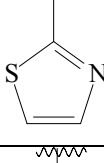
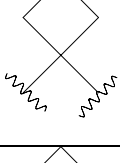
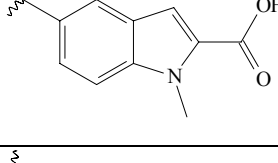
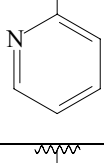
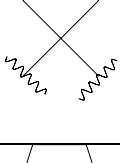
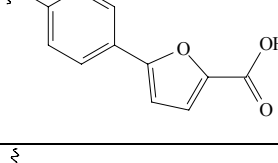
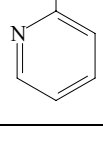
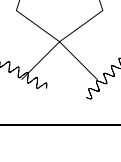
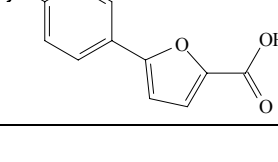
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6107	CH ₃	CON(CH ₃) ₂		;
6110	CH ₃			;
6111	CH ₃			;
6112	CH ₃			;
6113	CH ₃	CONH ₂		;
6114	CH ₃			;
6115	CH ₃			;
6116	CH ₃			;
6117	CH ₃			;
6118	CH ₃			;

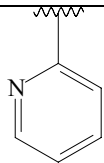
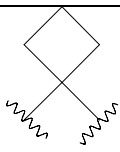
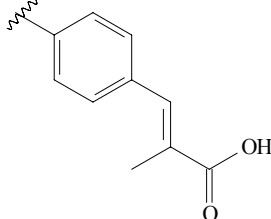
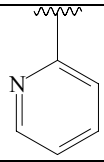
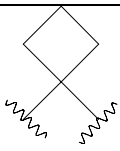
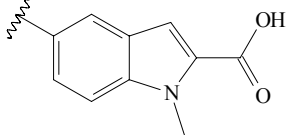
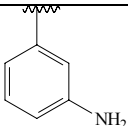
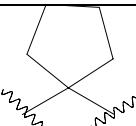
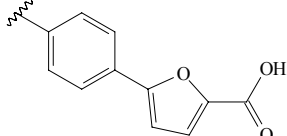
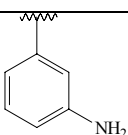
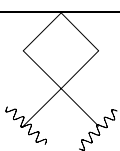
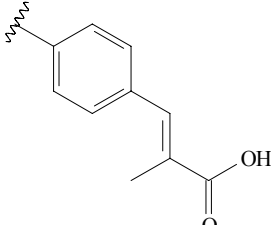
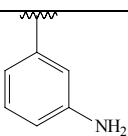
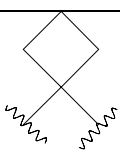
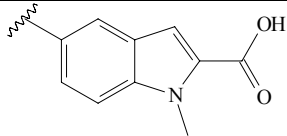
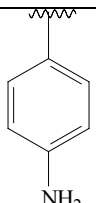
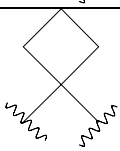
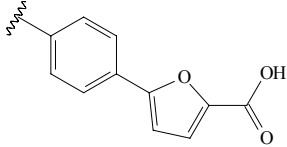
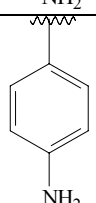
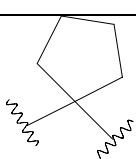
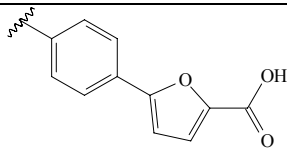
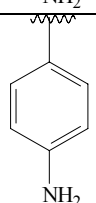
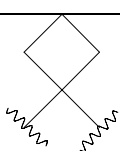
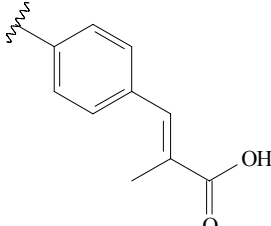
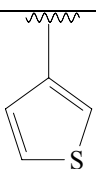
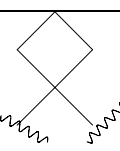
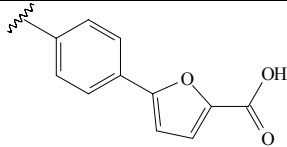
Номер соединения	R ¹	R ²	R ⁷ R ⁸	
6119	CH ₃	H		;
6120	CH ₃	Br		;
6121	H			;
6122	CH ₃			;
6123	CH ₃			;
6124	CH ₃			; и
6125	CH ₃			.

40. Соединение формулы по п.1:

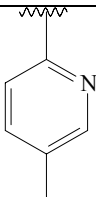
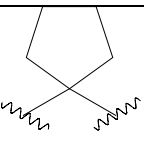
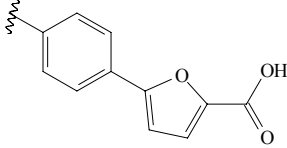
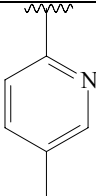
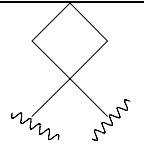
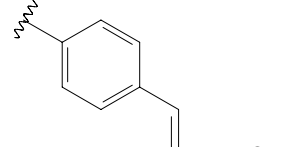
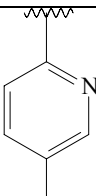
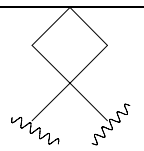
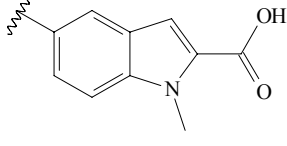
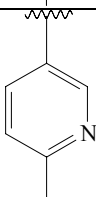
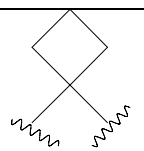
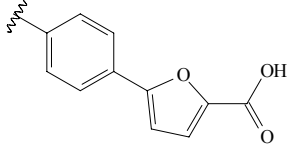
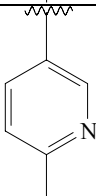
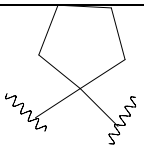
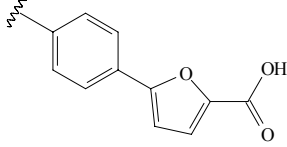
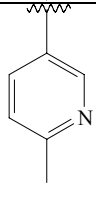
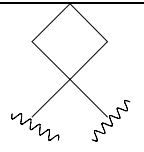
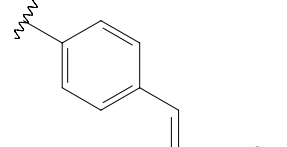
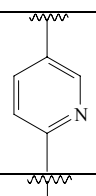
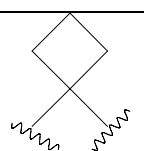
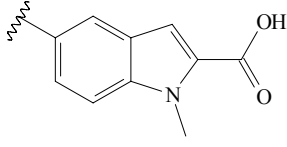
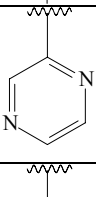
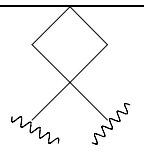
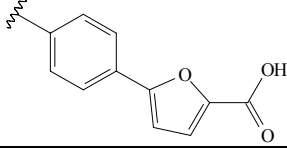
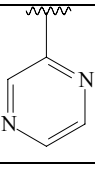
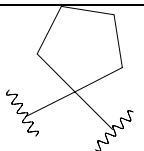
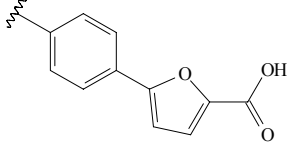


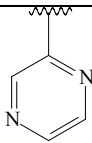
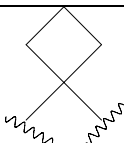
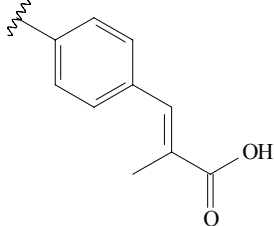
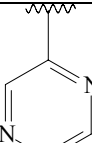
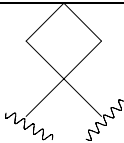
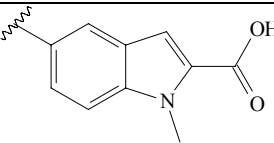
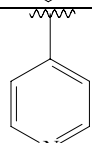
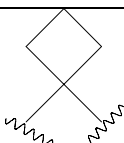
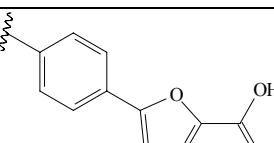
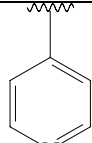
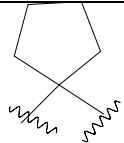
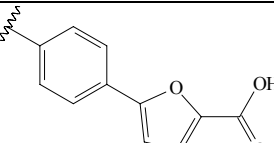
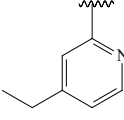
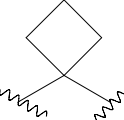
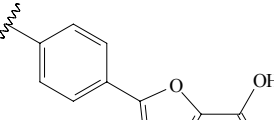
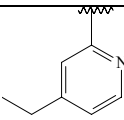
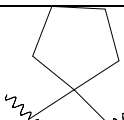
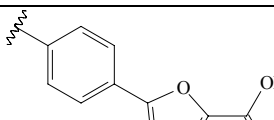
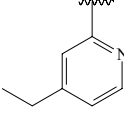
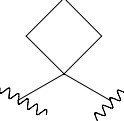
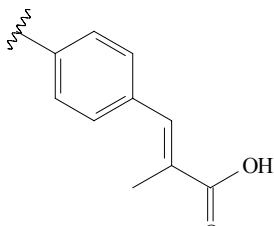
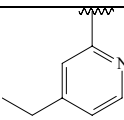
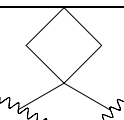
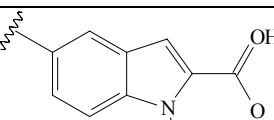
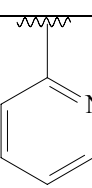
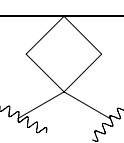
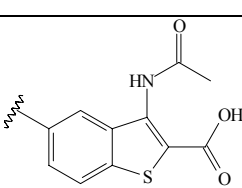
где R², R⁷, R⁸ и Q определяют следующим образом:

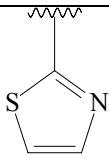
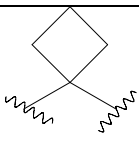
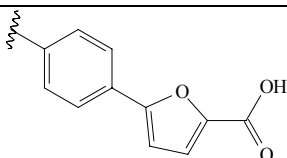
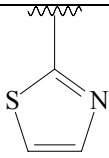
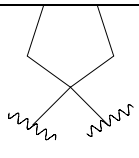
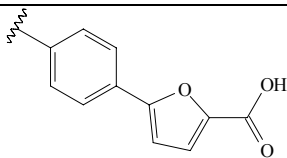
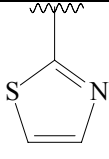
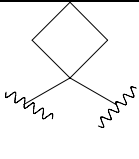
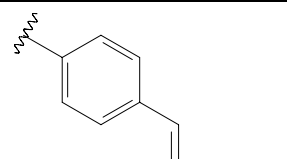
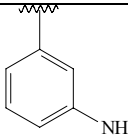
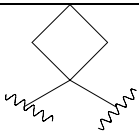
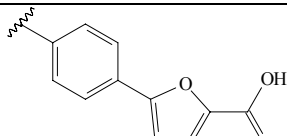
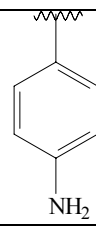
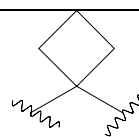
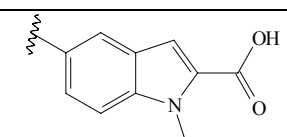
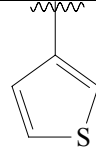
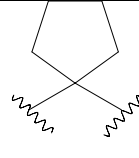
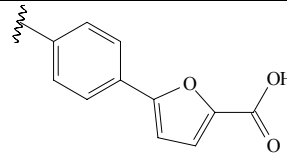
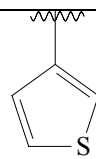
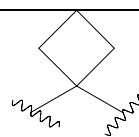
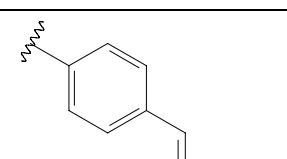
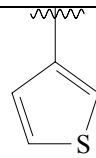
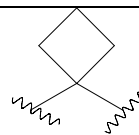
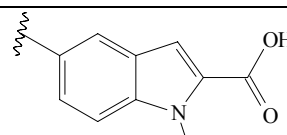
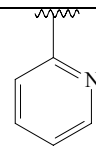
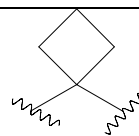
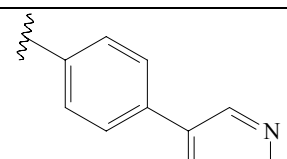
Номер соединения	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7001				;
7002				;
7003				;
7004				;
7005				;
7006				;
7007				;
7008				;
7009				;
7010				;

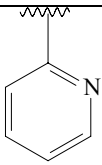
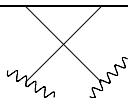
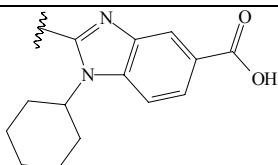
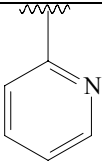
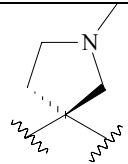
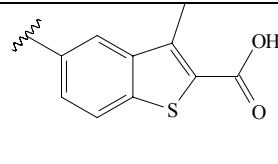
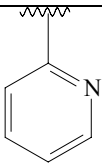
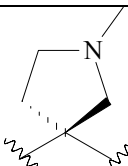
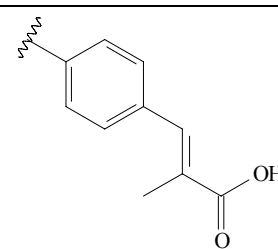
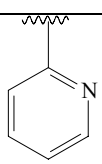

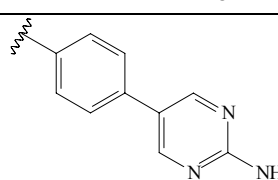
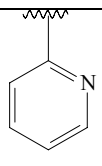
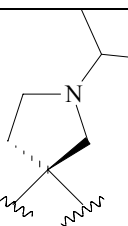
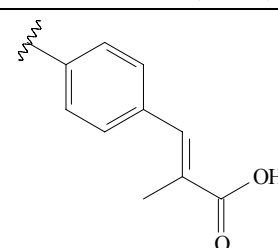
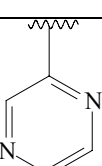
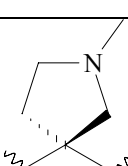
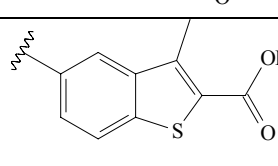
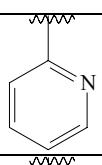
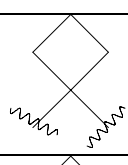
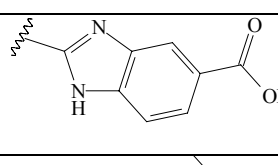
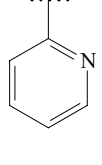
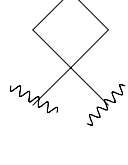
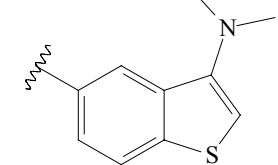
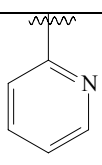
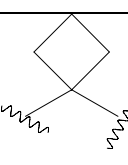
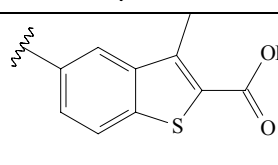
Номер соединения	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7011				;
7012				;
7013				;
7014				;
7015				;
7016				;
7017				;
7018				;
7019				;

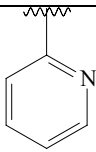
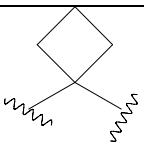
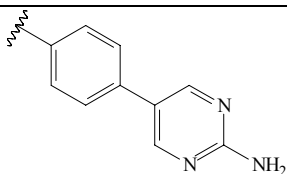
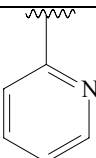
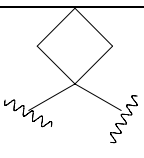
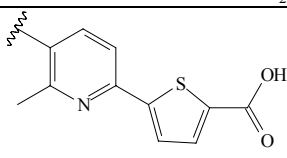
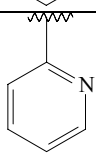
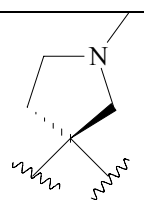
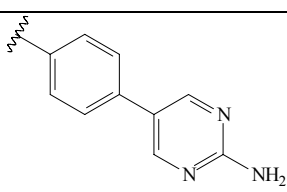
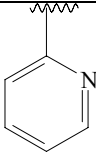
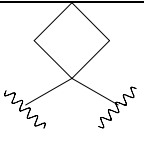
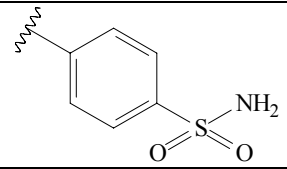
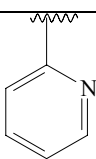
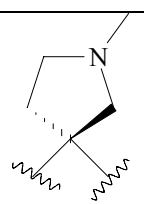
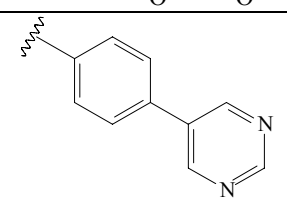
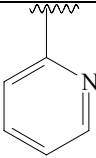
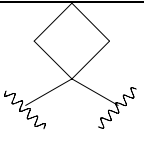
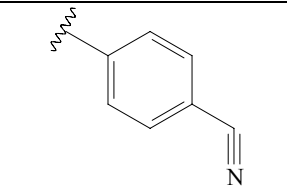
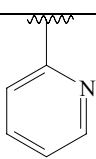
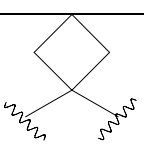
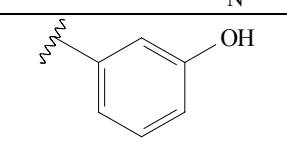
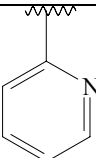
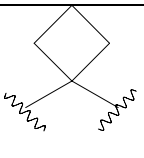
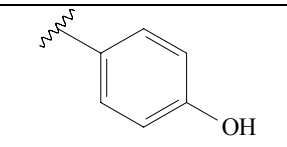
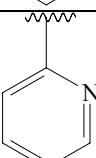
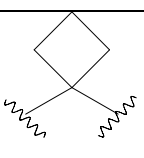
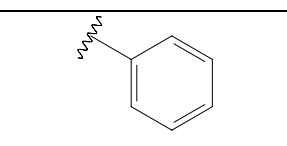
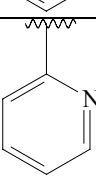
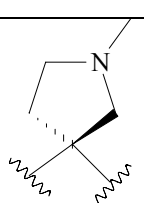
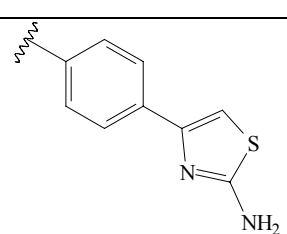
Номер соединения	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7020				;
7021				;
7022				;
7023				;
7024				;
7025				;
7026				;
7027				;
7028				;

Номер соединения	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7029				;
7030				;
7031				;
7032				;
7033				;
7034				;
7035				;
7036				;
7037				;

Номер соединения	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7038				;
7039				;
7040				;
7041				;
7042				;
7043				;
7044				;
7045				;
7046				;

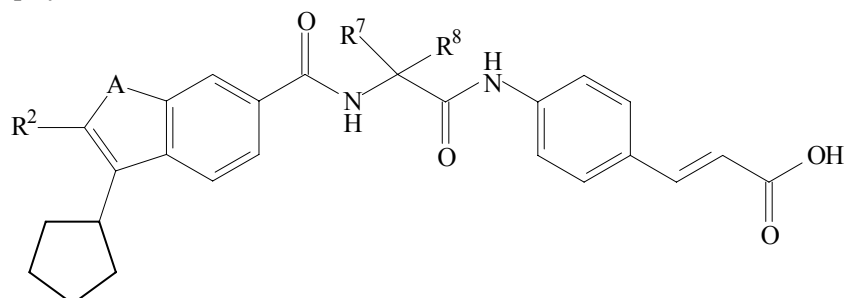
Номер соединения	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7047				;
7048				;
7049				;
7050				;
7051				;
7052				;
7053				;
7054				;
7055				;

Номер соединения	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7056				;
7057				;
7058				;
7059				;
7060				;
7061				;
7062				;
7063				;
7064				;

Номер соединения	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7065				;
7066				;
7067				;
7068				;
7069				;
7070				;
7071				;
7072				;
7073				;
7075				;

Номер соединения	R ²	R ⁷ R ⁸	Q	
7076				;
7077				;
7078				;
7079				;
7080				;
7081				;
7082				; и
7083				.

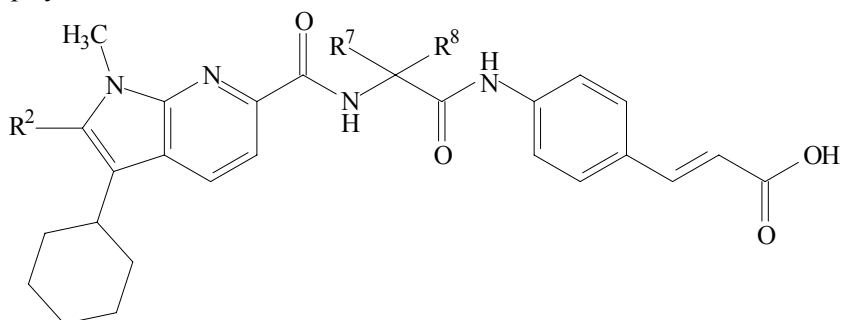
41. Соединение формулы по п. 1:



в которой А, R², R⁷ и R⁸ определяют следующим образом:

Номер соединения	A	R ²	R ⁷ R ⁸	
8001	S			;
8002	S			;
8003	S			;
8004	S			;
8005	O			; и
8006	O			.

42. Соединение формулы по п. 1:



в которой R², R⁷ и R⁸ определяют следующим образом:

Номер соединения	R ²	R ⁷ R ⁸	
9001			; и

9002			
------	---	---	--

43. Соединение формулы I по п. 1 или его фармацевтически приемлемая соль в качестве ингибитора РНК-зависимой РНК-полимеразной активности NS5B-фермента, кодируемого вирусом гепатита С (HCV).

44. Соединение формулы I по п. 1 или фармацевтически приемлемая соль этого соединения в качестве ингибитора репликации вируса гепатита С.

45. Фармацевтическая композиция для ингибирования репликации вируса гепатита С, включающая эффективное количество соединения формулы I по п. 1 или фармацевтически приемлемой соли этого соединения и фармацевтически приемлемый носитель.

46. Композиция по п. 45, дополнительно включающая иммуномодулирующий агент.

47. Композиция по п. 46, в котором указанные иммуномодулирующие агенты выбраны из группы, включающей α -, β -, δ - γ - и ω -интерферон.

48. Композиция по п. 45, дополнительно включающая другой противовирусный агент.

49. Композиция по п. 48, в котором указанный противовирусный агент выбран из рибавирина и амантадина.

50. Композиция по п. 45, дополнительно включающая еще один ингибитор полимеразы вируса гепатита С.

51. Композиция по п. 45, дополнительно включающая ингибитор хеликазы вируса гепатита С, протеазы вируса гепатита С, металлопротеазы вируса гепатита С или HCV IRES (IRES *от англ. Internal Ribosome Entry Site* - внутренний сайт входа рибосомы).

C 08

(11) IAP 03636

(51) 8 C 08 J 5/18

(21) IAP 2006 0176

(31)(32)(33) 10354732.0, 21.11.2003, DE

(71)(73) ЛУРГИ ЦИММЕР ГмбХ, DE

(72) ЭРХАРДТ, Вернер, DE

(85) 19.05.2006

(86) PCT/EP 2004/011231, 08.10.2004

(87) WO 2005/052039, 09.06.2005

(54) ПЭТ-пленкаларни олиш усули

Способ получения ПЭТ-пленок

(13) C

(22) 08.10.2004

(57) 1. Полиэтилентерефталат эритмаси валокка ўтказиладиган ва олинган пленка узунасига йўналишда тортиладиган, қайта ишланаётган эритма полиэтилентерефталатнинг гомополимери ёки сополимеридан таркиб топган, бундаги сополимер полиэтилентерефталатнинг такрорланувчи бўғинларини ҳисобга олмаганда, полиэтилентерефталатнинг барча такрорланувчи бўғинларидан, 1,3-пропандиол, 1,4-бутандиол, диэтиленгликоль, триэтиленгликоль, 1,4-циклогександиметанол, полиэтилентерефталатнинг изофтал кислотаси ва ёки адипин кислотасининг такрорланувчи бўғинларидан 15 моль% гачасини ўз ичига олган полиэтилентерефталатлар гуруҳидан танланган, ПЭТ-пленкаларни олиш усули шу билан ф а р қ л а н а д и к и, эритмада иштирок этувчи полиэтилентерефталатни олиш учун эритма таркибидеги полиэтилентерефталатнинг тўлиқ оғирлигининг млн.га нисбатан 50 дан 300 қисмларгача концентрациядаги тармоқлаш агентидан фойдаланилади, бунда тармоқлаш агенти камида 3 функционал гуруҳли спиртдан иборат.

2. 1-банд бўйича усул, шу билан ф а р қ л а н а д и к и, спирт пентаэритритдан иборат.

3. Юқоридаги бандларнинг камида бири бўйича усул шу билан ф а р қ л а н а д и к и, полиэтилентерефталат эритмасини валокка ўтказиш йўли билан олинган пленка қалинлиги 3 дан 500 мкмгачани ташкил қилади.

4. Юқоридаги бандларнинг камида бири бўйича усул шу билан ф а р қ л а н а д и к и, полиэтилентерефталат эритмаси ўтказиладиган валок тезлиги 80 дан 140 м/мингача, асосан 90 дан 120 м/мингачаси ни ташкил қилади.

5. Юқоридаги бандларнинг камида бири бўйича усул шу билан ф а р қ л а н а д и к и, полиэтилентерефталат эритмасини валокка ўтказиш йўли билан олинган пленка 200 дан 600 м/мингача, асосан 270 до 400 м/мингача интервалдаги тезлик билан узунасига йўналишда тортилади.

6. Юқоридаги бандларнинг камида бири бўйича усул шу билан ф а р қ л а н а д и к и, полиэтилентерефталат эритмасини валокка ўтказиш йўли билан олинган пленка, узунасига йўналишда тортилади.

7. 1-6-бандларнинг ҳар қайсиси бўйича олинган пленка.

8. 7-банд бўйича пленка, шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у она имеет толщину в интервале от 1 дан 350 мкмгача интервалдаги қалинликка эга.

1. Способ получения ПЭТ-пленок, в котором расплав полиэтилентерефталата переносят на валок и полученную пленку вытягивают в продольном направлении, причем перерабатываемый расплав содержит гомополимер или сополимер полиэтилентерефталата, где сополимер выбран из группы полиэтилентерефталатов, которые, не считая повторяющихся звеньев полиэтилентерефталата, содержат также до 15 моль% от всех повторяющихся звеньев полиэтилентерефталата, повторяющихся звеньев 1,3-пропандиола, 1,4-бутандиола, диэтиленгликоля, триэтиленгликоля, 1,4-циклогександиметанола, полиэтиленгликоля, изофталевой кислоты и/или адипиновой кислоты, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что для получения полиэтилентерефталата, присутствующего в расплаве, используют агент разветвления в концентрации от 50 до 300 частей на миллион от полного веса полиэтилентерефталата, содержащегося в расплаве, причем агент разветвления представляет собой спирт с по меньшей мере 3 функциональными группами.

2. Способ по п. 1, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что спирт является пентаэритритом.

3. Способ по меньшей мере по одному из предыдущих пунктов, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что толщина пленки, которая была получена путем переноса расплава полиэтилентерефталата на валок, составляет от 3 до 500 мкм.

4. Способ по меньшей мере по одному из предыдущих пунктов, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что скорость валка, на который переносят расплав полиэтилентерефталата, составляет от 80 до 140 м/мин, особенно предпочтительно от 90 до 120 м/мин.

5. Способ по любому одному из предыдущих пунктов, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что пленку, которая была получена путем переноса расплава полиэтилентерефталата на валок, вытягивают в продольном направлении со скоростью в интервале от 200 до 600 м/мин, особенно предпочтительно от 270 до 400 м/мин.

6. Способ по любому одному из предыдущих пунктов, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что пленку, которая была получена путем переноса расплава полиэтилентерефталата на валок, вытягивают в поперечном направлении.

7. Пленка, получаемая по любому из способов по пп. 1-6.

8. Пленка по п. 7, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что она имеет толщину в интервале от 1 до 350 мкм.

Е бўлим ҚУРИЛИШ; ТОҒ ИШЛАРИ

Раздел Е СТРОИТЕЛЬСТВО; ГОРНОЕ ДЕЛО

Е 04

(11) IAP 03637

(13) С

(51) 8 E 04 C 5/00

(21) IAP 2006 0184

(22) 29.06.2004

(31)(32)(33) 2003119675, 03.07.2003; 2003126624, 04.09.2003, RU

(71)(73) "Строительство" илмий тадқиқот маркази" Федерал давлат унитар корхонаси, RU

"Западно-Сибирский металлургический комбинат" Очиқ акциядорлик жамияти, RU

Тихонов Игорь Николаевич, RU

Федеральное государственное унитарное предприятие "Научно-исследовательский центр "Строительство", RU

Открытое акционерное общество "Западно-Сибирский металлургический комбинат", RU

Тихонов Игорь Николаевич, RU

(72) Тихонов Игорь Николаевич, Звездов Андрей Иванович, Судаков Геральд Николаевич, Мухамедиев Тахир Абдурахманович, Мешков Владимир Зусьевич, RU; Андрианов Николай Викторович, Бондаренко Александр Николаевич, Маточкин Виктор Аркадьевич, Тищенко Владимир Андреевич, BY

(85) 23.05.2006

(86) PCT/RU 2004/000249, 29.06.2004

(87) WO 2005/003483, 13.01.2005

(54) Даврий шаклда ишланган арматурали ўзак

Арматурный стержень периодического профиля

(57) 1. Думалоқ кесимли сердечникли ва юзасида кия туташмаган ўроксимон кўндаланг дўнгликлари бор даврий профилли арматура стержени шу билан ф а р қ л а н а д и к и, ўроксимон кўндаланг дўнгликлар юзада 140-180°га тенг стерженни β ўраш бурчаги билан жойлаштирилган, ёнма-ён жойлашган кўндаланг дўнгликларнинг чўкқилари стерженнинг ўзаро перпендикуляр ўк юзалари бўйлаб жойлаштирилган, кўндаланг дўнгликларнинг максимал баландлиги hнинг t кадамга нисбати эса, 0,12-0,3га тенг.

2. 1-банд бўйича стержень шу билан ф а р қ л а н а д и к и, кўндаланг дўнгликларнинг нисбий погон юзаси 0,07дан кам эмас.

1. Арматурный стержень периодического профиля с сердечником круглого сечения и наклонными серповидными поперечными выступами на поверхности, от того и с тем, что наклонные серповидные поперечные выступы размещены на поверхности с углом охвата стержня β равным $140-180^\circ$, вершины смежных поперечных выступов размещены во взаимно перпендикулярных осевых плоскостях стержня, а отношение максимальной высоты h поперечного выступа к шагу t составляет $0,12-0,3$.

2. Стержень по п. 1, от того и с тем, что удельная погонная площадь смятия поперечных выступов не менее $0,07$.

E 21

(11) IAP 03638

(51) 8 E 21 B 43/00

(21) IAP 2006 0047

(71)(73) "Muborakneftgas" унитар шуъба корхонаси, UZ

Унитарное дочернее предприятие "Muborakneftgas", UZ

(72) Дивеев Исмаил Исхакович, Назаров Улугбек Султанович, Ли Роберт Чанирович, Шамсиев Шермат Журакулович, Шафиев Рустам Умарович, Турдиев Олим Исмаилович, Беков Ислон Останович, Якубов Нажмидин Мухидинович, Мирзаев Саид Хаитович, Гойибов Батыр Джураевич, Оллобердиев Гайрат Темирович, Конеев Марат Рустамович, Лайшев Алексей Владимирович, Валиев Марат Рашидович, Шарипов Анвар Хакимович, Кужбанова Вазира Джарылгасовна, UZ

(54) Нефтьгазконденсат конларини ишлатиш усули

Способ разработки нефтегазконденсатной залежи

(57) Газконденсат ва нефть қатламларини перфорация қилишни ва нефть ва газни ажратиш олишни ўз ичига олган нефтьгазконденсат конларини ишлатиш усули шу билан фарқланадики, нефть ва газконденсат қисмининг перфорацияси ягона фильтр билан амалга оширилади, нефть ва газни қазиб олиш эса, бир вақтнинг ўзида қувур ва қувурдан ташқаридаги ҳудуд бўйлаб амалга оширилади, шунинг билан бирга нефть қисмининг перфорацияси газ билан нефть қўшилган чегаранинг пастроғидан, газ қисминики эса – газ билан нефть қўшилган чегарада қувурни газлифт эксплуатация қилиш учун амалга оширилади, бунда қувур макони бўйлаб келадиган нефтьгазсув аралашмаси уюрма камерага йўналтири-

лади, у ерда тиндириш сизимига йўналтириладиган нефть сув аралашмасига ва қувурдан ташқаридаги ҳудуддан келадиган газ нефть аралашмаси билан бириктириладиган газга ажратилади, олинган аралашма чиқишида алоҳида газ ва нефть олинадиган сепаратор орқали ўтказилади.

Способ разработки нефтегазконденсатной залежи, включающий перфорацию газоконденсатного и нефтяного пластов, отбор нефти и газа, от того и с тем, что перфорацию нефтяной и газоконденсатной части осуществляют единым фильтром, а добычу нефти и газа осуществляют одновременно по трубному и затрубному пространству, причем перфорацию нефтяной части осуществляют ниже границы газонефтяного контакта, газоносной части – на границе газонефтяного контакта для осуществления газлифтной эксплуатации скважины, при этом нефтегазоводяную смесь, поступающую по трубному пространству, направляют в вихревую камеру, где разделяют на нефтеводяную смесь, которую направляют в отстойную емкость, и газ, который объединяют с газонефтяной смесью, поступающей по затрубному пространству, полученную смесь пропускают через сепаратор, на выходе которого получают нефть и газ раздельно.

F бўлим

**МЕХАНИКА; ЁРИТИШ; ИСИТИШ;
ДВИГАТЕЛЛАР ВА НАСОСЛАР;
ПОРТЛАТИШ ИШЛАРИ**

Раздел F

**МЕХАНИКА; ОСВЕЩЕНИЕ; ОТОПЛЕНИЕ;
ДВИГАТЕЛИ И НАСОСЫ;
ВЗРЫВНЫЕ РАБОТЫ**

F 03

(11) IAP 03639

(51) 8 F 03 B 13/00

(21) IAP 2004 0384

(71) Тошкент давлат техника университети, UZ
Ташкентский государственный технический университет, UZ

(72) Мухаммадиев Мурадулла, Уришев Боборхим Уришевич, UZ

(73) Мухаммадиев Мурадулла, UZ

(54) Эркин окимли кичик микрогидроэлектростанция

Свободнопоточная микрогидроэлектростанция

(13) C

(22) 14.10.2004

(57) Таркибига мультипликатор орқали генератор билан кинематик боғланган понтонлар ва ишчи ғилдираклар кирган эркин оқимли микрогидроэлектростанция, шу билан ф а р қ л а н а д и к и, понтонлар оқим йўналтирувчи қанотлар билан таъминланган ва сув қуювчилар билан уланганлар, бунда ишчи ғилдираклар ковшли парраклар билан бирга сув қуювчиларнинг пастки қисмига ўрнатилган, мультипликатор ва генератор эса, марказий понтон устига ишчи ғилдираклар ўқиға баравар қилиб монтаж қилинган.

Свободнопоточная микрогидроэлектростанция, содержащая понтоны и рабочие колеса, кинематически связанные через мультипликатор с генератором, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что понтоны снабжены потоконаправляющими крыльями и соединены водосливами, при этом рабочие колеса с ковшовыми лопастями установлены в нижней части водосливов, а мультипликатор и генератор смонтированы на центральном понтоне на уровне оси рабочих колес.

Г бўлим ФИЗИКА

Раздел Г ФИЗИКА

Г 05

(11) IAP 03640 (13) C
(51) 8 G 05 D 7/00, G 05 D 7/06, G 05 D 9/00, D 02 B 7/20

(21) IAP 2006 0230 (22) 23.06.2006
(71)(73) "Сигма Автоматика" масъулияти чекланган жамияти, UZ

Общество с ограниченной ответственностью "Сигма Автоматика", UZ

(72) Тюменев Рустэм Мустафович, Василенко Сергей Николаевич, Толстунов Михаил Юрьевич, Сметанин Юрий Николаевич, UZ

(54) Гидротехник иншоотларида сув сарфлашини автоматик тарзда тақсимлаш ва ўлчаш қурилмаси
Устройство для измерения и автоматического регулирования расхода воды в гидротехническом сооружении

(57) Таркибига реверсивли электрузатгич, затвор ҳолати датчиги ва бошқариш блокига уланган затвор, юқори бьеф даражаси датчиги, илдизни чиқариш блоки, сув сарфини интеграциялаш бло-

ки, диспетчер пулти кирган гидротехник иншоотларида сув сарфлашини автоматик тарзда тақсимлаш ва ўлчаш қурилмаси шу билан ф а р қ л а н а д и к и, қурилма биринчи ва иккинчи кириш қисми мос равишда юқори бьеф даражаси датчиги ва затвор ҳолати датчигига уланган затвор очилиши катталигини юқори бьеф даражасига нисбатини ўлчаш блокини ўз ичига олиб, затвор очилиши катталигини юқори бьеф даражасига нисбатини ўлчаш блокиннинг чиқиш қисми вертикал сиқилиш коэффициентини ўлчаш блоки орқали иккинчи кириш қисмига затвор ҳолати датчигининг чиқиш қисми уланган қисилган кесимдаги чуқурликни ўлчаш блокига уланган, қисилган кесимдаги чуқурликни ўлчаш блокиннинг чиқиш қисми бошқа кириш қисмига юқори бьеф даражаси датчигининг чиқиши уланган босимни ўлчаш блоки кириш қисларининг бирига уланган, босимни ўлчаш блокиннинг чиқиш қисми ён томон сиқилиш коэффициентини ҳисоблаш блоки орқали сув сарфини ҳисоблаш блокиннинг биринчи кириш қисмига, илдизни чиқариш блоки орқали эса сув сарфини ҳисоблаш блокиннинг иккинчи кириш қисмига уланган, сув сарфини ҳисоблаш блокиннинг учинчи ва тўртинчи кириш қисмларига мос равишда вертикал сиқилиш коэффициенти ўлчаш блокиннинг чиқиш қисми ва затвор ҳолати датчигининг чиқиш қисми уланган, сув сарфини ҳисоблаш блокиннинг чиқиш қисми сув сарфини номувофиклаштириш блокиннинг биринчи кириш қисми ва автоматик регулятор орқали затвор электрузатгичига уланган, сув сарфини номувофиклаштириш блокиннинг иккинчи кириш қисмига сув сарфи задатчиги уланган, сув сарфини интеграциялаш блокиннинг биринчи кириш қисмига сув сарфини ҳисоблаш блокиннинг чиқиш қисми уланган, сув сарфини интеграциялаш блокиннинг иккинчи кириш қисмига вақтни интеграциялаш задатчиги уланган, сув сарфини интеграциялаш блокиннинг чиқиш қисмига оқимни акс эттириш блоки уланган, сув сарфини ҳисоблаш блокиннинг чиқиш қисмига сув сарфини акс эттириш блоки уланган.

Устройство для измерения и автоматического регулирования расхода воды в гидротехническом сооружении, содержащее затвор с подключенным к нему реверсивным электроприводом, датчиком положения затвора и блоком регулирования, датчик уровня верхнего бьефа, блок извлечения корня, блок интегрирования расхода, пульт диспетчера, о т л и ч а ю щ е е с я тем, что устройство содержит блок вычисления

отношения величины открытия затвора к уровню верхнего бьефа, первый и второй входы которого подключены соответственно к датчику уровня верхнего бьефа и датчику положения затвора, выход блока вычисления отношения величины открытия затвора к уровню верхнего бьефа через блок вычисления коэффициента вертикального сжатия подключен к первому входу блока вычисления глубины в сжатом сечении, ко второму входу которого подключен выход датчика положения затвора, выход блока вычисления глубины в сжатом сечении подключен к одному из входов блока вычисления напора, к другому входу которого подключен выход датчика уровня верхнего бьефа, выход блока вычисления напора через блок вычисления коэффициента бокового сжатия подключен к первому входу блока вычисления расхода, а через блок извлечения корня - ко второму входу блока вычисления расхода, к третьему и четвертому входам блока вычисления расхода подключены соответственно выход блока вычисления коэффициента вертикального сжатия и выход датчика положения затвора, выход блока вычисления расхода через первый вход блока рассогласования и автоматический регулятор подключен к электроприводу затвора, ко второму входу блока рассогласования подключен задатчик расхода, первый вход блока интегрирования расхода подключен к выходу блока вычисления расхода, ко второму входу блока интегрирования расхода подключен задатчик интервала времени интегрирования, к выходу блока интегрирования расхода подключен блок отображения стока, к выходу блока вычисления расхода подключен блок отображения расхода.

G 06

(11) IAP 03641

(13) C

(51) 8 G 06 K 19/077, G 07 C 9/00

(21) IAP 2005 0124

(22) 10.09.2003

(31)(32)(33) 60/409,716, 10.09.2002; 60/409,715, 10.09.2002; 60/429,919, 27.11.2002; 60/433,254, 13.12.2002; 60/484,692, 03.07.2003, US

(71)(73) АйВиАй Смарт Текнолоджис, Инк., US

(72) САИТО, Тамио; АИДА, Такаши; ДРАЙ-ЗИН, Уэйн, US

(85) 08.04.2005

(86) PCT/US 2003/028602, 10.09.2003

(87) WO 04/025545, 25.03.2004

(54) Интеллектуал идентификацион карта

Интеллектуальная идентификационная карта

(57) 1. Таркибига сақланган биометрик маълумотлар учун курилма хотира ва реал вақт масштабида биометрик маълумотларни ўқиш учун курилма датчик, хотира ва датчик билан боғланган, берилган чегара доирасида ўқилган биометрик маълумотларни мос ёзилган назорат маълумотлар билан солиштириш учун микропроцессор кирган интеллектуал идентификация картаси шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у таркибида биометрик маълумотларнинг камида бир қисми бўлган текшириш ахборотини курилма микропроцессор фойдаланадигандан фарқли солиштирма алгоритмдан фойдаланиш билан бирга ўқилган биометрик маълумотларни қўшимча текширишини амалга оширувчи киришни назорат қилишнинг узоклаштирилган тизимига узатиш воситаларини ўз ичига олади, бунда курилма микропроцессор текшириш ахборотини солиштириш натижаси берилган чегара доирасида бўлган ҳолатда генерациялаш имконияти билан бажарилган, текшириладиётган ахборотни узатиш воситалари эса, курилма микропроцессор билан.

2. 1-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у ISO смарт-карта билан бир-бирига мос келади.

3. 2-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у қўшимча равишда курилма микропроцессор билан уланган ISO смарт-карта процессорини ўз ичига олади.

4. 3-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, курилма микропроцессор функционал равишда ISO смарт-карта процессоридан бренд-мауэр билан ажратилган.

5. 3-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, курилма микропроцессор ундан кирувчи ва чиқувчи барча ташқи маълумотларни ISO смарт-карта процессори орқали ўтиш имконияти билан ўрнатилган .

6. 3-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, ISO смарт-карта процессори ундан кирувчи ва чиқувчи барча ташқи маълумотларни курилма микропроцессори орқали ўтиш имконияти билан ўрнатилган.

7. 3-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, курилма микропроцессор иш бошлаш жараёнида маълумотларни киритиш учун биринчи боғланишга ва ташқи тизим билан алоқа қилиш учун иккинчи боғланишга эга.

8. 7-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, биринчи боғланиш ишга тушириш жараёни тугагандан сўнг бажарилган қайтмас узиллишга эга.

9. 4-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у қўшимча равишда магнит тасмали уст-

ки худудга ва нақшли пастки худудга эга, шу билан бирга биометрик датчик бармоқ изи датчигидир, курилма микропроцессор, ISO смарт-карта процессори ва бармоқ изи датчиги устки ва пастки худудлар ўртасидаги ўрта худудда жойлашган.

10. 1-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, биометрик маълумотлар бармоқ изи маълумотларини ўз ичига олади, биометрик маълумотларни ўқиш учун датчик датчик устига қўйилган фойдаланувчининг бармоғидан маълумотларни ўқиш учун бармоқ изи датчигини ўз ичига олади.

11. 10-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, бармоқ изи датчиги фойдаланувчи бармоғининг датчик бўйича ҳаракатланганда бармоқларни унинг устида оптимал жойлашишини таъминлаш учун реал вақт масштабида ҳаракатланувчи тескари алоқани амалга ошириш имконияти билан бажарилган.

12. 10-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, курилма микропроцессор ҳам майда деталларни, ҳам умумий фазовий нисбатларни ҳисобга олиш билан бирга ўқилган билметрик маълумотларни қайта ишлаш имконияти билан бажарилган.

13. 10-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, бармоқ изи датчиги таркибига таянч пластинага таянган кристалл кремний варағи кирган.

14. 13-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, таянч пластина иккита металл қатлами орасига жойлаштирилган стеклоэпоксид композит қатламини ўз ичига олади.

15. 13-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, таянч пластина кремний листини ўраб турувчи ушлагич рамаси билан кучайтирилган.

16. 1-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у қўшимча равишда аввалдан белгиланган жойли картадан фойдаланишни чеклаш воситаларини ўз ичига олади.

17. 16-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, аввалдан белгиланган жойли картадан фойдаланишни чеклаш воситалари спутникли позиционлаш тизимини(GPS) ўз ичига олади. ф а р қ л а н а д и к и, у ўқилган биометрик маълумотларнинг камида бир қисми ва назорат маълумотларининг бир қисмини киришни назорат қилишнинг узоклаштирилган тизимига узатиш имконияти билан бажарилган.

19. 18-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у қўшимча равишда назорат қилишнинг узоклаштирилган тизимидан йўналтирил-

ган сўров символлари кетма-кетлигидан фойдаланувчи сўровга жавоб бериш генераторини, ва сўровга жавобни иловалар серверига узатиш учун сўровга жавоб бериш трансмиттерини ўз ичига олади.

20. 1-банд бўйича карта шу билан ф а р қ л а н а д и к и, у кириш учун бўлган муваффақиятли ва муваффақиятсиз уринишлар ҳақидаги маълумотларни сақлаш имконияти билан бажарилган.

. Интеллектуальная идентификационная карта, содержащая встроенные память для хранения контрольных данных, датчик для считывания биометрических данных в реальном масштабе времени, микропроцессор для сравнения считанных биометрических данных с соответствующими записанными контрольными данными в пределах заданного порога, причем микропроцессор связан с памятью и датчиком, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что она содержит средства передачи проверочного сообщения, содержащего по меньшей мере часть считанных биометрических данных, на удаленную систему контроля доступа, осуществляющую дополнительную проверку считанных биометрических данных с использованием алгоритма сравнения, отличного от используемого встроенным микропроцессором, при этом встроенный микропроцессор выполнен с возможностью генерирования проверочного сообщения в случае, если результат сравнения находится в пределах заданного порога, а средства передачи проверочного сообщения связаны со встроенным микропроцессором.

2. Карта по п. 1, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что она совместима с ISO смарт-картой.

3. Карта по п. 2, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что она дополнительно содержит процессор ISO смарт-карты, соединенный со встроенным микропроцессором.

4. Карта по п. 3, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что встроенный микропроцессор функционально отделен от процессора ISO смарт-карты брендмауэром.

5. Карта по п. 3, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что встроенный микропроцессор установлен с возможностью прохождения всех входящих и выходящих из него внешних данных через процессор ISO смарт-карты.

6. Карта по п. 3, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что процессор ISO смарт-карты установлен с возможностью прохождения всех входящих и выходящих из него внешних данных через встроенный микропроцессор.

7. Карта по п. 3, отличающаяся тем, что встроенный микропроцессор имеет первое соединение для загрузки данных в процессе загрузки и второе соединение для связи с внешней сетью.

8. Карта по п. 7, отличающаяся тем, что первое соединение имеет необратимый разрыв, выполненный после завершения процесса загрузки.

9. Карта по п. 4, отличающаяся тем, что она дополнительно содержит верхнюю область с магнитной полосой и нижнюю область с тиснением, причем биометрический датчик является датчиком отпечатка пальца, а встроенный микропроцессор, процессор ISO смарт-карты и датчик отпечатка пальца расположены в средней области между верхней и нижней областями.

10. Карта по п. 1, отличающаяся тем, что биометрические данные включают данные отпечатка пальца, а датчик для считывания биометрических данных включает датчик отпечатка пальца для считывания данных с пальца пользователя, помещенного на датчик.

11. Карта по п. 10, отличающаяся тем, что датчик отпечатка пальца выполнен с возможностью осуществления действующей в реальном масштабе времени обратной связи при перемещении пальца пользователя по датчику для обеспечения оптимального расположения пальца над ним.

12. Карта по п. 10, отличающаяся тем, что встроенный микропроцессор выполнен с возможностью обработки считанных биометрических данных с учетом как мелких деталей, так и общих пространственных соотношений.

13. Карта по п. 10, отличающаяся тем, что датчик отпечатка пальца содержит лист кристаллического кремния, опирающийся на опорную пластину.

14. Карта по п. 13, отличающаяся тем, что опорная пластина включает слой стеклоксидного композита, расположенного между двумя слоями металла.

15. Карта по п. 13, отличающаяся тем, что опорная пластина усилена рамой держателя, окружающей лист кремния.

16. Карта по п. 1, отличающаяся тем, что она дополнительно содержит средства ограничения использования карты заранее определенным местом.

17. Карта по п. 16, отличающаяся тем, что средства ограничения использования карты зара-

нее определенным местом включают систему спутникового глобального позиционирования (GPS).

18. Карта по п. 1, отличающаяся тем, что она выполнена с возможностью передачи по крайней мере части считанных биометрических данных и части контрольных данных на удаленную систему контроля доступа.

19. Карта по п. 18, отличающаяся тем, что она дополнительно содержит генератор ответа на запрос, использующий последовательность символов запроса, направленных из удаленной системы контроля доступа, и трансмиттер ответа на запрос для передачи ответа на запрос на сервер приложений.

20. Карта по п. 1, отличающаяся тем, что она выполнена с возможностью сохранения данных об успешных и безуспешных попытках доступа.

G 09

(11) IAP 03642

(13) C

(51) 8 G 09 B 23/00

(21) IAP 2006 0014

(22) 16.01.2006

(71)(73) Toshkent tibbiyot akademiyasi, UZ

Ташкентская медицинская академия, UZ

(72) Охунов Алишер Арипович, Иноятова Феруза Хидоятовна, Кутлимуратов Хусин Рустамович, Саттаров Иноят Сапарбаевич, Гуриев Сергей Бексултанович, UZ

**(54) Диабетик ангиопатияни моделлаш усули
Способ моделирования диабетической ангиопатии**

(57) Кимёвий препаратни эфир наркози остида киритишни ўз ичига олган диабетик ангиопатияни моделлаштириш усули шу билан фарқланадк и, кимёвий препарат сифатида 100-110 мг/кг дозада 0,9%-ли NaCl эритмасида доксирубицин киритилади, доксирубицин киритилгандан 48 соат кейин ҳар куни 3 кун мобайнида корин ичига 0,2-0,4 мл 70%-ли сорбитол эритмаси киритилади.

Способ моделирования диабетической ангиопатии, включающий введение под эфирным наркозом химического препарата, отличающийся тем, что в качестве химического препарата вводят 100-110 мг/кг доксирубина в 0,9%-ном

растворе NaCl, а через 48 ч после введения доксирубина ежедневно в течение 3 дней внутривенно вводят 0,2-0,4 мл 70%-ного раствора сорбитола.

Н бўлими ЭЛЕКТР

Раздел Н ЭЛЕКТРИЧЕСТВО

Н 02

(11) IAP 03643

(51) 8 Н 02 К 16/00

(21) IAP 2005 0001

(71)(72)(73) Уманский Самсон Иосифович, UZ

(54) Кўп кутбли секин юривчи электр машинаси

Многополюсная тихоходная электрическая машина

(57) Подшипникларда ўрнатилган вал, ҳар бирининг таркибида пазларда жойлаштирилган обмоткали ўзак, ва улар билан ўзаро ҳаракатланувчи статорлар қаршисига ўрнатилган икки қисқа туташган роторлари бор, бир турдаги ўқма-ўқ ўрнатилган ва аксиал равишда силжитилган икки статордан иборат кўп кутбли секин юривчи

электр машинаси шу билан фарқланадики, бир статор обмоткаларининг кутблари иккинчи статор обмоткалари кутблари ўртасидаги ораликлар қаршисига жойлашган, бунда иккала статор обмоткалари фазалар бўйича кетма-кет, карама қарши кутбларни алмаштириб уланган, статорлар ўртасидаги оралик магнит ўтказувчи сегментлар билан тўлдирилган, ҳамда иккала ротор бир валга ўрнатилган ва магнит ўтказувчи втулка билан уланган.

Многополюсная тихоходная электрическая машина, содержащая установленный в подшипниках вал, два однотипных соосно установленных и аксиально смещенных статора, каждый из которых включает сердечник с размещенными в пазах обмотками, и два короткозамкнутых ротора, установленных напротив взаимодействующих с ними статоров, отличающаяся тем, что полюса обмотки одного из статоров расположены напротив промежутков между полюсами обмотки другого статора, при этом обмотки обоих статоров соединены пофазно последовательно с чередованием полярности полюсов, промежуток между статорами заполнен магнитопроводящими сегментами, а оба ротора посажены на один вал и соединены магнитопроводящей втулкой.

FG4A

1.5. Ихтироларга патент ва талабномаларнинг тизимли ва рақамли кўрсаткичлари

Систематический и нумерационный указатели патентов и заявок на изобретения

1.1-бўлим учун ихтироларга патентларнинг тизимли кўрсаткичи
Систематический указатель патентов на изобретения к подразделу 1.1.

Ихтироларнинг халқаро патент таснифи индекси	Патент рақами	Ихтироларнинг халқаро патент таснифи индекси	Патент рақами
Индекс МПК	Номер патента	Индекс МПК	Номер патента
1	2	1	2
8 A 01 B 49/00	IAP 03618	8 B 61 D 17/04	IAP 03629
8 A 61 K 9/08	IAP 03622	8 C 07 C 49/00	IAP 03621
8 A 61 K 9/08	IAP 03624	8 C 07 D 207/00	IAP 03630
8 A 61 K 9/10	IAP 03622	8 C 07 D 209/00	IAP 03635
8 A 61 K 9/107	IAP 03619	8 C 07 D 211/00	IAP 03634
8 A 61 K 9/127	IAP 03620	8 C 07 D 213/00	IAP 03630
8 A 61 K 9/133	IAP 03620	8 C 07 D 215/00	IAP 03632
8 A 61 K 9/20	IAP 03622	8 C 07 D 235/00	IAP 03632
8 A 61 K 9/48	IAP 03622	8 C 07 D 401/00	IAP 03630
8 A 61 K 31/00	IAP 03635		IAP 03631
8 A 61 K 31/12	IAP 03621		IAP 03632
8 A 61 K 31/121	IAP 03621		IAP 03633
8 A 61 K 31/185	IAP 03622		IAP 03635
8 A 61 K 31/366	IAP 03619	8 C 07 D 403/00	IAP 03630
8 A 61 K 31/40	IAP 03630		IAP 03634
8 A 61 K 31/415	IAP 03632		IAP 03635
8 A 61 K 31/4427	IAP 03619	8 C 07 D 405/00	IAP 03635
8 A 61 K 31/4523	IAP 03631	8 C 07 D 409/00	IAP 03635
	IAP 03633	8 C 07 D 413/00	IAP 03634
	IAP 03634		IAP 03635
8 A 61 K 31/496	IAP 03634	8 C 07 D 417/00	IAP 03635
8 A 61 K 31/537	IAP 03634	8 C 07 D 453/00	IAP 03633
8 A 61 K 31/683	IAP 03622	8 C 07 D 471/00	IAP 03633
8 A 61 K 36/00	IAP 03621	8 C 07 D 487/00	IAP 03633
	IAP 03623	8 C 07 D 495/00	IAP 03633
8 A 61 K 38/08	IAP 03624	8 C 07 D 513/00	IAP 03633
8 A 61 K 47/26	IAP 03624	8 C 08 J 5/18	IAP 03636
8 A 61 K 47/48	IAP 03625	8 D 02 B 7/20	IAP 03640
8 A 61 M 5/32	IAP 03626	8 E 04 C 5/00	IAP 03637
8 A 61 M 5/50	IAP 03626	8 E 21 B 43/00	IAP 03638
8 A 61 P 1/00	IAP 03622	8 F 03 B 13/00	IAP 03639
8 A 61 P 25/00	IAP 03633	8 G 05 D 7/00	IAP 03640
8 A 61 P 29/00	IAP 03631	8 G 05 D 7/06	IAP 03640
8 A 61 P 31/00	IAP 03619	8 G 05 D 9/00	IAP 03640
8 A 61 P 35/00	IAP 03632	8 G 06 K 19/077	IAP 03641
	IAP 03634	8 G 07 C 9/00	IAP 03641
8 A 61 P 7/00	IAP 03630	8 G 09 B 23/00	IAP 03642
8 A 62 B 18/00	IAP 03627	8 H 02 K 16/00	IAP 03643
8 B 42 D 15/00	IAP 03628		

1.1-бўлим учун ихтироларга талабномаларнинг рақамли кўрсаткичи
Нумерационный указатель заявок на изобретения к подразделу 1.1.

Талабнома рақами		Патент рақами	
Номер заявки		Номер патента	
IAP 2003 0800	IAP 03619	IAP 2005 0128	IAP 03623
IAP 2003 0938	IAP 03625	IAP 2005 0194	IAP 03633
IAP 2004 0061	IAP 03635	IAP 2005 0363	IAP 03618
IAP 2004 0072	IAP 03629	IAP 2005 0400	IAP 03626
IAP 2004 0193	IAP 03630	IAP 2005 0425	IAP 03631
IAP 2004 0247	IAP 03624	IAP 2006 0014	IAP 03642
IAP 2004 0275	IAP 03621	IAP 2006 0040	IAP 03634
IAP 2004 0384	IAP 03639	IAP 2006 0047	IAP 03638
IAP 2004 0415	IAP 03620	IAP 2006 0176	IAP 03636
IAP 2004 0450	IAP 03628	IAP 2006 0184	IAP 03637
IAP 2005 0001	IAP 03643	IAP 2006 0210	IAP 03622
IAP 2005 0040	IAP 03632	IAP 2006 0230	IAP 03640
IAP 2005 0124	IAP 03641	IAP 2006 0381	IAP 03627

1.1-бўлим учун ихтиролар муаллифларининг ном кўрсаткичи
Именной указатель авторов изобретений к подразделу 1.1.

(72) Фамилияси, исми, отасининг исми, мамлакат коди	(11) Патент рақами
Фамилия, имя, отчество, код страны	Номер патента
1	2
Азимова Шахноз Садиқовна, UZ	IAP 03623
АИДА, Такаши, US	IAP 03641
АЛИСИ, Мариа, Алессандра, IT	IAP 03631
Андрианов Николай Викторович, BY	IAP 03637
АРНДТ, Кирштен, DE	IAP 03633
Бабаджанов Азамат Адьлович, UZ	IAP 03629
БАИК Воо Ин, KR	IAP 03626
БАУЕР, Хорст, DE	IAP 03624
БАУЭР, Экхарт, DE	IAP 03633
Беков Ислон Останович, UZ	IAP 03638
БИГЖ, Кристофер, Франклин, US	IAP 03630
БИСГАЙЕР, Чарльз, Л., US	IAP 03620
БОЛЪЕ, Пьер, Луи, SA	IAP 03635
Бондаренко Александр Николаевич, BY	IAP 03637
Валиев Марат Рашидович, UZ	IAP 03638
ВАН ХЕЙС, Чэд, Элан, US	IAP 03630
ВАРАЗИ, Марио, IT	IAP 03634
Василенко Сергей Николаевич, UZ	IAP 03640
ВИАНЕЛЛО, Паола, IT	IAP 03634
ГАНН, Джоселин А., US	IAP 03619
Гойибов Батыр Джураевич, UZ	IAP 03638
ГУГЛИЕЛМОТТИ, Анджело, IT	IAP 03631
Гулбоев Сухроб Ислмович, UZ	IAP 03618
ГУЛЕ, Сильвия, SA	IAP 03635
Гуриев Сергей Бексултанович, UZ	IAP 03642
ГЮТЛЯЙН, Франк, DE	IAP 03624

1	2
ДАДЛИ, Данетт, Андреа, US	IAP 03630
ДИ СТЕФАНО, Доминик, DE	IAP 03624
Дивеев Исмаил Исхакович, UZ	IAP 03638
ДООДС, Хенри, DE	IAP 03633
ДРАЙЗИН, Уэйн, US	IAP 03641
ДРЕЙЕР, Александер, DE	IAP 03633
Дустёров Шерзод Норсубхонович, UZ	IAP 03618
ЕРЕМИНА Светлана Александровна, RU	IAP 03622
ЖИЙЯР, Джеймс, CA	IAP 03635
ЖОЛИКЁР, Эрик, CA	IAP 03635
ЖУКОВА Людмила Владимировна, RU	IAP 03622
Звездов Андрей Иванович, RU	IAP 03637
Зоиров Уткир Зиятович, UZ	IAP 03618
ИВАНОВ Иван Владимирович, RU	IAP 03622
ИКСАНОВ Рустам Мунирович, RU	IAP 03622
Иноятова Феруза Хидоятовна, UZ	IAP 03642
КАЗЗОЛЛА, Никола, IT	IAP 03631
КАСИМИРО-ГАРСИА, Агустин, US	IAP 03630
КАТ, Джон, Чарлз, US	IAP 03632
Конеев Марат Рустамович, UZ	IAP 03638
КОРТ, Джеффри, Томас, US	IAP 03631
Кужбанова Вазира Джарылгасовна, UZ	IAP 03638
КУКОЛЬ, Жорж, CA	IAP 03635
Кутлимуратов Хусин Рустамович, UZ	IAP 03642
КХАННА, Нанду, Мал, IN	IAP 03621
Лайшев Алексей Владимирович, UZ	IAP 03638
Ли Роберт Чанирович, UZ	IAP 03638
ЛИССИКАТОС, Джозеф, Питер, US	IAP 03632
ЛЮСТЕНБЕРГЕР, Филип, DE	IAP 03633
Маматханов Ахматхон Умарович, UZ	IAP 03623
Маматов Фармон Муртозевич, UZ	IAP 03618
Маточкин Виктор Аркадьевич, BY	IAP 03637
Мешков Владимир Зусьевич, RU	IAP 03637
Мирзаев Саид Хаитович, UZ	IAP 03638
МОЛЛЬ, Юрген, IT	IAP 03634
МОРУГИНА Людмила Валентиновна, RU	IAP 03622
Мухамедиев Тахир Абдурахманович, RU	IAP 03637
Мухаммадиев Мурадулла, UZ	IAP 03639
МЮЛЛЕР, Штефан Георг, DE	IAP 03633
Назаров Улугбек Султанович, UZ	IAP 03638
Оллобердиев Гайрат Темирович, UZ	IAP 03638
Охунов Алишер Арипович, UZ	IAP 03642
ПАЛ, Рагхвендра, IN	IAP 03621
ПОЛЕНЦАНИ, Лоренцо, IT	IAP 03631
ПУАРЬЕ, Мартин, CA	IAP 03635
ПУПАР, Марк-Андре, CA	IAP 03635
РАЙЭЛЛ, Роберт, П., US	IAP 03625
РАНКУР, Жан, CA	IAP 03635
РЕЙ, Мадхур, IN	IAP 03621
Ризокулов Ботир Баратович, UZ	IAP 03618

1	2
РИЧАРДСОН, Грант, Стюарт, GB	IAP 03627
РИШЕР, Матиас, DE	IAP 03624
РОДРИГЕЗА, Венди, В., US	IAP 03620
РУДОЛЬФ, Клаус, DE	IAP 03633
РУДЬКО Александр Иосифович, RU	IAP 03622
САИТО, Тамио, US	IAP 03641
САРЛИКИОТИС, Вернер, GR	IAP 03624
Сатгаров Иноят Сапарбаевич, UZ	IAP 03642
САТТОН, Роберт, Чарльз, GB	IAP 03627
СИНГХ, Сатиаван, IN	IAP 03621
Сметанин Юрий Николаевич, UZ	IAP 03640
Судаков Геральд Николаевич, RU	IAP 03637
Сыров Владимир Николаевич, UZ	IAP 03623
Тихонов Игорь Николаевич, RU	IAP 03637
Тищенко Владимир Андреевич, BY	IAP 03637
Толстунов Михаил Юрьевич, UZ	IAP 03640
ТСАНТРИЗОС, Йула, С., SA	IAP 03635
Турахожаев Муратбек Турахожаевич, UZ	IAP 03623
Турдиев Олим Исмаилович, UZ	IAP 03638
Тюменев Рустэм Мустафович, UZ	IAP 03640
Уманский Самсон Иосифович, UZ	IAP 03643
УОНГ, Хьюйфен, Фэйе, US	IAP 03632
Уришев Боборахим Уришевич, UZ	IAP 03639
ФАЗАЛЬ, Гульрез, SA	IAP 03635
Файзиев Бахтияр Тахирович, UZ	IAP 03629
ФАНЧЕЛЛИ, Даниеле, IT	IAP 03634
ФИЛИПСКИ, Кевин, Джеймс, US	IAP 03630
ФОРТЕ, Барбара, IT	IAP 03634
ФУРЛОТТИ, Гвидо, IT	IAP 03631
ХАЙМ, Манфред, DE	IAP 03628
Хромова Галина Алексеевна, UZ	IAP 03629
Худояров Бердирасул Мирзаевич, UZ	IAP 03618
ЧЕН, Ширлин, US	IAP 03619
Чуянов Дустмурот Шодмонович, UZ	IAP 03618
Шамсиев Шермат Журакулович, UZ	IAP 03638
Шарипов Анвар Хакимович, UZ	IAP 03638
Шафиев Рустам Умарович, UZ	IAP 03638
ШИНДЛЕР, Маркус, DE	IAP 03633
ШМИТЦ, Христиан, DE	IAP 03628
ШТЕНКАМП, Дирк, DE	IAP 03633
ЭДМУНДС, Джереми, Джон, US	IAP 03630
ЭНГЕЛЬ, Юрген, DE	IAP 03624
Эргашев Гайрат Худоярович, UZ	IAP 03618
ЭРХАРДТ, Вернер, DE	IAP 03636
Якубов Нажмидин Мухидинович, UZ	IAP 03638
Якубова Мохира Рахимовна, UZ	IAP 03623

Ушбу бўлимда 26 та ихтиролар тўғрисидаги маълумотлар нашр қилинди.

В настоящем разделе опубликованы сведения о 26 изобретениях.

II. Фойдали моделлар ПОЛЕЗНЫЕ МОДЕЛИ

Фойдали моделлар Давлат реестри рўйхатидан
ўтказилган фойдали моделлар ҳақида маълумотларни нашр қилиш
Публикация сведений о полезных моделях,
зарегистрированных в Государственном реестре полезных моделей

2.1. FG4K

Фойдали моделларга патентлар ПАТЕНТЫ НА ПОЛЕЗНЫЕ МОДЕЛИ

А бўлими
ИНСОН ҲАЁТИЙ ЭҲТИЁЖЛАРИНИ
ҚОНДИРИШ

Раздел А
УДОВЛЕТВОРЕНИЕ ЖИЗНЕННЫХ
ПОТРЕБНОСТЕЙ ЧЕЛОВЕКА

А 61

(11) FAP 00354 (13) U
(51) 8 A 61 B 17/56
(21) FAP 2006 0063 (22) 25.10.2006
(71)(73) Бекчанов Салижон Зарифович, UZ
(72) Бекчанов Салижон Зарифович, Миржалилов
Файзулла Хамидуллаевич, Тожиев Шухрат Зия-
дуллаевич, UZ
(54) Болдир суякларининг синикларини репо-
зициялаш ва фиксациялаш учун мослама
Устройство для репозиции и фиксации пере-
ломов костей голени

(57) *Фойдаланиш соҳаси:* травматология. *Вазифа:* кўшимча мосламаларсиз бир вақтнинг ўзи-
да суяк синикларини репозициялаш ва ва синик-
ларни фиксациялаш имкониятини таъминлаш
йўли билан қурилманинг функционал имконият-
ларини кенгайтириш. *Фойдали модель моҳи-
яти:* қурилма асос ва фиксациялаш элементлари
бор ҳалқаларни ўз ичига олган. Асос маҳкамлай-
диган тугун ёрдамида тўртта ҳалқа бириктирил-
ган рамага маҳкамланган резбали стержень
кўринишида бажарилган. Маҳкамловчи тугун
кулоқли муфта кўринишида бажарилган бўлиб,
унда резбали переходникнинг бир учини маҳ-
камлаш учун тешик қилинган бўлиб, резбали
переходникнинг бошқа учи ҳалқага бириктирил-
ган. Ўртадаги ҳалқаларда ҳар бири резба штан-
гали кронштейндан ташкил топган репонирлов-
чи тугунлар ўрнатилган бўлиб, резбали штан-
гада спица учун кўндаланг кесим қилинган.

Использование: травматология. *Задача:* расши-
рение функциональных возможностей устрой-
ства путем обеспечения возможности одновре-
менной репозиции отломков костей и фиксации
отломков без дополнительных приспособлений.
Сущность полезной модели: устройство содер-
жит основание и кольца с элементами фиксации.
Основание выполнено в виде резьбового стер-
жня, закрепленного на раме, к которому посред-
ством крепежного узла прикреплены четыре
кольца. Крепежный узел выполнен в виде муфты
с ушком, в котором выполнено отверстие для
закрепления одного конца резьбового переход-
ника, другой конец которого закреплен на коль-
це. На средних кольцах установлены репони-
рующие узлы, каждый из которых состоит из
кронштейна с резьбовой штангой, в которой
выполнена продольная прорезь под спицу.

В бўлими
ТУРЛИ ТЕХНОЛОГИК ЖАРАЁНЛАР

Раздел В
РАЗЛИЧНЫЕ ТЕХНОЛОГИЧЕСКИЕ
ПРОЦЕССЫ

В 60

(11) FAP 00355 (13) U
(51) 8 B 60 S 5/00
(21) FAP 2008 0006 (22) 25.01.2008
(71)(73) O'zbekiston Respublikasi Mudofaa vazir-
ligi 1- qurilish konstruksiyalari zavodi, UZ
1-й завод строительных конструкций Министер-
ства обороны Республики Узбекистан, UZ
(72) Ходжакулов Виталий Джуракулович, Хик-
матуллаев Тулкун Юсупович, Абдуллаев Аббас
Бахтиерович, Ашуров Бахтиер Рахимджанович,
Пилипенко Александр Дмитриевич, Кашин
Вячеслав Юрьевич, UZ

(54) Автомобилларга ёқилғи қуйиш контейнер шахобчаси

Контейнерная автозаправочная станция

(57) Фойдаланиш соҳаси: автотранспорт воситаларига, хусусан қийин етиб бориладиган аҳоли сийрак турадиган жойларда ёнилғи қуйиш. **Вазифаси:** функционал имкониятлари кенгайтирилган, бир вақтнинг ўзида транспорт воситасига нефть маҳсулотлари ва мой қуйишни ўтказишга имкон берувчи контейнерли авто ёнилғи қуйиш станциясини (АЁҚС) яратиш, ёнгиндан ҳимояланганлигини ошириш. **Фойдали модель моҳияти:** станция ёнилғини сақлаш учун қисмларга ажратилган контейнерни ичига олган бўлиб, уларнинг биттасида нефть маҳсулотлари учун резервуар, иккинчисида эса нефть маҳсулотлари учун резервуар билан қувур орқали бириктирилган ёнилғи тарқатиш колонкаси, ёнилғи тарқатиш колонкаси билан уланган бошқарув пулти жойлаштирилган. Контейнернинг иккинчи қисмида қўшимча равишда мой учун сизим жойлаштирилган бўлиб, унда мой тақатиш колонкаси ўрнатилган. Нефть маҳсулотлари учун резервуар ва ёнилғи тарқатиш колонкани бириктирувчи қувурда бир-биридан кейин кетма-кет беркитиш крани ва оловдан тўсувчи монтаж қилинган. Нефть маҳсулотлари учун резервуарнинг юқори қисмида бўғиз бажарилган бўлиб, унга қопқок маҳкамланган, шунингдек нафас олиш клапани ўрнатилган. Бўғизнинг қопқоғида киритиш, ўлчаш ва қуйиб олиш тешиклари бажарилган. Нефть маҳсулотлари учун резервуар бўғизи устидаги контейнер қопқоғида қараш люки жойлашган. Контейнерларнинг қисмлари орасидаги тўсиқ металлдан бажарилган.

Использование: заправка автотранспортных средств, в частности в труднодоступной и малонаселенной местности. **Задача:** создание контейнерной автозаправочной станции (КАС) с расширенными функциональными возможностями, позволяющими одновременно проводить заправку транспортного средства нефтепродуктами и маслом, повышение пожарозащищенности. **Сущность полезной модели:** станция включает разделенный на части контейнер для хранения топлива, в одной из которых размещен резервуар для нефтепродуктов, а во второй – топливораздаточная колонка, соединенная трубопроводом с резервуаром для нефтепродуктов, пультом управления, соединенный с топливораздаточной колонкой. Во второй части контейнера допол-

нительно размещена емкость для масла, на которой установлена маслораздаточная колонка. На трубопроводе, соединяющем резервуар для нефтепродуктов и топливораздаточную колонку, последовательно друг за другом смонтированы запорный кран и огнепреградитель. В верхней части резервуара для нефтепродуктов выполнена горловина, на которой закреплена крышка, а также смонтирован дыхательный клапан. В крышке горловины выполнены впускное, замерное и сливное отверстия. В крыше контейнера над горловиной резервуара для нефтепродуктов расположен смотровой люк. Перегородка между частями контейнера выполнена из металла.

F бўлим

**МЕХАНИКА; ЁРИТИШ; ИСИТИШ;
ДВИГАТЕЛЛАР ВА НАСОСЛАР;
ПОРТЛАТИШ ИШЛАРИ**

Раздел F

**МЕХАНИКА; ОСВЕЩЕНИЕ; ОТОПЛЕНИЕ;
ДВИГАТЕЛИ И НАСОСЫ;
ВЗРЫВНЫЕ РАБОТЫ**

F 23

(11) FAP 00356

(13) U

(51) 8 F 23 D 14/04

(21) FAP 2008 0012

(22) 07.02.2008

(71)(73) Ёпиқ акциядорлик жамияти шаклидаги "BRUZ PI" Ўзбекистон-Британия-Америка қўшма корхонаси, UZ

Совместное Узбекско-Британское-Американское предприятие "BRUZ PI" в виде закрытого акционерного общества, UZ

(72) Убайдуллаев Шавкат Гайбуллаевич, UZ

(54) Инжектсион газ горелкаси

Инжектсионная газовая горелка

(57) Фойдаланиш соҳаси: қозонлар, печкалар ва бошқа агрегатларда табиий газни ёқиш қурилмаси. **Вазифаси:** кичиктирилган габаритли ва газ ёқишнинг юқори самарадорлигига эга горелка яратиш. **Фойдали модель моҳияти:** инжектсион газ горелкаси таркибига форсунка ва олов насадкаси кирган. Олов насадкасида параллель жойлашган газ ҳаво аралашмасини тайёрлаш ва чиқариш камералари ҳосил қилиб, тўсиқ ўрнатилган. Тўсиқ конфузур, горловина, диффузор ва газҳаво аралашмасини тайёрлаш камерасида тезлик ва босимни стабилизацияловчи участка ҳосил қилиб, эгик қилиб бажарилган. Олов насадкасида

тўсиқнинг қаршисида ёйсимон йўналтиргич ўрнатилган. Газ ҳаво аралашмасини чиқариш камерасининг ҳажми уни тайёрлаш камераси ҳажмидан 1,5-1,6 марта катта. Олов насадкаси асос ва унинг устига маҳкамланган кўндаланг кесимда ярим думалоқ ёки трапециясимон шаклдаги экран кўринишида бажарилган. Олов тешиклари ёриқ кўринишида қилинган. Олов тешиклари орасида запал тешиклари бажарилган. Форсунканинг резьбаои юзасида ҳаво узатишни назорат қилувчи диск ўрнатилган.

Использование: устройства для сжигания природного газа в котлах, печах и других агрегатах. **Задача:** создание горелки с повышенной эффективностью сжигания газа и уменьшенными габаритами. **Сущность полезной модели:** инжекционная газовая горелка содержит форсунку и

огневую насадку. В огневой насадке установлена перегородка с образованием параллельно расположенных камер подготовки и выхода газовой смеси. Перегородка выполнена изогнутой с образованием конфузора, горловины, диффузора и участка стабилизации скорости и напора в камере подготовки газовой смеси. В огневой насадке напротив перегородки установлена дугообразная направляющая. Объем камеры выхода газовой смеси больше объема камеры ее подготовки в 1,5-1,6 раза. Огневая насадка выполнена в виде основания и закрепленного на ней экрана полукруглой или трапециевидальной в поперечном сечении формы. Огневые отверстия выполнены в виде щелей. Между огневыми отверстиями выполнены запальные отверстия. На резьбовой поверхности форсунки установлен диск для регулирования подачи воздуха.

2.2. FG4K

Фойдали моделларга патент ва талабноналарнинг тизимли ва рақамли кўрсаткичлари Систематический и нумерационный указатели патентов и заявок на полезные модели

Фойдали моделларга патентларнинг тизимли кўрсаткичи Систематический указатель патентов на полезные модели

(51) Халқаро патент классификация индекси	(11) Патент рақами
Индекс МПК	Номер патента
8 A 61 B 17/56	FAP 00354
8 B 60 S 5/00	FAP 00355

(51) Халқаро патент классификация индекси	(11) Патент рақами
Индекс МПК	Номер патента
8 F 23 D 14/04	FAP 00356

Фойдали моделларга талабноналар бўйича рақамли кўрсаткич Нумерационный указатель заявок на полезные модели

(21) Талабнома рақами	(11) Патент рақами
Номер заявки	Номер патента
FAP 2006 0063	FAP 00354
FAP 2008 0006	FAP 00355

(21) Талабнома рақами	(11) Патент рақами
Номер заявки	Номер патента
FAP 2008 0012	FAP 00356

Фойдали моделлар муаллифларининг ном кўрсаткичи
Именной указатель авторов полезных моделей

(72) Фамилияси, исми, отасининг исми, мамлакат коди	(11) Патент рақами
Фамилия, имя, отчество, код страны	Номер патента
Абдуллаев Аббас Бахтиёрович, UZ	FAP 00355
Ашуров Бахтиёр Рахимджанович, UZ	FAP 00355
Бекчанов Салижон Зарифович, UZ	FAP 00354
Кашин Вячеслав Юрьевич, UZ	FAP 00355
Миржалилов Файзулла Хамидуллаевич, UZ	FAP 00354
Пилипенко Александр Дмитриевич, UZ	FAP 00355
Тожиев Шухрат Зиядуллаевич, UZ	FAP 00354
Убайдуллаев Шавкат Гайбуллаевич, UZ	FAP 00356
Хикматуллаев Тулкун Юсупович, UZ	FAP 00355
Ходжакулов Виталий Джуракулович, UZ	FAP 00355

Ушбу бўлимда 3 та фойдали модел тўғрисидаги маълумотлар нашр қилинди.

В настоящем разделе опубликованы сведения о трех полезных моделях.

**САНОАТ НАМУНАЛАРИГА ОИД БИБЛИОГРАФИЯ
МАЪЛУМОТЛАРИНИ АЙНАНЛАШТИРИШ УЧУН
ХАЛҚАРО КОДЛАР
(БИМТ ST.80 стандарти)**

**МЕЖДУНАРОДНЫЕ КОДЫ ДЛЯ ИДЕНТИФИКАЦИИ
БИБЛИОГРАФИЧЕСКИХ ДАННЫХ, ОТНОСЯЩИХСЯ
К ПРОМЫШЛЕННЫМ ОБРАЗЦАМ
(Стандарт ВОИС ST.80)**

(11) - патент рақами	(11) - номер патента
(15) - рўйхатдан ўтказиш санаси/узайтириш санаси	(15) - дата регистрации/дата продления
(21) - талабномани рўйхатдан ўтказиш рақами	(21) - регистрационный номер заявки
(22) - талабномани топшириш санаси	(22) - дата подачи заявки
(23) – бошқа турли сана(лар), шу жумладан аввалроқ келиб тушган талабномага қўшимча материалларнинг келиб тушиш санаси	(23) - прочая(ие) дата(ы), включая дату поступления дополнительных материалов к более ранней заявке
(31) - устуворлик талабномасининг рақами	(31) - номер приоритетной заявки
(32) - устуворлик талабномасининг топширилиш санаси	(32) - дата подачи приоритетной заявки
(33) - устуворлик талабномаси топширилган мамлакат коди	(33) - код страны, в которую была подана приоритетная заявка
(45) - рўйхатдан ўтказилган саноат намунасининг чоп этилиш санаси	(45) - дата публикации зарегистрированного промышленного образца
(51) - Саноат намуналарининг халқаро таснифи (СНХТ) индекс(лар)и	(51) - индекс(ы) Международной классификации промышленных образцов (МКПО)
(54) - саноат намунасининг номи	(54) - название промышленного образца
(55) - саноат намунасининг тасвири (расм, фотосурат)	(55) - воспроизведение промышленного образца (рисунок, фотография)
(65) - ушбу талабномага оид аввал нашр қилинган патент ҳужжатининг рақами	(65) - номер ранее опубликованного патентного документа, касающегося данной заявки
(71) - талабнома берувчининг номи, мамлакат коди	(71) - имя заявителя, код страны
(72) - муаллиф номи, мамлакат коди	(72) - имя автора, код страны
(73) - патентга эгалик қилувчининг номи, мамлакат коди	(73) - имя патентообладателя, код страны

III. САНОАТ НАМУНАЛАРИ ПРОМЫШЛЕННЫЕ ОБРАЗЦЫ

Саноат намуналари Давлат реестри рўйхатидан ўтказилган
саноат намуналари ҳақида маълумотларни нашр қилиш
Publication of information on industrial designs registered
in the State Register of Industrial Designs

3.1.FG4L

САНОАТ НАМУНАЛАРИГА ПАТЕНТЛАР ПАТЕНТЫ НА ПРОМЫШЛЕННЫЕ ОБРАЗЦЫ

(11) SAP 00612

(51) 09-03

(15) 28.03.2008

(21) SAP 2007 0005

(22) 26.01.2007

(31)(32)(33) 29/269,59304, 12.2006, US

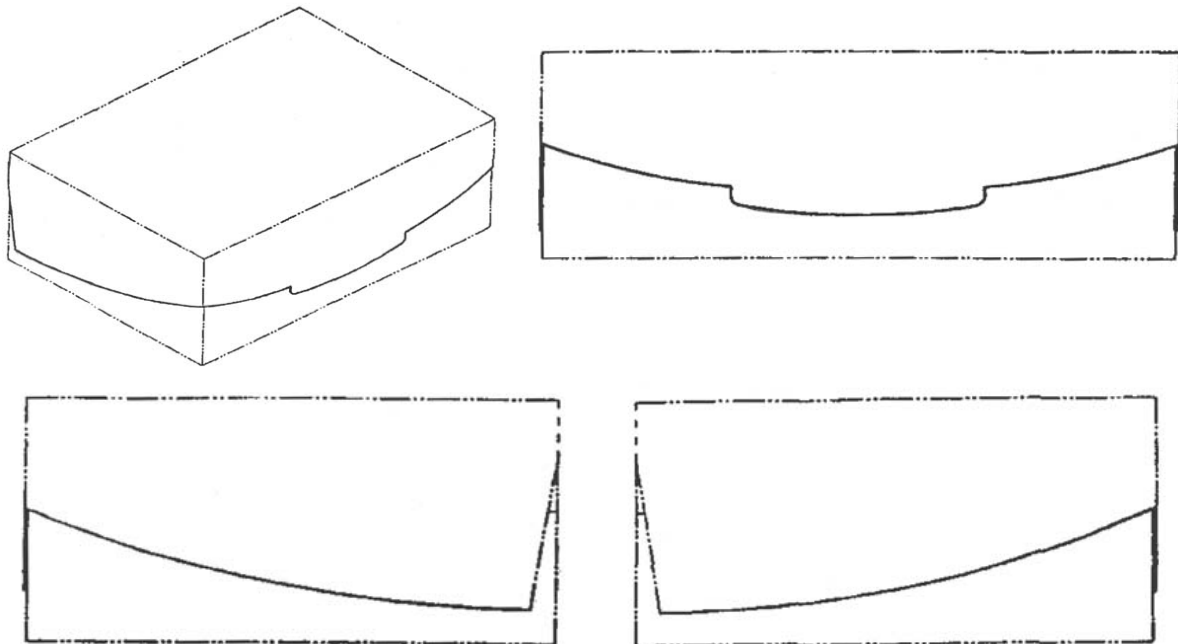
(71)(73) ЮНИЛЕВЕР Н.В., NL

(72) Стейгер Деннис Ирвин, US; Багни Клаудиа, BR; Джансинг Бернд, DE; Сеймур Ричард Уильям, Кароен Адриан Барклай, Уотли Йан Питер, GB

(54) Ўраш учун қути

Коробка для упаковки

(55)



(11) SAP 00613

(51) 09-03

(15) 28.03.2008

(21) SAP 2007 0006

(22) 26.01.2007

(31)(32)(33) 29/269,585, 04.12.2006, US

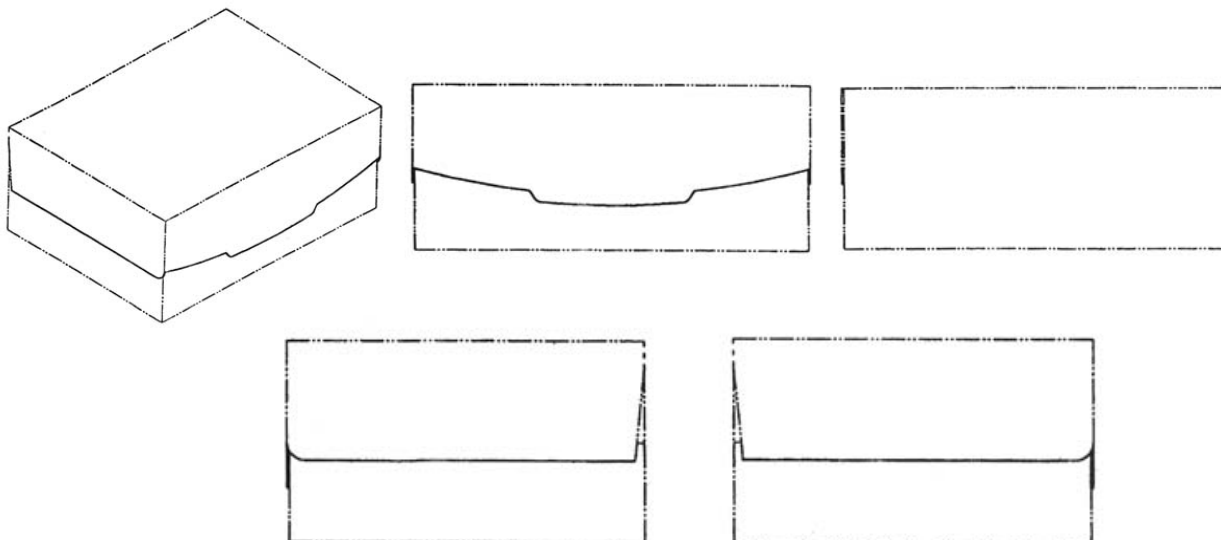
(71)(73) ЮНИЛЕВЕР Н.В., NL

(72) Стейгер Деннис Ирвин, US; Багни Клаудиа, BR; Джансинг Бернд, DE; Сеймур Ричард Уильям, Кароен Адриан Барклай, Уотли Йан Питер, GB

(54) Ўраш учун қути

Коробка для упаковки

(55)



(11) SAP 00614

(51) 09-03

(15) 11.03.2008

(21) SAP 2007 0034

(22) 13.07.2007

(71)(73) Масъулияти чекланган жамият шаклидаги "ASIA KANDI" Ўзбекистон-Туркия қўшма корхонаси, UZ

Совместное Узбекско-Турецкое предприятие "ASIA KANDI" в форме общества с ограниченной ответственностью, UZ

(72) Муллабаев Музаффар Шаниязович, Портокал Жумали, UZ

(54) Сақич учун кути

Упаковка для жевательной резинки

(55)



(11) SAP 00615

(51) 09-03

(15) 11.03.2008

(21) SAP 20070035

(22) 13.07.2007

(71)(73) Масъулияти чекланган жамият шаклидаги "ASIA KANDI" Ўзбекистон-Туркия кўшма корхонаси, UZ

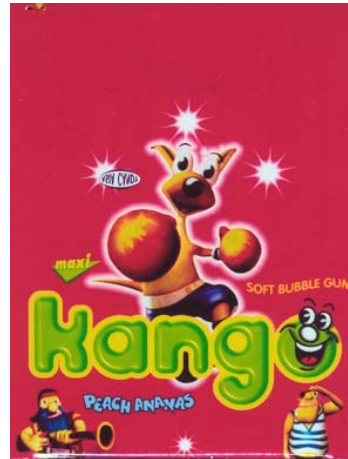
Совместное Узбекско-Турецкое предприятие "ASIA KANDI" в форме общества с ограниченной ответственностью, UZ

(72) Муллабаев Музаффар Шаниязович, Портокал Жумали, UZ

(54) Сакич учун кути

Упаковка для жевательной резинки

(55)



(11) SAP 00616

(51) 13-03

(15) 11.03.2008

(21) SAP 20070007

(22) 30.01.2007

(71)(73) Viko Elektrik Ve Elektronik Endustrisi Sanayi Ve Tijaret Anonim Shirketi, TR

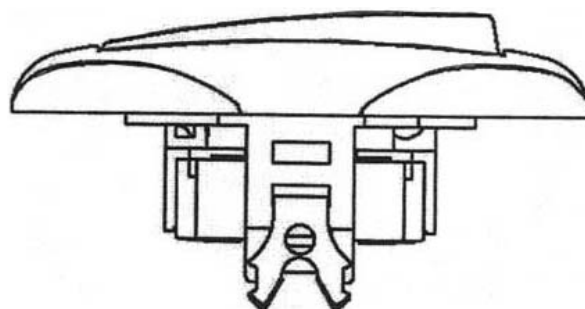
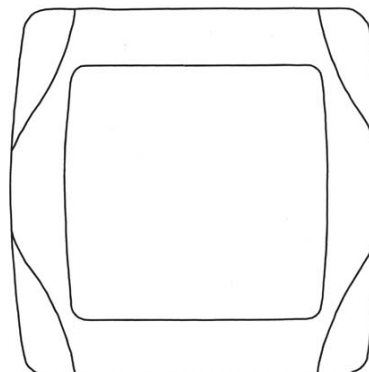
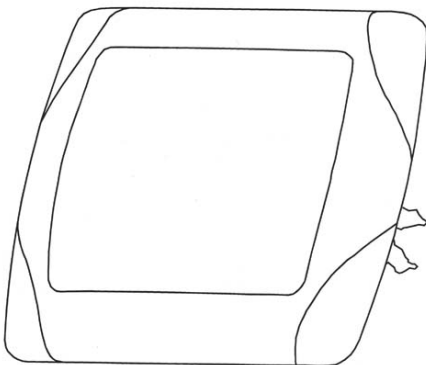
Вико Электрик Ве Электроник Эндустриси Санайи Ве Тиджарет Аноним Ширкети, TR

(72) Жахит Дурмаз, Исмаил Али Дагбаши, TR

(54) Электр включатели

Включатель электрический

(55)



(11) SAP 00617
 (15) 14.03.2008
 (21) SAP 20070019
 (71)(72)(73) Джавхаров Миргиёз Насритдинович, UZ
 (54) Респиратор
 Респиратор
 (55)

(51) 29-02

(22) 26.04.2007



3.2 FG4L

Саноат намуналарига патент талабномаларнинг тизимли ва рақамли кўрсаткичлари

Систематический и нумерационный указатели патентов и заявок на промышленные образцы

Саноат намуналарига патентларнинг тизимли кўрсаткичи Систематический указатель патентов на промышленные образцы

Саноат намуналарининг халқаро таснифи индекси	Патент рақами	Саноат намуналарининг халқаро таснифи индекси	Патент рақами
Индекс МКПО	Номер патента	Индекс МКПО	Номер патента
09-03	SAP 00612	09-03	SAP 00615
	SAP 00613	13-03	SAP 00616
	SAP 00614	29-02	SAP 00617

Саноат намуналарига талабномаларнинг рақамли кўрсаткичи Нумерационный указатель заявок на промышленные образцы

Талабнома рақами	Патент рақами	Талабнома рақами	Патент рақами
Номер заявки	Номер патента	Номер заявки	Номер патента
SAP 2007 0005	SAP 00612	SAP 2007 0019	SAP 00617
SAP 2007 0006	SAP 00613	SAP 2007 0034	SAP 00614
SAP 200670007	SAP 00616	SAP 2007 0035	SAP 00615

Ушбу бўлимда 6 та саноат намуналари тўғрисидаги маълумотлар нашр қилинди.

В настоящем разделе опубликованы сведения о шести промышленных образцах.