



Національний орган інтелектуальної власності
Державна організація «Український національний
офіс інтелектуальної власності та інновацій»

ПРОМИСЛОВА ВЛАСНІСТЬ

Том 1

Офіційний електронний
бюлетень

№ 8

2024 рік



Національний орган інтелектуальної власності
Державна організація
«Український національний офіс інтелектуальної власності та інновацій»

ПРОМИСЛОВА ВЛАСНІСТЬ

ВИНАХОДИ. КОРИСНІ МОДЕЛІ.
КОМПОНУВАННЯ НАПІВПРОВІДНИКОВИХ ВИРОБІВ.
ДОДАТКОВА ОХОРОНА ПРАВ НА ВИНАХОДИ

Том 1

Офіційний електронний бюлетень

Заснований 1993 року

Бюлетень № 8

Відомості, вміщені в даному бюлетені,
вважаються опублікованими 21 лютого 2024 р.



Офіційний електронний бюлетень «Промислова власність»

УДК 347.77

Офіційний електронний бюлетень вміщує наступну інформацію:

відомості про заявки на державну реєстрацію винаходів, відомості про державну реєстрацію винаходів, відомості про державну реєстрацію корисних моделей, відомості про державну реєстрацію компонувань напівпровідникових виробів, відомості про додаткову охорону прав на винаходи, сповіщення щодо винаходів, корисних моделей, компонувань напівпровідникових виробів та додаткової охорони прав на винаходи. Бюлетень може містити розділ «Офіційні повідомлення».

Державна організація «Український національний офіс інтелектуальної власності та інновацій»
вул. Дмитра Годзенка, 1, м. Київ-42, 01601, Україна, тел.: (044) 494-06-44, e-mail: office@piro.gov.ua

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

- | | |
|--|--|
| (11) номер реєстрації, що є номером патенту/номер сертифіката додаткової охорони | (66) номер (номери) та дата (дати) подання попередньої (попередніх) заявки (заявок), діловодство за якою (якими) припинено |
| (16) дата державної реєстрації додаткової охорони | (68) номер реєстрації, що є номером базового патенту |
| (21) номер заявки | (71) ім'я або повне найменування заявника (заявників) |
| (22) дата подання заявки | (72) ім'я винахідника (винахідників) |
| (23) інші дати | (73) ім'я або повне найменування, адреса володільця (володільців) патенту/володільця (володільців) сертифіката додаткової охорони та двобуквений код держави |
| (24) дата, з якої є чинними права на винахід (корисну модель) | (85) дата переходу міжнародної заявки до національної фази відповідно до Договору про патентну кооперацію |
| (31) номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції | (86) номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору про патентну кооперацію |
| (32) дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції | (92) номер та дата першого національного дозволу на розміщення продукту на ринку |
| (33) двобуквений код держави - учасниці Паризької конвенції чи регіональної організації, до якої подана попередня заявка | (94) строк дії сертифіката додаткової охорони |
| (41) дата публікації відомостей про заявку на державну реєстрацію винаходу та номер бюлетеня | (95) назва продукту, що охороняється основним патентом і стосовно якого було подано клопотання на отримання додаткової охорони |
| (46) дата публікації відомостей про державну реєстрацію патенту/сертифіката додаткової охорони та номер бюлетеня | (98) дата подання клопотання про видачу сертифіката додаткової охорони |
| (51) індекс (індекси) Міжнародної патентної класифікації | |
| (54) назва винаходу (корисної моделі) | |
| (57) формула винаходу (корисної моделі) | |
| (62) номер та дата подання попередньої заявки, з якої виділено заявку, позначену кодом (21) | |

ВІДОМОСТІ ПРО ЗАЯВКИ НА ДЕРЖАВНУ РЕЄСТРАЦІЮ ВІНАХОДІВ

Відомості в розділі публікуються в редакції заявника

Розділ А:

Життєві потреби людини

А 01

(21) а 2023 04631 (51) МПК (2024.01)
(22) 02.10.2023 А01В 39/00
А01В 51/02 (2006.01)

(71) ДРОНЬ ЮРІЙ СІЛЬВЕСТРОВИЧ (UA)

(72) Дронь Юрій Сільвестрович (UA)

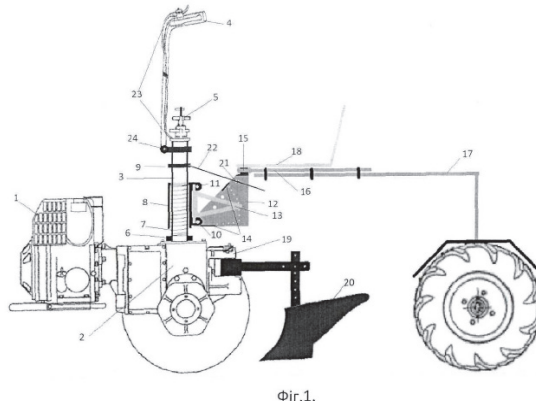
(54) МОТОБЛОК

(57) 1. Багатофункціональний сільськогосподарський мотоблок, що містить двигун внутрішнього згорання та редуктор, які кінематично зв'язані один з одним, механізм приводу коліс, вал відбору потужності або привідний шків, закріплену у верхній частині редуктора чи рами стійку керма, на якій розміщені органи керування дросельною заслінкою, зчепленням, блокуванням коліс та механізмами перемикання швидкостей, який відрізняється тим, що на нижню частину стійки керма встановлено з можливістю обертання опорно-поворотну гільзу з нижнім вушком, до якого з допомогою горизонтальною шворня приєднано нижній отвір причіпного сегменту для приєднання адаптера так, що агрегатований з адаптером мотоблок може обертатися на 360° в горизонтальній площині відносно осі стійки керма та нахилитися вперед та назад у вертикальній площині на кути не менше 5° від горизонтального положення.

2. Мотоблок по п. 1, який відрізняється тим, що стійку керма виготовлено у вигляді посиленої круглої металевої труби, яку міцно і нерухомо закріплено у верхній частині редуктора або рами строго вертикально, опорно-поворотну гільзу встановлено в нижній частині стійки керма на амортизаторах та заблоковано зверху гайкою, вище якої розміщується кріплення ручок керма з механізмом регулювання їх нахилу, а причіпний сегмент утворено з'єднаними через металеві проставки однакової товщини двома однаковими шматками листового металу з серією симетричних отворів.

3. Мотоблок по п. 2, який відрізняється тим, що до встановлених на стійці керма опорно-поворотної гільзи та блокуючої її гайки приєднано штанги, які проходять через причіпний сегмент і їх переміщення в ньому може бути обмежене штифтами чи затискачами з метою фіксації кута нахилу вперед чи назад агрегатованого з адаптером мотоблоку або для обмеження можливості таких нахилів у певному кутовому діапазоні.

4. Мотоблок по п. 2, який відрізняється тим, що встановлена в нижній частині стійки керма опорно-поворотна гільза над нижнім вушком має ще одне верхнє вушко, до якого з допомогою додаткового горизонтального шворня нерухомо фіксується верхній отвір причіпного сегменту, причому в бокових стінках причіпного сегменту окрім отворів для фіксації нижньою та верхньою вушок опорно-поворотної гільзи розміщено ще один або кілька отворів для фіксації горизонтальним шворнем петлі дишла адаптера, а також серія отворів меншою діаметру для встановлення горизонтальних штифтів з метою обмеження діапазону кутів нахилу кермової стійки мотоблоку відносно дишла адаптера.



Фіг.1.

(21) а 2023 04176 (51) МПК (2024.01)
(22) 03.02.2022 А01В 69/00
G05D 1/43 (2020.01)

(31) FR2101118

(32) 05.02.2021

(33) FR

(85) 04.09.2023

(86) PCT/EP2022/052545, 03.02.2022

(71) КЮН САС (FR)

(72) Жаррасье Бенуа (FR), Потье Філіп (FR)

(54) СПОСІБ КОНТРОЛЬОВАНОГО ЗАСІВАННЯ СІЛЬСЬКОГОСПОДАРСЬКОЇ ДІЛЯНКИ ТА СИСТЕМА ДЛЯ ЙОГО ЗДІЙСНЕННЯ

(57) 1. Спосіб контрольованого засівання сільськогосподарської ділянки (1) з допомогою посівної машини (2) або зчіпки з посівним агрегатом, які мають множину індивідуальних висівних органів (3), кожен з яких призначений і виконаний з можливістю виконання посівного ряду (4), причому ця посівна машина або зчіпка (2) виконана з можливістю селективно і принаймні тимчасово переривати один, кілька або всі посівний(ні) ряд(и) (4) шляхом блокування і/або відкидання відповідного органу або відповідних органів

(3), щоб зробити виконання технологічної колії на зазначеній ділянці (1), запобігаючи пошкодженню сільськогосподарських культур під час запланованого проходження однієї або декількох відомих машин або зчіпок, призначених для здійснення однієї або декількох наступних операцій на цій ділянці (1), при цьому зазначений спосіб включає попередню розробку віртуального плану ділянки з поточними, в основному, прямолінійними ділянками (4') розташування посівних рядів, призначених для виконання, принаймні в основній внутрішній області (5) зазначеної ділянки (1) і, можливо, у периферичній області (6) краю поля, яка проходить вздовж або оточує, за необхідності, принаймні частково цю внутрішню область (5), визначають на її основі траєкторії машини або посівної зчіпки (2), контрольовано керованою для здійснення контрольованого засівання з виконанням технологічної колії для цих поточних ділянок (4') залежно від траєкторій ходових органів машини(машин) або зчіпки(ок), які здійснюють наступну(і) операцію(ї) на цих поточних ділянках,

який відрізняється тим, що також надають і враховують конкретні траєкторії (7, 8) машини(машин) або зчіпки(ок), яка(і) здійснює(ють) вищезгадану(і) наступну(і) операцію(ї) принаймні під час проходження поворотів, під час розворотів або між поточними ділянками, і керують машиною або посівною зчіпкою (2) для здійснення контрольованого засівання з виконанням технологічної колії також під час проходження цих конкретних траєкторій (7, 8).

2. Спосіб за п. 1, який відрізняється тим, що визначають і враховують також конкретні траєкторії (8) машини(машин) або зчіпки(ок), яка(і) здійснює(ють) вищезгадану(і) наступну(і) операцію(ї), під час маневрів, пов'язаних з ухиленням від об'єктів або перешкод, з входами або з виходами з ділянки, з операціями поповнення або заправки ресурсами або з прогнозованими специфічними операціями, наприклад, залежно від природи рослин, які культивуються на розглянутій ділянці, від характеристик ґрунту цієї ділянки і/або від відповідного типу машини(машин) або зчіпки(ок).

3. Спосіб за пп. 1 або 2, який відрізняється тим, що попередньо для прогнозованих маневрів проводять моделювання траєкторій ходових засобів різних машин або зчіпок, які здійснюють наступну(і) операцію(ї), які можуть застосовуватися на даній ділянці (1), з урахуванням можливого фактора помилки або відхилення, що визначається за допомоги вимірів під час роботи в реальних умовах.

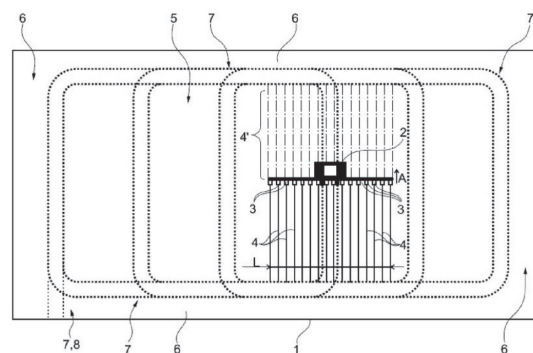
4. Спосіб за будь-яким з пп. 1-3, який відрізняється тим, що віртуальний план ділянки (1) включає також розбивку її площі на робочі зони згідно з рекомендаціями засівання, такими як-от варіювання дози насіння і/або внесеного добрива, швидкості роботи, глибини роботи, спеціальне регулювання принаймні одного робочого параметра машини або посівної зчіпки (2), або їх аналогів.

5. Спосіб за будь-яким з пп. 1-4, який відрізняється тим, що контрольоване засівання ділянки (1) здійснює роботизована машина (2), яка працює автономно або керується дистанційно, робоча ширина (L) якої переважно є цілим числом, кратним робочій ширині різних машин або зчіпок, які здійснюють наступну(і) операцію(ї), яка(і) може(можуть) застосовуватися на розглянутій ділянці (1), причому вони переважно від-

носяться також до типу роботизованої машини, що працює автономно або керується дистанційно.

6. Система для здійснення способу контрольованого засівання за будь-яким з пп. 1-5, яка містить посівну автономну або напівавтономну машину або зчіпку (2) з посівною машиною, яка має множину індивідуальних висівних органів (3), кожен з яких призначений і виконаний з можливістю виконання посівного ряду (4), причому ця машина або зчіпка (2) виконана з можливістю селективно або принаймні тимчасово переривати один, кілька або всі посівні ряди (4) шляхом блокування і, можливо, відкидання відповідного(их) органу(ів), яка відрізняється тим, що машина або зчіпка (2) оснащена засобами управління, які містять комп'ютерний засіб, виконаний з можливістю застосовувати віртуальний план призначеної для засівання ділянки (1) і розробляти, і виконувати протокол переміщення і роботи зазначеної машини або зчіпки (2) для здійснення контрольованого засівання з селективним виконанням технологічної колії на всій ділянці (1) залежно від траєкторій ходових органів машини(машин) або зчіпки(ок), яка(і) здійснюють операцію(ї), наступну(ні) за засіванням цієї ділянки.

7. Система за п. 6, яка відрізняється тим, що посівна машина, або зчіпка (2) є роботизованою машиною, яка працює в автономному режимі, в напівавтономному режимі або є керованою дистанційно.



Фіг. 3

(21) а 2022 04744

(22) 10.05.2021

(51) МПК

A01C 5/06 (2006.01)

A01C 7/20 (2006.01)

(31) 63/026,957

(32) 19.05.2020

(33) US

(85) 13.12.2022

(86) PCT/IB2021/053942, 10.05.2021

(71) ПРЕСІЖН ПЛАНТИНГ ЛЛК (US)

(72) Кох Дейл (US), Урбаняк Дуглас (US)

(54) ВУЗОЛ РЕВЕРСИВНОГО ПРИСТОСУВАННЯ ДЛЯ НАСІННЕВОЇ БОРОЗНИ

(57) 1. Реверсивне пристосування для насінневої борозни, що включає:

монтажну раму, яку можна оперативнo з'єднати з додатковим монтажним кронштейном;

раму, з'єднану з монтажною рамою, причому рама має першу сторону та другу сторону;

корпус горловини, що містить горловину, при цьому корпус горловини нерухомо з'єднаний з каркасом або корпус горловини з'єднаний з монтажною рамою; хвостова частина, з'єднана з корпусом горловини; стійка; та

гачок; причому гачок зачіпляється зі стійкою; та де одне із:

(i) стійка розташована між першою стороною та другою стороною, та корпус горловини додатково містить гачок; або

(ii) гачок містить перший гачок і другий гачок, перша сторона містить перший гачок, друга сторона містить другий гачок, та корпус горловини додатково містить сріжку.

2. Реверсивне пристосування для насінневої борозни за пунктом 1, яке додатково містить монтажний кронштейн і опорну раму.

3. Реверсивне пристосування для насінневої борозни за пунктом 2, яке додатково містить висівну секцію обробки рядка, причому висівна секція обробки рядка має вузол відкривання, сконфігурований для відкривання насінневої борозни на поверхні ґрунту, коли висівна секція обробки рядка просувається в напрямку руху вперед, причому монтажний кронштейн є кріпиться до хвостовика висівної секції обробки рядка, а опорна рама з'єднується з рамою висівної секції обробки рядка.

4. Реверсивне пристосування для насінневої борозни за пунктом 1, яке додатково містить монтажний кронштейн, висівну секцію обробки рядка, причому висівна секція обробки рядка має вузол відкривання, сконфігурований для відкривання насінневої борозни на поверхні ґрунту, коли висівна секція обробки рядка просувається в напрямку руху вперед, де монтажний кронштейн містить з'єднувач монтажного кронштейна та з'єднувач висівної секції обробки рядка, причому з'єднувач висівної секції обробки рядка з'єднується з рамою секції обробки рядка, та де реверсивне пристосування для насінневої борозни з'єднане зі з'єднувачем монтажного кронштейна.

5. Реверсивне пристосування для насінневої борозни за пунктом 3 або 4, в якому, коли висівна секція обробки рядка реверсує в напрямку, протилежному напрямку руху вперед, пристосування для насінневої борозни переміщується з нормального робочого положення в реверсивне положення, таким чином уникаючи пошкодження пристосування для насінневої борозни, та гачок входить зачеплення зі стійкою.

6. Реверсивне пристосування для насінневої борозни за будь-яким одним із пунктів 1, 2, 3 або 5, в якому стійка розташована між першою стороною та другою стороною, та корпус горловини додатково містить гачок.

7. Реверсивне пристосування для насінневої борозни за будь-яким із пунктів 1, 2, 3, 5 або 6, в якому корпус горловини нерухомо з'єднаний із рамою.

8. Реверсивне пристосування для насінневої борозни за будь-яким одним із пунктів 1, 2, 3, 5, 6 або 7, в якому монтажна рама має виїмку, яка входить в зачеплення з фланцем монтажного кронштейна для кріплення монтажної рами до монтажного кронштейна.

9. Реверсивне пристосування для насінневої борозни за будь-яким одним із пунктів 1, 2, 3, 5, 6, 7 або 8, в якому монтажна рама з'єднана з опорною рамою.

10. Реверсивне пристосування для насінневої борозни за будь-яким одним із пунктів 1-5, в якому гачок містить перший гачок і другий гачок, перша сторона містить перший гачок, друга сторона містить другий гачок, а корпус горловини додатково містить стійку.

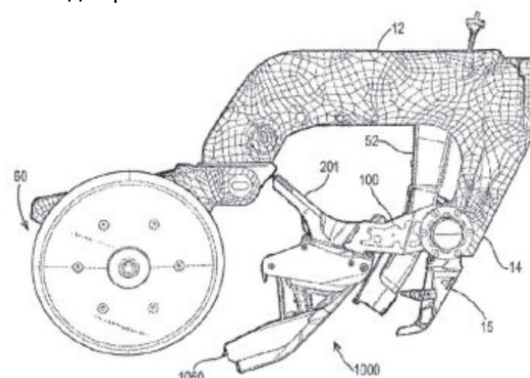
11. Реверсивне пристосування для насінневої борозни за пунктом 10, в якому корпус горловини є єдиним цілим з монтажною рамою.

12. Реверсивне пристосування для насінневої борозни за будь-яким одним із пунктів 2, 3, 4, 5, 10 або 11, в якому монтажна рама має виступ, який входить в зачеплення з монтажним кронштейном для кріплення монтажної рами до монтажного кронштейна.

13. Реверсивне пристосування для насінневої борозни за будь-яким одним із пунктів 2, 3, 5, 10, 11 або 12, в якому рама має з'єднання для з'єднання з опорним кронштейном.

14. Реверсивне пристосування для насінневої борозни за будь-яким одним із пунктів 4, 10, 11 або 12, в якому рама має з'єднання для з'єднання з монтажним кронштейном.

15. Реверсивне пристосування для насінневої борозни за будь-яким попереднім пунктом, в якому хвостова частина має верхню частину, яка є частиною корпусу горловини, та нижню частину, яка відокремлена від верхньої частини.



фиг. 3В

(21) а 2023 04798

(22) 14.02.2022

(51) МПК (2024.01)

A01C 7/10 (2006.01)

A01B 79/00

A01C 21/00

A01C 7/08 (2006.01)

(31) 63/159,993

(32) 12.03.2021

(33) US

(31) 63/183,118

(32) 03.05.2021

(33) US

(85) 08.02.2024

(86) PCT/IB2022/051291, 14.02.2022

(71) ПРЕСІЖН ПЛАНТИНГ ЛЛК (US)

(72) О'Роурк Брендан (US), Франк Вільям (US), Грей Теннер (US), Джеллісон Джонатан (US), Аллгайер Раян (US)

(54) СПОСОБИ ТА СИСТЕМИ ВИМІРЮВАННЯ РОБОЧОГО ЦИКЛУ ТА ЧАСТОТИ ІМПУЛЬСІВ ДАТЧИКІВ ДЛЯ ВИЗНАЧЕННЯ ПОКАЗНИКІВ НАСІННЯ АБО ЧАСТИНОК

- (57) 1. Електрична система керування, яка містить: пристрій відображення для відображення даних; принаймні один датчик для вимірювання робочого циклу та для вимірювання частоти імпульсів для визначення потоку продукту або частинок через лінію продукту або частинок сільськогосподарського знаряддя; та логіка обробки, з'єднана щонайменше з одним датчиком, логіка обробки налаштована для визначення кількості продукту або частинок, що протікають через лінію продукту або частинок сільськогосподарського знаряддя на основі вимірюного робочого циклу та вимірюної частоти імпульсів щонайменше одного датчика.
2. Електрична система керування за пунктом 1, в якій логіка обробки сконфігурована для обчислення частоти продукту або частинок через лінію продукту або частинок на основі частоти імпульсів і робочого циклу.
3. Електрична система керування за пунктом 2, в якій частота продукту або частинок дорівнює частоті імпульсів, поділеній на (1 - робочий цикл).
4. Електрична система керування за пунктом 1, в якій логіка обробки сконфігурована для обчислення імпульсу частинок для вказівки імпульсу на частинку на основі робочого циклу та частоти імпульсів.
5. Електрична система керування за пунктом 4, в якій логіка обробки сконфігурована для обчислення частоти частинок на основі робочого циклу та імпульсу частинок.
6. Електрична система керування за пунктом 1, в якій логіка обробки налаштована для визначення величини продукту або частинок на основі робочого циклу на ділянці та для відображення величини продукту або частинок на основі кількості продукту або частинок, визначених у різних місцезнаходженнях GPS щоб створити просторову карту для сільськогосподарського поля.
7. Електрична система керування за пунктом 6, в якій логіка обробки налаштована на визначення показника однорідності продукту або частинок (%), який обчислюється як віднімання 100 (варіація продукту або частинок високого рядка плюс абсолютне значення варіації продукту або частинок низького рядка), де пристрій відображення відображає в інтерфейсі користувача показник однорідності продукту або частинок, який показує однорідність продукту або частинок у різних секціях обробки рядків сільськогосподарського знаряддя з датчиком, розміщеним на секціях обробки рядків сільськогосподарського знаряддя.
8. Електрична система керування за пунктом 2, в якій частота продукту або частинок використовується для обчислення очікуваної кількості продукту або частинок на основі відомих змінних, включаючи швидкість руху у рядках і величина міжряддя для рядків у межах сільськогосподарського поля.
9. Електрична система, яка складається із: щонайменше, одного датчика для визначення потоку насіння або частинок у лінії потоку сільськогосподарського знаряддя; модуль для прийому даних датчика щонайменше від одного датчика; та логіка обробки, з'єднана з модулем, логіка обробки налаштована для визначення вимірюного робочого циклу та вимірюної частоти імпульсів з виходу дат-

чика щонайменше одного датчика та для визначення частоти насіння або частинок на основі вимірюного робочого циклу та вимірюної частоти імпульсів датчика.

10. Електрична система за пунктом 9, в якій логіка обробки сконфігурована для обчислення частоти насіння або частинок через лінію насіння або частинок на основі частоти імпульсів і робочого циклу.

11. Електрична система за пунктом 10, в якій частота насіння або частинок дорівнює частоті імпульсів, поділеній на (1 - робочий цикл).

12. Електрична система за пунктом 9, в якій логіка обробки сконфігурована для обчислення імпульсу частинок для зазначення імпульсу на частинку на основі робочого циклу та частоти імпульсу, при цьому логіка обробки сконфігурована на визначення показника величини насіння або частинок як робочий цикл на площу та для визначення показника однорідності насіння або частинок (%), який розраховується як 100 віднімання (варіації насіння або частинок у високому рядку плюс абсолютне значення варіації насіння або частинок у низькому рядку).

13. Електрична система за пунктом 12, в якій логіка обробки сконфігурована для обчислення частоти частинок на основі робочого циклу та імпульсу частинок.

14. Комп'ютерно-реалізований спосіб моніторингу датчика для визначення показників насіння або частот, що включає:

вимірювання робочого циклу та вимірювання частоти імпульсів щонайменше одного датчика для визначення потоку насіння або частинок через лінію насіння/продукту або частинок сільськогосподарського знаряддя;

визначення частоти насіння або частоти частинок на основі вимірюної частоти імпульсів і вимірюного робочого циклу; та

оцінка кількості насіння або частинок, що протікають через лінію насіння/продукту або частинок сільськогосподарського знаряддя, на основі частоти насіння або частинок та інших відомих змінних, включаючи швидкість руху у рядках і величину між рядками для сільськогосподарського знаряддя.

15. Комп'ютерно-реалізований спосіб за пунктом 14, який додатково містить:

відображення принаймні одного показника насіння або частинок, включаючи величину або однорідність у різних секціях обробки рядків сільськогосподарського знаряддя принаймні одного датчика в конкретних GPS-місцезнаходженнях для створення просторової карти для сільськогосподарського поля.

16. Комп'ютерно-реалізований спосіб за пунктом 14, який додатково містить:

відображення показника датчика засмічення від кожного датчика засмічення для різних секцій обробки рядків сільськогосподарського знаряддя в конкретних GPS-місцезнаходженнях для створення просторової карти засмічення для сільськогосподарського поля.

17. Комп'ютерно-реалізований спосіб за пунктом 14, який додатково містить:

визначення показника величини насіння або частинок як робочого циклу на ділянці.

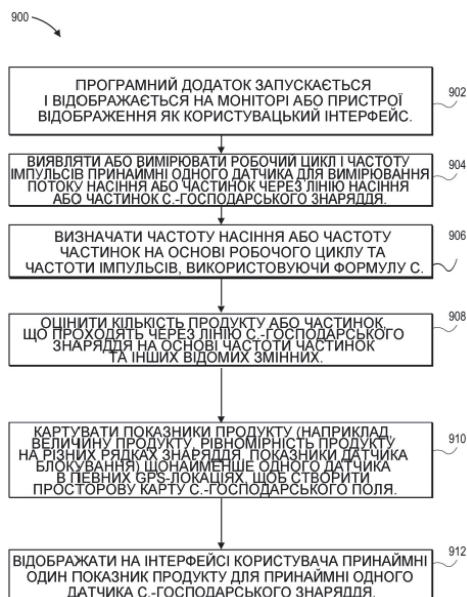
18. Комп'ютерно-реалізований спосіб за пунктом 14, який додатково містить:

визначення показника однорідності насіння або частинок для вимірювання того, наскільки рівномірним є розмір насіння або частинок у різних секціях обробки рядків сільськогосподарського знаряддя.

19. Комп'ютерно-реалізований спосіб за пунктом 18, у якому показник однорідності насіння або частинок (%) обчислюється як 100 відняти (мінливість насіння або частинок у високому рядку плюс абсолютне значення мінливості насіння або частинок у низькому рядку).

20. Комп'ютерно-реалізований спосіб за пунктом 19, у якому варіація насіння або часток у низьких рядках (%) обчислюється як (величина насіння або частинок у низьких рядках віднімається від середньої величини насіння або частинок), поділена на середню величину насіння або частинок, помножена на 100.

21. Комп'ютерно-реалізований спосіб за пунктом 19, у якому рівномірність насіння/висівного матеріалу або частинок високого рядка розраховується як (величина насіння або частинок у високому рядку віднімається від середньої величини насіння або частинок), поділена на середню величину насіння або частинок, помножена на 100.



ФІГ. 9

(21) а 2023 04857
(22) 15.03.2022

(51) МПК (2024.01)
A01C 15/00
B65D 21/08 (2006.01)
B65D 6/26 (2006.01)

(31) 102021000006416
(32) 17.03.2021
(33) ІТ
(85) 16.10.2023

(86) РСТ/ІВ2022/052319, 15.03.2022

(71) МАСКІО ҐАСПАРДО С.П.А. (ІТ)

(72) Маскіо Андреа (ІТ), Дзарамелла Стефано (ІТ)

(54) ПІДНЯТА СТІНКА ДЛЯ БУНКЕРІВ, ЗОКРЕМА ДЛЯ МАШИН ДЛЯ РОЗКИДАННЯ ДОБРІВ, І ОТРИМАНІЙ ТАКИМ ЧИНОМ БУНКЕР

(57) 1. Піднята стінка (6) для бункерів (1), зокрема для машин для розкидання добрив, яка містить щонайменше одну панель (7) щонайменше з першим кінцем (7a) і другим кінцем (7b), які розташовані зі взаємним з'єднанням з відповідними кінцями (7b, 7a) щонайменше однієї сусідньої панелі (7), і ущільнення (13; 17), яке передбачене для встановлення між сусідніми панелями (7) в ділянці зони з'єднання, причому щонайменше в одній панелі (7) утворена ущільнювальна поверхня (8), забезпечена подовжніми краями (9), які виконані з можливістю з'єднання з накладенням на сусідній край (9), яка відрізняється тим, що подовжні краї (9) перериваються в ділянці зони застосування ущільнення (13; 17), де панель (7) продовжується тільки єдиною ущільнювальною поверхнею (8), а ущільнення (13; 17) містить першу поверхню (18), яка призначена для прилягання до ущільнювальної поверхні (8) ззовні бункера (1), другу поверхню (19), призначену для прилягання до ущільнювальної поверхні (8) всередині бункера (1), перемичку (20) між першою поверхнею (18) і другою поверхнею (19), яка обмежує канал (21) між поверхнями (18, 19), в якому розміщена ущільнювальна поверхня (8) щонайменше однієї із сусідніх панелей (7) для усунення і блокування зазора (12), який утворився внаслідок переривання кромки (9).

2. Піднята стінка (6) за п. 1, в якій ущільнення (13; 17) має куласту форму.

3. Піднята стінка (6) за п. 2, в якій канал (21) має форму, яка дозволяє приймати чотири ущільнювальні поверхні (8) чотирьох відповідних сусідніх панелей (7), як в подовжньому, так і в накладеному стані.

4. Піднята стінка (6) за будь-яким із попередніх пунктів, в якій перша поверхня (18) має більшу протяжність, ніж друга поверхня (19), так що вона виступає вперед відносно її проекції в площині першої поверхні (18) і виступає за межі зазора (12), утвореного завдяки перериванню кромки (9).

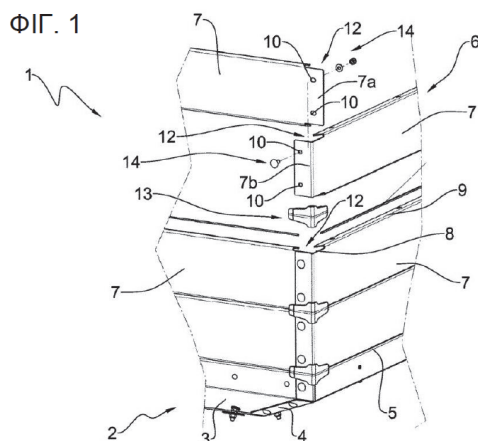
5. Піднята стінка (6) за будь-яким із пп. 2-4, в якій канал (21) містить частину, яка містить зону (31) накладення, в якій канал (21) має подвійну ширину відносно іншої частини каналу (21), так що зона (31) накладення має можливість приймати дві накладені одна на одну ущільнювальні поверхні (8), а інша частина може приймати одну з ущільнювальних поверхонь (8).

6. Піднята стінка (6) за п. 5, в якій перша поверхня (18) має зігнуту ділянку (30) в ділянці кінця зони (31) накладення.

7. Піднята стінка (6) за будь-яким із попередніх пунктів, в якій ущільнення (13; 17) виготовлено із пластикового матеріалу.

8. Піднята стінка (6) за п. 6, в якій перша поверхня (18) ущільнення (13; 17) в ділянці зігнутого контура (30) має таку форму, щоби щільно прилягати до відповідної ущільнювальної поверхні (8) її кінцевою частиною (22), яка проходить таким чином, щоб закрити ззовні частину ущільнювальних поверхонь (8), в яких присутній край (9).

9. Бункер (1), який містить основу (2) бункера, на яку накладено щонайменше одне кільце (6) піднятих стінок, виконане з піднятих стінок (6) за одним будь-яким із попередніх пунктів.



(21) а 2023 05490 (51) МПК (2024.01)
 (22) 19.05.2022 А01N 43/16 (2006.01)
 А01N 25/00
 А01P 7/04 (2006.01)

(31) 21174695.3
 (32) 19.05.2021
 (33) EP
 (85) 27.11.2023
 (86) РСТ/EP2022/063519, 19.05.2022
 (71) КВС СААТ СЕ & КО. КГ'АА (DE)
 (72) Гольцфус Констанце (DE)
 (54) ВИКОРИСТАННЯ ЕКСТРАКТУ КВАСІЇ (QUASSIA)
 ДЛЯ ОБРОБКИ НАСІННЯ В ЯКОСТІ ІНСЕКТИЦИДУ
 (57) 1. Насіння оброблене екстрактом квасії або принаймні одним квасиноїдом, або композицією, що містить екстракт квасії або принаймні один квасиноїд, яке відрізняється тим, що екстракт квасії або компоненти екстракту, або принаймні один квасиноїд, зокрема квасин, абсорбується на насінні і/або абсорбується в насіння.

2. Насіння за п. 1, яке відрізняється тим, що воно вкрите екстрактом квасії або принаймні одним квасиноїдом, або композицією, що містить екстракт квасії або принаймні один квасиноїд, необов'язково в комбінації з одним або декількома додатковими активними агентами і/або добавками.

3. Насіння за п. 2, яке відрізняється тим, що додаткові активні агенти вибрані з фітохімічних і протимікробних агентів, зокрема бактерицидів, протипаразитарних засобів і фунгіцидів, таких як-от металаксил, металаксил-М, іпконазол, тірам, зіраме, флудіоксоніл, протіокназол і їх комбінації, переважно Redigo M, Maxim XL, Maxim Quattro, Lumiflex, Thiram і/або Korit; і/або

тим, що добавки включають клеючі агенти, переважно клеючі агенти на основі природних смол, клеючі агенти на основі лігнінсульфонату, клеючі агенти на основі полімерів і/або клеючі агенти на водній основі, такі як-от Sepiret®, Peridiam® Quality, Peridiam® Active, FKL®, Disco L-450; Disco L-1101, Agifix або FKL (FMC).

4. Насіння за будь-яким з пп. 1-3, яке відрізняється тим, що квасиноїди, зокрема квасин, присутні у кількості, ефективній для забезпечення захисту від пошкодження спричиненого комахами, зокрема дротяниками, хлібними жуками або капустяними білками.

5. Насіння за будь-яким з пп. 1-4, яке відрізняється тим, що схожість насіння є порівняльною з необробленим насінням.

6. Рослина або її частина, вирощена з насіння за будь-яким з пп. 1-5, яка відрізняється тим, що рослина або її частина містить компоненти екстракту квасії, зокрема квасин, і/або принаймні один інший квасиноїд і необов'язково з додаванням одного або кількох додаткових активних агентів і/або добавок, переважно, як визначено в п. 3, формули зокрема бензонат денатонію.

7. Застосування екстракту квасії або принаймні одного квасиноїду для захисту насіння або рослини, переважно паростків, від пошкодження, спричиненого комахами, необов'язково в комбінації з одним або декількома додатковими активними агентами і/або добавками, переважно як визначено в п. 3 формули, зокрема бензонат денатонію.

8. Спосіб захисту насіння від пошкодження, спричиненого комахами, який відрізняється тим, що включає контактування насіння з екстрактом квасії або принаймні одним квасиноїдом, або композицією, що містить екстракт квасії або принаймні один квасиноїд, необов'язково в комбінації з одним або декількома додатковими активними агентами і/або добавки, переважно, як визначено в п. 3, зокрема бензонат денатонію.

9. Спосіб за п. 8, який відрізняється тим, що екстракт квасії або принаймні один квасиноїд використовують у кількості від 5 до 500 г/50 000 зерен, від 10 до 300 г/50 000 зерен або від 30 до 150 г на 50 000 зерен, зокрема від 50 до 200 г на 50 000 зерен.

10. Спосіб за пп. 8-9, який відрізняється тим, що екстракт квасії або принаймні один квасиноїд, або композицію, що містить екстракт квасії або принаймні один квасиноїд, використовують у вигляді твердого порошку або у вигляді рідкої композиції, яка додатково містить клеючий агент.

11. Спосіб за п. 10, який відрізняється тим, що рідка композиція містить екстракт квасії квасин.

12. Спосіб забезпечення захисту рослини від пошкодження спричиненого комахами, який включає етапи: а) забезпечення насіння за будь-яким з пп. 1-5 або насіння, одержаного або одержаного за способом за будь-яким з пп. 8-11, і б) вирощування рослини з насіння а).

13. Спосіб за п. 12, який відрізняється тим, що рослина на етапі б) є рослиною за п. 6.

14. Спосіб боротьби з пошкодженням, спричиненим комахами на насінні або рослинах у сільськогосподарській зоні, який включає такі етапи: а) висівання насіння за будь-яким з пп. 1-5 або насіння, одержаного або одержаного способом за будь-яким з пп. 8-11, на сільськогосподарській ділянці, і б) вирощування рослин з насіння,

який відрізняється тим, що одну або обидва етапи а) і б) виконують за умов зараження комахами і/або личинками комах; причому, кількість рослин на зазначеній сільськогосподарській ділянці є вищою, ніж за тих самих умов на порівнянній сільськогосподарській ділянці з необробленим насінням або рослинами, вирощеними з необробленого насіння,

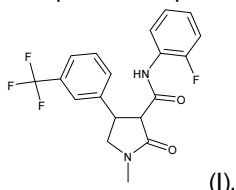
при цьому, зокрема, кількість рослин на зазначеній сільськогосподарській ділянці становить щонаймен-

ше на 5 % або щонайменше на 10 %, переважно щонайменше на 20 %, а більш переважно щонайменше на 30 % більше, ніж на порівняльній сільськогосподарській ділянці з необробленим насінням або рослинами, вирощеними з необробленого насіння.

15. Композиція для обробки насіння, яка містить екстракт квасії або щонайменше один квасиноїд і щонайменше один клеючий агент, необов'язково в комбінації з одним або кількома додатковими активними агентами, яка відрізняється тим, що клеючі агенти і додаткові активні агенти переважно є такими, як визначено в п. 3.

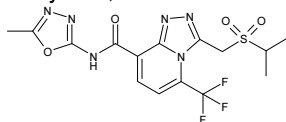
(21) а 2023 05814 (51) МПК (2024.01)
(22) 02.05.2022 A01N 43/36 (2006.01)
A01N 43/82 (2006.01)
A01P 13/00

(31) 21173152.6
(32) 10.05.2021
(33) EP
(85) 01.12.2023
(86) PCT/EP2022/061733, 02.05.2022
(71) СІНГЕНТА КРОП ПРОТЕКШН АГ (CH)
(72) Уейлз Джеффри Стівен (GB), Холлоуей Томас Едвард (GB), Уоткінс Мелані Джейн (GB)
(54) ГЕРБІЦИДНІ КОМПОЗИЦІЇ
(57) 1. Композиція, яка містить як компонент (A) сполуку формули (I) або її агрохімічно прийнятну сіль,



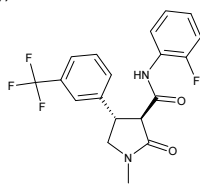
(I),

і як компонент (B) сполуку формули (II) або її агрохімічно прийнятну сіль,



(II).

2. Композиція за п. 1, де вагове співвідношення компонента (A) і компонента (B) становить від 0,01:1 до 100:1, від 0,025:1 до 20:1 або від 1:30 до 16:1.
3. Композиція за п. 2, де вагове співвідношення A:B становить від 8:1 до 1:8, від 8:1 до 1:5, приблизно 2:1, приблизно 1,6:1 або приблизно 1:1.
4. Композиція за будь-яким із попередніх пунктів, де сполука формули (I) характеризується структурою формули (I-A),



(I-A).

5. Агрохімічна композиція, яка містить гербіцидно ефективну кількість композиції за будь-яким із пп. 1-4.
6. Композиція за п. 5, яка додатково містить щонайменше один додатковий активний інгредієнт.

7. Композиція за п. 6, де щонайменше один додатковий активний інгредієнт передбачає щонайменше один додатковий пестицид.

8. Композиція за п. 7, де додатковий пестицид являє собою гербіцид або антидот гербіциду.

9. Композиція за будь-яким із пп. 5-8, яка додатково містить прийнятну з погляду сільського господарства допоміжну речовину для складання та/або агрохімічно прийнятний розріджувач або носій.

10. Спосіб забезпечення контролю росту небажаних рослин, який передбачає застосування гербіцидно ефективної кількості композиції за будь-яким із пп. 1-9 щодо небажаних рослин, їхніх частин або місця їх зростання.

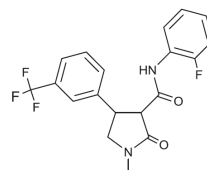
11. Спосіб за п. 10, де компонент (A) застосовують у кількості 50-400 г/га, і компонент (B) застосовують у кількості 50-250 г/га.

12. Спосіб за п. 10 або п. 11, де компонент (A) і компонент (B) є єдиними гербіцидно-активними інгредієнтами в композиції.

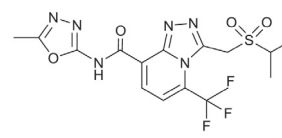
13. Застосування композиції за будь-яким із пп. 1-9 як гербіциду.

14. Склад, який містить композицію за будь-яким із пп. 1-4, що містить від 0,01 до 90 % за вагою активних засобів, від 0 до 25 % прийнятної з погляду сільського господарства поверхнево-активної речовини та від 10 до 99,9 % твердих або рідких інертних та допоміжних речовин для складання.

15. Концентрована композиція для розрідження користувачем, яка передбачає композицію за будь-яким із пп. 1-4, що містить від 2 до 80 %, переважно від приблизно 5 до 70 % за вагою активних засобів.



(I)



(II)

A 23

(21) а 2023 04507 (51) МПК
(22) 07.03.2022 A23F 5/04 (2006.01)
A23F 5/46 (2006.01)

(31) 63/158,972
(32) 10.03.2021
(33) US
(31) 21163616.2
(32) 19.03.2021
(33) EP
(85) 25.09.2023
(86) PCT/EP2022/055676, 07.03.2022
(71) СОСЬЕТЕ ДЕ ПРОДЮІ НЕСТЛЕ С.А. (CH)
(72) Мора Федеріко (CH), Давідек Томас (CH), Полстер Йоханнес (CH)

(54) АРОМАТИЗОВАНЕ КАВОВЕ ЗЕРНО

- (57)** 1. Спосіб приготування ароматизованих обсмажених кавових зерен, який включає:
- зниження вмісту етанолу в ароматизованому алкогольному напої до рівня нижче 1 мас. % для отримання ароматизованого алкогольного напою зі зниженим вмістом алкоголю,
 - контакт ароматизованого алкогольного напою зі зниженим вмістом алкоголю з кавовими зернами,
 - настоювання кавових зерен в ароматизованому алкогольному напої зі зниженим вмістом алкоголю з отриманням настояних кавових зерен,
 - обсмажування настояних кавових зерен з отриманням ароматизованих обсмажених кавових зерен.
2. Спосіб за п. 1, де ароматизований алкогольний напій вибирають із групи, що складається з вина, пива, віскі, бренді, рому, текили та джину.
3. Спосіб за п. 1 або п. 2, де настояні кавові зерна висушують перед обсмажуванням.
4. Спосіб за будь-яким із пп. 1-3, де ароматизований алкогольний напій зі зниженим вмістом алкоголю змішують із кавовими зернами у ваговому співвідношенні кавових зерен до ароматизованого алкогольного напою зі зниженим вмістом алкоголю від 99:1 до 4:1.
5. Спосіб за будь-яким із пп. 1-4, де кавові зерна настоюють в ароматизованому алкогольному напої зі зниженим вмістом алкоголю протягом періоду від 10 хвилин до 80 годин.
6. Спосіб за будь-яким із пп. 1-5, де настояні кавові зерна обсмажують з отриманням легко обсмажених або середньо-темно обсмажених зерен.
7. Спосіб за будь-яким із пп. 1-6, де ароматизовані обсмажені кавові зерна подрібнюють.
8. Спосіб за п. 7, де подрібнені ароматизовані обсмажені кавові зерна засипають у контейнер, причому цей контейнер призначено для приготування напою під час встановлення в пристрій для приготування напоїв.
9. Спосіб за будь-яким із пп. 1-8, де вміст етанолу в ароматизованому алкогольному напої знижують випарюванням.
10. Спосіб за будь-яким із пп. 1-8, де вміст етанолу в ароматизованому алкогольному напої знижують за допомогою мембрани.
11. Спосіб за будь-яким із пп. 1-10, де рівень етилкарбамату ароматизованих обсмажених кавових зерен становить менше 0,3 мг/кг.
12. Обсмажені настояні на ароматизованому алкогольному напої кавові зерна, які мають рівень етилкарбамату менше 0,3 мг/кг.
13. Обсмажені настояні на ароматизованому алкогольному напої кавові зерна за п. 12, де обсмажені настояні на ароматизованому алкогольному напої кавові зерна являють собою частково обсмажені зерна для застосування в подальшому обсмажуванні.
14. Контейнер, який містить обсмажені настояні на ароматизованому алкогольному напої кавові зерна за п. 12, де контейнер призначено для приготування напою за умови його введення в пристрій для приготування напоїв.
15. Застосування ароматизованого алкогольного напою зі зниженим вмістом алкоголю як засобу для настоювання кавових зерен.

(21) а 2023 05792**(22) 16.05.2022****(51) МПК (2024.01)****A23J 1/00****A23J 1/14 (2006.01)****A23J 3/14 (2006.01)****(31) 2028223****(32) 17.05.2021****(33) NL****(85) 30.11.2023****(86) PCT/EP2022/063205, 16.05.2022****(71) НАПІФЕРІН БІОТЕХ СП. З О.О (PL)****(72)** Внуковски Пйотр (NL), Козловска Магдалена (PL), Станчик Лукаш (PL), Рашвал Данута Алина (PL)**(54) СПОСІБ ОТРИМАННЯ ПРОДУКТІВ, ЗБАГАЧЕНИХ БІЛКАМИ, ІЗ РОСЛИННОГО МАТЕРІАЛУ**

- (57)** 1. Спосіб отримання продукту (42, 44), збагаченого рослинними білками, з рослинного матеріалу (1), в якому зазначений рослинний матеріал (1) містить від 10 до 50 мас. % білків у перерахунку на суху масу, який включає наступні етапи:
- подрібнення або розтирання рослинного матеріалу (1) для отримання твердої біомаси (2);
 - екстрагування твердої біомаси (2) водним першим розчинником, що містить щонайменше 90 мас. % води, від загальної маси першого розчинника, для отримання суміші першої твердої фракції та першої рідкої фракції;
 - відділення першої рідкої фракції (11) від першої твердої фракції (12);
 - додавання спиртового другого розчинника, що містить щонайменше 50 мас. % спирту, що має від 1 до 5 атомів вуглецю, який змішується з водою при кімнатній температурі, у розрахунку на загальну масу другого розчинника, при цьому
 - додавання включає додавання другого розчинника до першої твердої фракції (12), або при цьому
 - додавання другого розчинника передуює концентрування першої рідкої фракції (11) для отримання білкового концентрату (11b) першої рідкої фракції, причому додавання включає додавання другого розчинника до зазначеного концентрату (11b);
 - розділення будь-якої із сумішей, отриманих додаванням другого розчинника на етапі d), на другу рідку фракцію (21, 23) і другу тверду фракцію (22, 24);
 - додавання третього розчинника до другої твердої фракції (22, 24), отриманої на етапі e), при цьому зазначений третій розчинник містить неполярний і ліпофільний органічний естер, що містить до 5 атомів вуглецю, причому органічний естер щонайменше частково змішується з першим розчинником і повністю змішується з другим розчинником при кімнатній температурі, причому кількість третього розчинника вибирають таким чином, щоб вся рідка фаза не розділялася на окремі рідкі фази;
 - розділення суміші, отриманої на етапі f), на третю рідку фракцію (31, 33), яка також називається відпрацьованим третім розчинником (31, 33), та третю тверду фракцію (32, 34);
 - висушування третьої твердої фракції (32, 34), отриманої на етапі g), для отримання збагаченого рослинним білком продукту (42, 44), процес, характеризується тим, що третій розчинник містить азеотропну суміш, що містить, у розрахунку на загальну масу третього розчинника:
 - від 64 до 90 мас. % органічного естеру, та

- від 10 до 35 мас. % спирту, що містить від 1 до 5 атомів вуглецю, та

- менше 10 мас. % води.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що кількість продукту (42, 44), збагаченого рослинним білком, отриманого в процесі, становить щонайменше 1 кг, переважно щонайменше 5 кг, більш переважно щонайменше 10 кг, більш переважно щонайменше 20 кг, найбільш переважно більше ніж 100 кг на партію під час періодичного процесу виробництва або отриманого за годину під час безперервного процесу виробництва.

3. Спосіб за п. 1 або 2, який **відрізняється** тим, що кількість твердої біомаси (2), екстрагованої під час технологічного процесу, становить щонайменше 10 кг, переважно щонайменше 20 кг, більш переважно щонайменше 30 кг, більш переважно щонайменше 40 кг, більш переважно щонайменше 50 кг, більш переважно щонайменше 100 кг, більш переважно щонайменше 200 кг, ще більш переважно щонайменше 500 кг, найбільш переважно щонайменше 1000 кг на партію під час періодичного процесу виробництва або екстрагованої за годину під час безперервного процесу виробництва.

4. Спосіб за будь-яким з пп. 1-3, який **відрізняється** тим, що азеотропна суміш містить від 65 до 85 мас. % органічного естеру, переважно від 70 до 84 мас. % органічного естеру, більш переважно від 75 до 83 мас. % органічного естеру, навіть більш переважно від 76 до 82,5 мас. % органічного естеру, найбільш переважно від 76,5 до 82,2 мас. % органічного естеру, вираженого як масова частка органічного естеру в азеотропній суміші.

5. Спосіб за будь-яким із пп. 1-4, який **відрізняється** тим, що органічний естер являє собою етилацетат.

6. Спосіб за будь-яким із пп. 1-5, який **відрізняється** тим, що азеотропна суміш містить від 12 до 32 мас. %, переважно від 15 до 30 мас. %, більш переважно від 17 до 27 мас. %, більш переважно від 18 до 25 мас. %, навіть більш переважно містить від 19 до 22 % мас. і найбільш переважно містить біля 20 % мас. спирту, що має від 1 до 5 атомів вуглецю, вираженого як масова частка спирту, що містить від 1 до 5 атомів вуглецю, в азеотропній суміші.

7. Спосіб за будь-яким із пп. 1-6, який **відрізняється** тим, що спирт, що містить від 1 до 5 атомів вуглецю, обирається із групи, що складається з метанолу, етанолу, пропанолу, ізопропанолу, бутанолу, ізобутанолу або їх комбінацій, і при цьому спирт, що містить від 1 до 5 атомів вуглецю, переважно являє собою етанол.

8. Спосіб за будь-яким із пп. 1-7, який **відрізняється** тим, що азеотропна суміш містить етилацетат і етанол, переважно містить від 64 до 90 мас. % етилацетату і від 10 до 35 мас. % етанолу, у розрахунку на загальну масу третього розчинника.

9. Спосіб за будь-яким із пп. 1-8, який **відрізняється** тим, що третій розчинник містить менше 7 мас. % води, переважно менше 5 мас. % води, більш переважно менше 2 мас. % води, ще більш переважно менше 1 мас. % води, і найбільш переважно менше 0,5 мас. % води.

10. Спосіб за будь-яким із пп. 1-9, який **відрізняється** тим, що висушування на етапі h) третьої твердої фракції (32, 34) генерує додаткову частину відпрацьованого третього розчинника (41, 43).

11. Спосіб за будь-яким із пп. 1-10, який **відрізняється** тим, що щонайменше частину третього розчинника, доданого на етапі f), відновлюють з будь-чого з наступного: відпрацьованого третього розчинника (31, 33), додаткової частини відпрацьованого третього розчинника (41, 43) або їх комбінації.

12. Спосіб за п. 11, який **відрізняється** тим, що будь-що із наступного: відпрацьований третій розчинник (31, 33), додаткова частина відпрацьованого третього розчинника (41, 43) або їх комбінація, з яких відновлюють частину третього розчинника, доданого на етапі f), містить щонайменше 10 мас. % води, переважно щонайменше 15 мас. % води, більш переважно щонайменше 20 мас. %, навіть більш переважно щонайменше 25 мас. % води, можливо, щонайменше 30 мас. % води.

13. Спосіб за будь-яким із пп. 11-12, який **відрізняється** тим, що вилучення третього розчинника включає застосування робочого тиску, що становить 200 кПа або менше, більш переважно дорівнює атмосферному тиску або є менше, при цьому переважно робочий тиск становить 20-50 кПа.

14. Спосіб за будь-яким із пп. 11-13, який **відрізняється** тим, що вилучення третього розчинника включає етап випаровування, що включає використання випаровувача, переважно обраного із групи, що включає ротаційні випаровувачі, плівкові випаровувачі, скребкові випаровувачі, випаровувачі з падаючою плівкою, випаровувачі з висхідною плівкою, випаровувачі короткого шляху, при цьому переважно використовується випаровувач з падаючою плівкою.

15. Спосіб за будь-яким із пп. 1-14, який **відрізняється** тим, що виконується без використання органічних або мінеральних розчинників, що містять 6 або більше атомів вуглецю, таких як гексан.

16. Спосіб за будь-яким із пунктів 1-15, який **відрізняється** тим, що рослинний матеріал обирається із групи, що складається з насіння олійних культур, включаючи ріпак, канолу, соняшник, сафлор і насіння бавовнику, зернобобових, включаючи сою та інші бобові, квасолі та горох, включаючи нут, червону, зелену, жовту та коричневу сочевицю, та їх комбінацій.

17. Спосіб за будь-яким із пп. 1-16, який **відрізняється** тим, що додавання на етапі d) включає додавання другого розчинника до першої твердої фракції (12), при цьому збагачений рослинним білком продукт (42, 44), отриманий на етапі h), являє собою продукт білка та клітковини (44), що містить рослинний білок і природну клітковину, при цьому переважно загальний вміст рослинного білка і природної клітковини становить щонайменше 30 мас. %, у розрахунку на загальну суху масу продукту білка та клітковини (44).

18. Спосіб за будь-яким із пп. 1-16, який **відрізняється** тим, що

- збагачений рослинним білком продукт (42, 44), отриманий на етапі h), являє собою білковий ізолят (42), при цьому вміст білка становить щонайменше 90 мас. %, переважно щонайменше 95 мас. %, у розрахунку на загальну суху масу білкового ізоляту; і при цьому

- додаванню на етапі d) передують концентрування першої рідкої фракції (11) для отримання білкового концентрату (11b) першої рідкої фракції, причому зазначений концентрат (11b) переважно містить від 50 до 90 мас. % води в розрахунку на загальну масу

зазначеного концентрату (11b) і щонайменше 40 мас. % білка в розрахунку на загальну суху масу зазначеного концентрату (11b), і при цьому додавання включає додавання другого розчинника, що містить щонайменше 90 мас. % спирту, до зазначеного концентрату (11b); та переважно при цьому

- також третій розчинник, доданий на етапі f), переважно містить менше 2 мас. % води, більш переважно менше 1 мас. % води та найбільш переважно менше 0,5 мас. % води, і переважно при цьому також - вміст білка у другій твердій фракції (22), отриманій на етапі e), становить щонайменше 60 мас. %, у розрахунку на загальну суху масу другої твердої фракції (22): та/або

- вміст білка у третій твердій фракції (32), отриманій на етапі g), становить щонайменше 90 мас. %, у розрахунку на загальну суху масу третьої твердої фракції (32).

19. Спосіб за п. 18, який **відрізняється** тим, що білковий ізолят (42) містить щонайменше 70 мас. % нативного рослинного білка у розрахунку на суху масу речовини та переважно містить менше 1 мас. % вуглеводів та/або менше 0,2 мас. % фенольних сполук та/або не містить органічних розчинників або мінеральних розчинників, що мають 6 або більше атомів вуглецю.

20. Застосування способу за будь-яким із пп. 1-19 для отримання рослинного білка для харчових продуктів для людини або корму для тварин.

(54) БАЛЬЗАМ БОЛОТОВА

(57) 1. Бальзам Болотова, що містить воду, сірчану кислоту, соляну кислоту, сік червоного винограду, виноградний оцет, який **відрізняється** тим, що додатково містить бурштинову кислоту, а інгредієнти обрано в такому співвідношенні, мас. %:

Сірчана кислота	1,34
Соляна кислота	0,57
Виноградний оцет	3,2
Сік червоного винограду	5,5
Бурштинова кислота	1
Вода	інше.

2. Спосіб виготовлення бальзаму Болотова, що включає етапи додавання води, сірчаної кислоти, соляної кислоти, виноградного оцту, соку червоного винограду, який **відрізняється** тим, що спосіб містить етап розчину бурштинової кислоти в окремій ємності, етапи попереднього та повторного додавання води, нагріву, перемішування та відстоювання у наступних послідовності та умовах:

додавання 40 % від загального об'єму води у першу ємність;

додавання у першу ємність сірчаної кислоти, 1,34 мас. %; перемішування інгредієнтів у першій ємності до утворення однорідної суміші;

додавання у першу ємність соляної кислоти, 0,57 мас. %; перемішування інгредієнтів у першій ємності до утворення однорідної суміші;

додавання у першу ємність виноградного оцету,
3,2 мас. %;

перемішування інгредієнтів у першій ємності до утворення однорідної суміші:

додавання у першу ємність соку червоного винограду, 5,5 мас. %;

перемішування інгредієнтів у першій ємності до утворення однорідної суміші;

додавання і нагрівання 60 % від загального об'єму води у другій ємності до 600 С;

додавання бурштинової кислоти, 1 мас. %, у другу ємність і перемішування до повного її розчинення;

додавання усіх інгредієнтів з другої ємності у першу ємність:

перемішування інгредієнтів у першій ємності не менш ніж 15 хвилин;

відстоювання інгредієнтів у першій ємності протягом 24 годин.

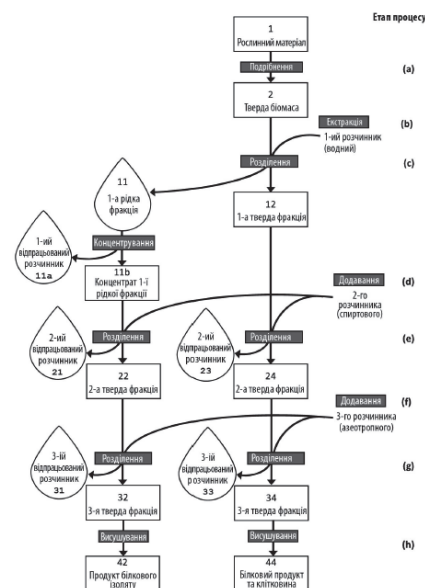


Fig. 1

A 24

(21) a 2022 02967 (51) МПК (2024.01)
(22) 16.08.2022 A23L 2/00
A61K 36/00

(71) ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ "ЦЕНТР БОЛОТОВА" (UA)

(72) Болотов Максим Борисович (UA), Болотов Іларіон Максимович (UA), Болотов Борис Васильович (UA), Руденко Євгеній Вікторович (UA), Чужа Ксенія Вікторівна (UA), Руденко Олег Вікторович (UA)

(21) **a 2023 05669** (51) МПК
(22) 23.05.2022 **A24B 15/16** (2020.01)
A24B 15/167 (2020.01)
A24B 15/28 (2006.01)
A24B 15/42 (2006.01)

(31) 63/193,877
(32) 27.05.2021

(33) US

(85) 21.12.2023

(86) PCT/US2022/030560, 23.05.2022

(71) PAI СТРАТЕДЖІК ХОЛДІНГС ІНК. (US)

(72) Ульріх Джон (US), Роу Дженніфер (US), Девіс Майкл Ф. (US), Каревей Джр. Джон Вілл (US)

(54) КОМПОЗИЦІЯ, ЩО ГЕНЕРУЄ АЕРОЗОЛЬ, ЯКА МІСТИТЬ НІКОТИН ТА КИСЛОТУ АБО СІЛЬ НІКОТИНУ

(57) 1. Композиція, що генерує аерозоль, яка містить матеріал, що генерує аерозоль, при цьому матеріал, що генерує аерозоль, містить:

- від приблизно 1 до приблизно 30 ваг. % нікотину;
 - від приблизно 15 до приблизно 80 ваг. % гелеутворювального засобу;
 - від приблизно 10 до приблизно 60 ваг. % матеріалу для утворення аерозолі;
 - від приблизно 1 до приблизно 30 ваг. % кислоти; і
 - необов'язково наповнювач,
- причому значення ваг. % обчислені у перерахунок на суху вагу; і
- при цьому молярне відношення нікотину до кислоти становить 2,2:1 або менше.

2. Композиція, що генерує аерозоль, за п. 1, яка **відрізняється** тим, що молярне відношення нікотину до кислоти становить 1,5:1 або менше.

3. Композиція, що генерує аерозоль, за п. 1, яка **відрізняється** тим, що молярне відношення нікотину до кислоти становить 1:1 або менше.

4. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким з пп. 1-3, яка **відрізняється** тим, що молярне відношення нікотину до кислоти становить 0,5:1 або більше.

5. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким з пп. 1-4, яка **відрізняється** тим, що кислота включає одну або більше з молочної кислоти, бензойної кислоти, левулінової кислоти і піровиноградної кислоти.

6. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-5, яка **відрізняється** тим, що кислота включає бензойну кислоту.

7. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-6, яка **відрізняється** тим, що нікотин наявний в кількості від приблизно 6 до 30 ваг. %.

8. Композиція, що генерує аерозоль, яка містить матеріал, що генерує аерозоль, при цьому матеріал, що генерує аерозоль, містить:

- від приблизно 5 до приблизно 30 ваг. % солі нікотину;
 - від приблизно 15 до приблизно 80 ваг. % гелеутворювального засобу;
 - від приблизно 10 до приблизно 60 ваг. % матеріалу для утворення аерозолі;
 - необов'язково наповнювач,
- причому значення ваг. % обчислені у перерахунок на суху вагу.

9. Композиція, що генерує аерозоль, яка містить матеріал, що генерує аерозоль, при цьому матеріал, що генерує аерозоль, містить:

- від приблизно 1 до приблизно 30 ваг. % солі нікотину;
 - від приблизно 45 до приблизно 80 ваг. % гелеутворювального засобу;
 - від приблизно 10 до приблизно 54 ваг. % матеріалу для утворення аерозолі;
 - необов'язково наповнювач,
- причому значення ваг. % обчислені у перерахунок на суху вагу.

10. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-9, яка **відрізняється** тим, що матеріал, що генерує аерозоль, містить менше ніж приблизно 10 ваг. % наповнювача.

11. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-10, яка **відрізняється** тим, що матеріал, що генерує аерозоль, містить менше ніж приблизно 5 ваг. % наповнювача.

12. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-11, яка **відрізняється** тим, що матеріал, що генерує аерозоль, містить деревну пульпу.

13. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-11, яка **відрізняється** тим, що матеріал, що генерує аерозоль, не містить наповнювача.

14. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-13, яка **відрізняється** тим, що гелеутворювальний засіб містить одну або більше сполук, вибраних із групи, що містить альгірати, похідні целюлози, камеді, сполуки на основі кремнезему або кремнію, глини та їх комбінації.

15. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-14, яка **відрізняється** тим, що гелеутворювальний засіб містить альгірат та/або карбоксиметилцелюлозу.

16. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-15, яка **відрізняється** тим, що матеріал, що генерує аерозоль, додатково містить засіб для зшивання.

17. Композиція, що генерує аерозоль, за п. 16, яка **відрізняється** тим, що засіб для зшивання містить йони кальцію.

18. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-15, яка **відрізняється** тим, що матеріал, що генерує аерозоль, не містить засобу для зшивання.

19. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-18, яка **відрізняється** тим, що гелеутворювальний засіб наявний в кількості від приблизно 45 до приблизно 70 ваг. %.

20. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-19, яка **відрізняється** тим, що матеріал для утворення аерозолі містить одне або більше з гліцеролу, пропіленгліколю, діетилгліколю, триетилгліколю, тетраетилгліколю, 1,3-бутиленгліколю, еритролу, мезо-еритролу, етилванілату, етиллаурату, діетилсуберату, триетилцитрату, триацетину, суміші діацетину, бензилбензоату, бензилфенілацетату, трибутирину, лаурилату, лауринової кислоти, міристинової кислоти та пропіленкарбонату.

21. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-20, яка **відрізняється** тим, що матеріал для утворення аерозолі містить гліцерол.

22. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-21, яка **відрізняється** тим, що засіб для утворення аерозолі наявний в кількості від приблизно 15 до приблизно 50 ваг. %.

23. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-22, яка **відрізняється** тим, що матеріал, що генерує аерозоль, по суті не містить тютюну.

24. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-23, яка **відрізняється** тим, що матеріал, що генерує аерозоль, наданий у формі плівки.

25. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-23, яка **відрізняється** тим, що матеріал, що генерує аерозоль, наданий у формі смужок, гофрованого листа, зібраного листа або подрібненого листа.

26. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-25, яка **відрізняється** тим, що матеріал, що генерує аерозоль, містить смакоароматичну речовину.

27. Композиція, що генерує аерозоль, за п. 26, яка **відрізняється** тим, що матеріал, що генерує аерозоль, містить від приблизно 1 до приблизно 65 ваг. % смакоароматичної речовини.

28. Композиція, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-27, яка **відрізняється** тим, що композиція, що генерує аерозоль, складається з матеріалу, що генерує аерозоль.

29. Витратний виріб, призначений для використання із системою надання аерозолі без спалювання, причому витратний виріб містить композицію, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-28.

30. Витратний виріб за п. 29, який **відрізняється** тим, що не містить тютюну.

31. Витратний виріб за п. 29 або п. 30, який **відрізняється** тим, що композиція, що генерує аерозоль, складається з нікотину, гелеутворювального засобу, матеріалу для утворення аерозолі, кислоти і необов'язково смакоароматичної речовини і/або необов'язково наповнювача.

32. Витратний виріб за будь-яким з пп. 29-31, який **відрізняється** тим, що містить єдину композицію, що генерує аерозоль, при цьому вказана композиція, що генерує аерозоль, визначена за будь-яким із пп. 1-28.

33. Витратний виріб за будь-яким з пп. 29-32, який **відрізняється** тим, що композиція, що генерує аерозоль, надана у формі плівки.

34. Система надання аерозолі без спалювання, яка містить витратний виріб за будь-яким із пп. 29-33 і пристрій для надання аерозолі без спалювання, причому пристрій для надання аерозолі без спалювання містить пристрій для генерування аерозолі, пристосований для генерування аерозолі з витратного виробу, коли витратний виріб використовується з пристроєм для надання аерозолі без спалювання.

35. Застосування композиції, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-28 у витратному виробі, призначеному для використання із пристроєм для надання аерозолі без спалювання, причому пристрій для надання аерозолі без спалювання містить пристрій для генерування аерозолі, пристосований для генерування аерозолі з витратного виробу, коли витратний виріб використовується з пристроєм для надання аерозолі без спалювання.

36. Суспензія, що містить:

- від приблизно 1 до приблизно 30 ваг. % нікотину;
 - від приблизно 15 до приблизно 80 ваг. % гелеутворювального засобу;
 - від приблизно 10 до приблизно 60 ваг. % матеріалу для утворення аерозолі;
 - від приблизно 1 до приблизно 30 ваг. %, кислоти; та
 - необов'язково наповнювач,
- причому значення ваг. % обчислені у перерахунку на суху вагу; і
- при цьому молярне відношення нікотину до кислоти становить 2,2:1 або менше, і
- розчинник.

37. Суспензія, що містить:

- від приблизно 5 до приблизно 30 ваг. % солі нікотину;
- від приблизно 15 до приблизно 80 ваг. % гелеутворювального засобу;
- від приблизно 10 до приблизно 60 ваг. % матеріалу для утворення аерозолі;
- необов'язково наповнювач,

причому значення ваг. % обчислені у перерахунку на суху вагу, і

- розчинник.

38. Суспензія, що містить:

- від приблизно 1 до приблизно 30 ваг. % солі нікотину;
 - від приблизно 45 до приблизно 80 ваг. % гелеутворювального засобу;
 - від приблизно 10 до приблизно 54 ваг. % матеріалу для утворення аерозолі; і
 - необов'язково наповнювач,
- причому значення ваг. % обчислені у перерахунку на суху вагу, і
- розчинник.

39. Суспензія за п. 36, 37 або 38, яка **відрізняється** тим, що розчинник являє собою воду.

40. Спосіб виготовлення композиції, що генерує аерозоль, за будь-яким з пп. 1-28, причому композиція, що генерує аерозоль, містить матеріал, що генерує аерозоль, при цьому спосіб включає:

(i) поєднання

- від приблизно 1 до приблизно 30 ваг. % нікотину;
 - від приблизно 15 до приблизно 80 ваг. % гелеутворювального засобу;
 - від приблизно 10 до приблизно 60 ваг. % матеріалу для утворення аерозолі;
 - від приблизно 1 до приблизно 20 ваг. %, кислоти; та
 - необов'язково наповнювач,
- при цьому ці значення ваги обчислені в перерахунку на суху вагу; і
- при цьому молярне відношення нікотину до кислоти становить менше ніж 2,2:1, і

- розчинника;

або поєднання

- від приблизно 5 до приблизно 30 ваг. % солі нікотину;
 - від приблизно 15 до приблизно 80 ваг. % гелеутворювального засобу;
 - від приблизно 10 до приблизно 60 ваг. % матеріалу для утворення аерозолі; і
 - необов'язково наповнювач,
- причому ці значення ваги обчислені у перерахунку на суху вагу, і
- розчинника;
- або поєднання

- від приблизно 1 до приблизно 30 ваг. % солі нікотину;

- від приблизно 45 до приблизно 80 ваг. % гелеутворювального засобу;

- від приблизно 10 до приблизно 54 ваг. % матеріалу для утворення аерозолі; і

- необов'язково наповнювач,
- причому значення ваг. % обчислені у перерахунку на суху вагу, і

- розчинника;

(ii) утворення шару суспензії; та

(iii) висушування з утворенням матеріалу, що генерує аерозоль.

41. Композиція, що генерує аерозоль, утворена згідно із способом за п. 40.

42. Спосіб генерування аерозолі, що містить сіль нікотину, з використанням системи надання аерозолі без спалювання за п. 34, причому спосіб включає нагрівання композиції, що генерує аерозоль, необов'язково до температури менше ніж 350 °C.

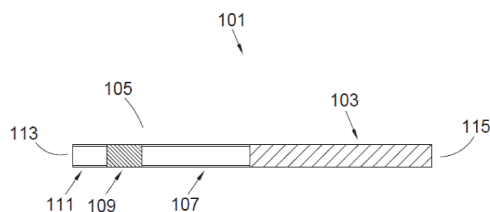


Fig. 1

(21) а 2023 05063 (51) МПК
(22) 28.02.2022 A24F 40/40 (2020.01)

(31) 2021-079876

(32) 10.05.2021

(33) JP

(85) 15.12.2023

(86) PCT/JP2022/008368, 28.02.2022

(71) ДЖАПАН ТОБАККО ІНК. (JP)

(72) Фудзікі Такасі (JP), Каванаґо Хіросі (JP), Наґахама Тору (JP), Аояма Тацунарі (JP), Йосіда Ріо (JP)

(54) БЛОК ЖИВЛЕННЯ ПРИСТРОЮ ГЕНЕРУВАННЯ АЕРОЗОЛЮ

(57) 1. Блок живлення пристрою генерування аерозолю, який містить:

джерело життя:

роз'єм нагрівача, до якого підключений нагрівач, виконаний з можливості нагрівати джерело аерозолію шляхом споживання енергії, що подається від джерела живлення;

контролер, виконаний з можливістю керування подачею енергії від джерела живлення до роз'єму нагрівача:

зарядна ІС, що включає в себе вхідний термінал і зарядний термінал, підключений до джерела живлення і налаштований з можливістю перетворення вхідної енергії на вхідний термінал і виведення енергії від зарядного терміналу;

розетку, що включає в себе термінал джерела живлення та термінал даних і електрично з'єднану із зовнішнім джерелом живлення:

лінію живлення, що з'єднує термінал джерела живлення та вхідний термінал:

лінію передачі даних, що з'єднує термінал даних і контролер:

перші захисні компоненти, передбачені на лінії живлення: і

другий захисний компонент, передбачений на лінії передачі даних, в якому

кількість перших захисних компонентів більше, ніж кількість другого захисного компонента.

2. Блок живлення пристрою генерування аерозолію за п. 1, який додатково містить:

перші захисні компоненти включають заземлюючий елемент, який є елементом, з'єднаним із землею, і незаземлюючий елемент, який не з'єднаний із землею. та

другий захисний компонент включає тільки один із заземлюючого елемента та незаземлюючого елемента.

3. Блок живлення пристрою генерування аерозолію за п. 2, який відрізняється тим, що

другий захисний компонент включає тільки заземлюючий елемент із заземлюючого елемента та незаземлюючого елемента.

4. Блок живлення пристрою генерування аерозолію за п. 2 або 3, який **відрізняється** тим, що термінал джерела живлення, незаземлюючий елемент, заземлюючий елемент і вхідний термінал підключаються в такому порядку до лінії живлення.

5. Блок живлення пристрою генерування аерозолію за будь-яким одним із пп. 1-4, який **відрізняється** тим, що

перші захисні компоненти та другий захисний компонент містять один і той же елемент.

6. Блок живлення пристрою генерування аерозолію за будь-яким одним із пп. 1-4, який **відрізняється** тим, що

перші захисні компоненти та другий захисний компонент не включають один і той же елемент.

7. Блок живлення пристрою генерування аерозолію за будь-яким одним із пп. 1-6, який **відрізняється** тим, що додатково містить:

другу плату, відокремлену від першої плати, в якій контролер і зарядна ІС розташовані на першій платі, і розетка розташована на другій платі.

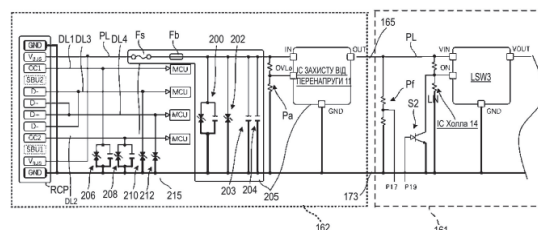
8. Блок живлення пристрою генерування аерозолів за п. 7, який **відрізняється** тим, що перші захисні компоненти та другий захисний компонент розташовані тільки на другій платі з першої платі і другої платі.

9. Блок живлення пристрою генерування аерозолію за п. 7 або 8, який **відрізняється** тим, що друга плата має основну поверхню та вторинну поверхню, яка є задньою поверхнею основної поверхні, розетка засташована на основній поверхні, та перші захисні компоненти розташовані на вторинній поверхні.

10. Блок живлення пристрою генерування аерозолів за п. 9, який **відрізняється** тим, що, принаймні, один або більше з перших захисних компонентів розташовані в зоні, отриманій шляхом виступу розетки з напрямку, ортогонального до другої плати.

11. Блок живлення пристрою генерування аерозолю за п. 9 або 10, який **відрізняється** тим, що другий захисний компонент розташований на основній поверхні.

Fig. 17



(21) а 2023 05080 (51) МПК
(22) 04.03.2022 A24F 40/40 (2020.01)
A24F 40/90 (2020.01)

(31) 2021-079870

(32) 10.05.2021

(33) JP

(85) 11.12.2023

(86) РСТ/JP2022/009447, 04.03.2022

(71) ДЖАПАН ТОБАККО ІНК. (JP)

(72) Аояма Тацунарі (JP), Каванаґо Хіросі (JP), Наґаха-
ма Тору (JP), Фудзікі Такасі (JP), Йосіда Ріо (JP)

**(54) БЛОК ЖИВЛЕННЯ ДЛЯ ПРИСТРОЮ ГЕНЕРУВАН-
НЯ АЕРОЗОЛЮ**

(57) 1. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю, який генерує аерозоль шляхом нагрівання
джерела аерозолю, блок живлення містить:

джерело живлення;

роз'єм, електрично підключений до зовнішнього дже-
рела живлення;

перше навантаження;

мікросхема заряджання, що включає вхідний термі-
нал, підключений до роз'єму, зарядний термінал, під-
ключений до джерела живлення, і вихідний термінал,
під'єднаний до першого навантаження, і налаштова-
ний для перетворення вхідної енергії на вхідний тер-
мінал і виведення перетвореної енергії з зарядно-
го терміналу; та

розрядний шлях, зконфігурована для підключення
джерела живлення та другого навантаження без
проходження через зарядну IC, де
зарядна IC налаштована для подачі енергії, що над-
ходить від джерела живлення до зарядного терміна-
лу на перше навантаження через вихідний термінал.

2. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю за п. 1, який відрізняється тим, що перше і дру-
ге навантаження працюють одночасно.

3. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю за п. 2, який відрізняється тим, що додатково
містить:

першу плату; та

другу плату, відмінну від першої плати, де
зарядна IC і перше навантаження розташовані на
першій платі, та

розрядний шлях забезпечується на другій платі.

4. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю за будь-яким одним із пп. 1-3, який відрізняєть-
ся тим, що

споживана потужність першого навантаження менша,
ніж споживана потужність другого навантаження.

5. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю за п. 4, який відрізняється тим, що друге наван-
таження споживає найбільшу кількість енергії серед
навантажень, передбачених у пристрої генерування
аерозолю.

6. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю за будь-яким одним із пп. 1-3, який відрізня-
ється тим, що в ньому розрядний шлях виконаний з
можливістю підвищення вихідної напруги джерела
живлення та застосування вихідної напруги підвищен-
ня до другого навантаження.

7. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю за п. 6, який відрізняється тим, що додатково
містить:

третє навантаження, підключене до вузла між дже-
релом живлення та другим навантаженням на роз-
рядному шляху та виконане з можливістю роботи від
електроенергії, що подається від вузла.

8. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю за п. 7, який відрізняється тим, що додатково
містить:

роз'єм блоку живлення, до якого підключається дже-
рело живлення;

першу плату;

другу плату, відмінну від першої плати, де
зарядна IC розміщена на першій платі, та
розрядний шлях і третє навантаження забезпечую-
ться на другій платі.

9. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю за будь-яким одним із пп. 1-3, який відрізня-
ється тим, що додатково містить:

перетворювач напруги, підключений між вихідним
терміналом та першим навантаженням і налашто-
ваний на виведення постійної напруги.

10. Блок живлення для пристрою генерування ае-
розолу за п. 9, який відрізняється тим, що зарядна
мікросхема (IC) налаштована на подачу енергії, що
надходить на вхідний термінал, до першого наван-
таження через вихідний термінал, та
перетворювач напруги

збільшує або зменшує вхідну напругу від зарядної
IC для виведення постійної напруги, коли електрич-
на потужність, що надходить від зарядного терміна-
лу, виводиться з вихідного терміналу, та
знижує вхідну напругу від зарядної IC, щоб вивести
постійну напругу, коли електрична потужність, що над-
ходить із вхідного терміналу, виводиться з вихідного
терміналу.

11. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю за п. 9, який відрізняється тим, що перетво-
рювач напруги виконаний з можливістю зниження
вхідної напруги від зарядної мікросхеми (IC) для ви-
ведення постійної напруги.

12. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю за будь-яким із пунктів 1-3, який відрізняється
тим, що додатково містить:

термістор, розташований у контакті з другим наван-
таженням або поблизу нього;

лінія живлення, підключена до терморезистора; та
перемикач навантаження, що включає в себе тер-
мінал керування, підключений до першого наванта-
ження, вхідний термінал, підключений до вихідного
терміналу зарядної IC, та вихідний термінал, підклю-
чений до лінії живлення.

13. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю за будь-яким одним із пп. 1-3, який відрізняєть-
ся тим, що

блок живлення являє собою інгалятор.

14. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю за будь-яким із пп. 1-3, який відрізняється тим, що
перше навантаження являє собою блок мікроконт-
ролера.

15. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю за будь-яким одним із пп. 1-3, який відрізняє-
ється тим, що

друге навантаження являє собою нагрівач.

16. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю за п. 15, який відрізняється тим, що
перше навантаження налаштоване для керування
нагріванням за допомогою другого навантаження.

17. Блок живлення для пристрою генерування аеро-
золю за будь-яким одним із пп. 1-3, який відрізняє-
ється тим, що

друге навантаження являє собою індукційний нагрівач.

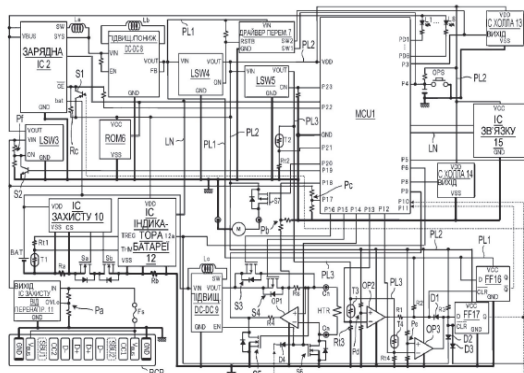
18. Блок живлення для пристрою генерування аерозолі за п. 7 або 8, який відрізняється тим, що третє навантаження являє собою захисну мікросхему (IC).

19. Блок живлення для пристрою генерування аерозолі за будь-яким одним із пп. 1-3, який відрізняється тим, що

розрядний шлях включає підвищувальний перетворювач, налаштований на підвищення вихідної напруги джерела живлення та подачу вихідної напруги підвищення на друге навантаження.

20. Блок живлення для пристрою генерування аерозолі за п. 19, який відрізняється тим, що додатково містить:

третє навантаження, підключене до вузла між джерелом живлення та перетворювачем підвищення на розрядному шляху та виконане з можливістю роботи від електроенергії, що подається від вузла.



Фіг. 10

нана з можливістю вміщення замінного виробу (16) у просторі, обмеженому внутрішньою поверхнею ємності, так що шлях повітряного потоку проходить уздовж осі (A) ємності;

- нагрівальну систему, виконану з можливістю нагрівання замінного виробу (16) при його розміщенні в ємності (10);

при цьому пристрій, що генерує аерозоль, відрізняється тим, що внутрішня поверхня ємності містить щонайменше один виступ (14), який виступає із внутрішньої поверхні ємності та виконаний із можливістю зменшення площі поперечного перерізу ємності для стиснення частини шляху повітряного потоку відсіку для зберігання, коли замісний виріб (16) розміщений в ємності (10);

при цьому вказаний або кожний виступ (14) визначає поверхню виступу, яка суміжна із внутрішньою поверхнею ємності та утворює із внутрішньою поверхнею ємності кут більше 100° уздовж усього виступу (14) у напрямку повітряного потоку.

2. Пристрій, що генерує аерозоль, за п. 1, який відрізняється тим, що максимальна висота вказаного або кожного виступу (14), виміряна відповідно до осі, перпендикулярної осі (A) ємності, становить від 2 % до 15 % діаметра ємності.

3. Пристрій, що генерує аерозоль, за п. 2, який відрізняється тим, що максимальна висота вказаного або кожного виступу (14), виміряна відповідно до осі, перпендикулярної осі (A) ємності, становить від 5 % до 10 % діаметра ємності.

4. Пристрій, що генерує аерозоль, за будь-яким одним з пп. 1-3, який відрізняється тим, що максимальна довжина вказаного або кожного виступу (14), виміряна відповідно до осі (A) ємності, становить від 5 % до 75 % довжини ємності, виміряної відповідно до осі (A) ємності.

5. Пристрій, що генерує аерозоль, за п. 4, який відрізняється тим, що максимальна довжина вказаного або кожного виступу (14), виміряна відповідно до осі (A) ємності, становить від 10 % до 65 % довжини ємності, виміряної відповідно до осі (A) ємності.

6. Пристрій, що генерує аерозоль, за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що кожний виступ (14) утворює висхідну частину, верхню частину та низхідну частину;

при цьому висхідна частина проходить від внутрішньої поверхні ємності до верхньої частини, а низхідна частина проходить від верхньої частини до внутрішньої поверхні ємності.

7. Пристрій, що генерує аерозоль, за п. 6, який відрізняється тим, що висхідна частина симетрична низхідній частині відносно верхньої частини.

8. Пристрій, що генерує аерозоль, за п. 6 або п. 7, який відрізняється тим, що висхідна частина визначає поперечні розміри, що поступово збільшуються від внутрішньої поверхні ємності до верхньої частини, та/або низхідна частина визначає поперечні розміри, що поступово зменшуються від верхньої частини до внутрішньої поверхні ємності.

9. Пристрій, що генерує аерозоль, за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що форма вказаного або кожного виступу (14) вибрана із групи, яка складається з:

(21) а 2023 05486

(22) 09.05.2022

(51) МПК

A24F 40/40 (2020.01)

A24F 40/465 (2020.01)

A61M 15/06 (2006.01)

(31) 21173010.6

(32) 10.05.2021

(33) EP

(85) 16.11.2023

(86) РСТ/EP2022/062427, 09.05.2022

(71) ДЖЕЙТІ ІНТЕРНЕТІОНЛ СА (СН)

(72) МакЕвой Яакко (АТ), Лунґеншміт Крістоф (АТ)

(54) ПРИСТРІЙ І НАБІР, ЩО ГЕНЕРУЮТЬ АЕРОЗОЛЬ

(57) 1. Пристрій, що генерує аерозоль, виконаний із можливістю роботи із замісним виробом (16), що містить відсік для зберігання, що вміщує випаровуваний матеріал, причому відсік для зберігання визначає шлях повітряного потоку, що проходить між входним отвором (12) для повітря та вихідним отвором для повітря через випаровуваний матеріал; при цьому пристрій, що генерує аерозоль, містить: - ємність (10), яка проходить уздовж осі (A) ємності, що визначає внутрішню поверхню ємності та вико-

- шеврона;
- наконечника стріли;
- асиметричної галтелі та фаски;
- симетричної галтелі;
- асиметричної галтелі;
- симетричної фаски;
- асиметричної фаски.

10. Пристрій, що генерує аерозоль, за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що містить декілька виступів (14), розташованих на внутрішній поверхні ємності в осьовому напрямку відносно осі (A) ємності та/або в окружному напрямку.

11. Пристрій, що генерує аерозоль, за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що вказаний або кожний виступ (14) розташований так, щоб бути суміжним із вихідним отвором для повітря відсіку для зберігання, коли замісний виріб (16) розміщений у ємності (10).

12. Пристрій, що генерує аерозоль, за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що вказаний або кожний виступ (14) виконаний із можливістю переміщення відносно осі (A) ємності.

13. Пристрій, що генерує аерозоль, за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що вказаний або кожний виступ (14) виконаний із можливістю переміщення відносно осі, перпендикулярної осі (A) ємності, між зачепленим положенням і незацепленим положенням;

при цьому замісний виріб (16) виконаний із можливістю вільного переміщення усередині ємності (10) відповідно до осі (A) ємності, коли вказаний або кожний виступ (14) перебуває в незацепленому положенні, і фіксується в ємності (10), коли вказаний або кожний виступ (14) перебуває в зачепленому положенні.

14. Пристрій, що генерує аерозоль, за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що нагрівальна система являє собою індуктивну нагрівальну систему, що містить котушку, виконану з можливістю створення магнітного поля, а відсік для зберігання замісного виробу (16) містить щонайменше один струмоприймач (20), що проходить уздовж шляху повітряного потоку між розташованим вище за потоком кінцем і розташованим нижче за потоком кінцем, і здатний генерувати тепло, коли він поміщений у магнітне поле, створюване котушкою;

при цьому вказаний або кожний виступ (14) розташований так, щоб щонайменше частково бути зверненим до струмоприймача (20) відсіку для зберігання замісного виробу (16), коли замісний виріб (16) розміщений в ємності (10);

при чому кількість виступів (14) є рівною кількості струмоприймачів (20).

15. Пристрій, що генерує аерозоль, за п. 14, який відрізняється тим, що вказаний або кожний виступ (14) утворює верхню частину, звернену до розташованого нижче за потоком кінця відповідного струмоприймача (20), коли замісний виріб (16) розміщений у ємності (10).

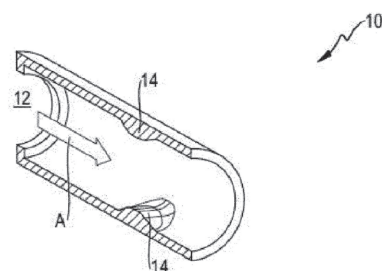
16. Пристрій, що генерує аерозоль, за будь-яким із пп. 1-13, який відрізняється тим, що нагрівальна система містить один або декілька нагрівальних елементів, що проходять уздовж щонайменше частини

внутрішньої поверхні ємності та поверхні контакту вказаного або кожного виступу (14).

17. Набір, що генерує аерозоль, який містить:

- замісний виріб (16), що містить відсік для зберігання, який вміщує випаровуваний матеріал, причому відсік для зберігання визначає шлях повітряного потоку, що проходить між вхідним отвором (12) для повітря та вихідним отвором для повітря через випаровуваний матеріал;

- пристрій, що генерує аерозоль, за будь-яким із попередніх пунктів, виконаний із можливістю роботи із замісним виробом (16).



Фіг. 1

(21) а 2023 04934

(22) 28.04.2022

(51) МПК

A24F 40/42 (2020.01)

A24F 40/10 (2020.01)

A24F 40/44 (2020.01)

A24F 40/46 (2020.01)

A24F 40/485 (2020.01)

A24F 40/30 (2020.01)

A24F 40/51 (2020.01)

(31) 10-2021-0055897

(32) 29.04.2021

(33) KR

(85) 25.10.2023

(86) PCT/KR2022/006113, 28.04.2022

(71) КТ&Г КОРПОРЕЙШОН (KR)

(72) Лее Йонгсуб (KR), Кім Мінкю (KR), Парк Джуон (KR), Чо Бюнгсунг (KR)

(54) КАРТРИДЖ І ПРИСТРІЙ ДЛЯ ГЕНЕРУВАННЯ АЕРОЗОЛЮ, ЩО МІСТИТЬ ТАКИЙ КАРТРИДЖ

(57) 1. Картридж, що містить: перший контейнер, що містить першу камеру, виконану з можливістю зберігання рідини; другий контейнер, що з'єднаний із першим контейнером та містить другу камеру; гніт, що розташований у другій камері та сполучається з першою камерою; нагрівач, виконаний із можливістю нагрівання гніту; впускний отвір картриджа, виконаний на зовнішній стінці другого контейнера; з'єднувальний канал, сформований у другому контейнері та виконаний з можливістю утворення каналу між впускним отвором картриджа та другою камерою; і блокуючу стінку, сформовану в з'єднувальному каналі та розташовану перед впускним отвором картриджа.

2. Картридж за п. 1, в якому впускний отвір картриджа виконано в положенні, розташованому вище від нижньої частини з'єднувального каналу.

3. Картридж за п. 1, в якому другий контейнер містить: нижній корпус, з'єднаний із першим контейнером; і раму, розміщену в нижньому корпусі та виконану з можливістю розділення внутрішньої частини нижнього корпусу для формування другої камери та з'єднувального каналу, при цьому згадана рама містить впускний отвір камери, що сполучає другу камеру зі з'єднувальним каналом.

4. Картридж за п. 3, в якому впускний отвір камери виконано на бічній стінці рами в положенні, розташованому вище нижньої частини другої камери.

5. Картридж за п. 3, в якому рама містить: нижню стінку, що утворює нижню частину другої камери і спирається на нижню частину нижнього корпусу; і бічну стінку, що проходить вгору від нижньої стінки для формування бічної частини другої камери.

6. Картридж за п. 1, в якому блокуюча стінка проходить вище положення впускного отвору картриджа.

7. Картридж за п. 3, в якому блокуюча стінка проходить вище положення впускного отвору камери.

8. Картридж за п. 3, в якому рама додатково містить: першу частину рами, виконану з можливістю утворення нижньої частини першої камери та відокремлення першої камери від з'єднувального каналу; і другу частину рами, виконану з можливістю поділу внутрішньої частини нижнього корпусу на з'єднувальний канал і другу камеру, причому впускний отвір камери утворено в другій частині рами.

9. Картридж за п. 3, в якому рама додатково містить круглу поверхню, що визначає частину з'єднувального каналу та розташовану поруч із верхнім кінцем блокуючої стінки, в якому кругла поверхня проходить у напрямку впускного отвору камери.

10. Картридж за п. 9, в якому рама містить: першу частину рами, виконану з можливістю утворення нижньої частини першої камери; і другу частину рами, виконану з можливістю поділу внутрішньої частини нижнього корпусу на другу камеру та з'єднувальний канал, в якому впускний отвір камери виконано в другій частині рами, і в якому кругла поверхня утворена між першою частиною рами та другою частиною рами.

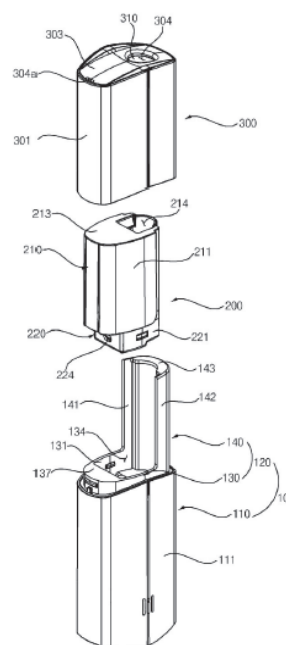
11. Пристрій для генерування аерозолі, що містить: картридж за п. 1; і корпус, виконаний з можливістю приєднання до нього картриджа.

12. Пристрій для генерування аерозолі за п. 11, що додатково містить: датчик, встановлений у корпусі та розташований поруч із впускним отвором картриджа, при цьому згаданий датчик виконано з можливістю розпізнавання потоку повітря, що проходить через впускний отвір картриджа.

13. Пристрій для генерування аерозолі за п. 12, в якому корпус містить: нижній корпус; і верхній корпус, що розташований над нижнім корпусом і містить кріплення, виконане з можливістю розміщення другого контейнера, при цьому згадане кріплення містить частину для розміщення датчика, сформовану на бічній стінці кріплення і виконану з можливістю розміщення датчика.

14. Пристрій для генерування аерозолі за п. 13, в якому другий контейнер розташований поруч із частиною для розміщення датчика.

ФІГ. 1



(21) а 2023 05540
(22) 19.05.2022

(51) МПК
A24F 40/42 (2020.01)
A24F 40/30 (2020.01)
A24F 40/485 (2020.01)
A24F 40/10 (2020.01)
A24F 40/20 (2020.01)
A24F 40/70 (2020.01)
A24B 15/10 (2006.01)

(31) 2107265.7
(32) 20.05.2021
(33) GB
(85) 12.12.2023

(86) РСТ/ЕР2022/063587, 19.05.2022

(71) БРІТІШ АМЕРІКАН ТОБАККО (ІНВЕСТМЕНТС) ЛІ-
МІТЕД (GB)

(72) Ашраф Мухаммад Фахім Ашраф (GB), Аоун Валід
Абі (GB)

(54) ВИТРАТНИЙ ЕЛЕМЕНТ, ПРИЗНАЧЕНИЙ ДЛЯ ВИ-
КОРИСТАННЯ З ПРИСТРОЄМ ДЛЯ НАДАННЯ
АЕРОЗОЛЮ

(57) 1. Витратний елемент, призначений для використан-
ня з пристроєм для надання аерозолі, при цьому
витратний елемент містить опору, матеріал, що ге-
нерує аерозоль, і одну або більше перфорацій, при-
чому перфорації виконані з можливістю забезпечен-
ня проходження тепла або аерозолі вздовж пер-
форації.

2. Витратний елемент за п. 1, який відрізняється тим,
що опора підтримує матеріал, що генерує аерозоль,
на поверхні опори.

3. Витратний елемент за п. 2, який відрізняється
тим, що опора додатково підтримує матеріал, що ге-
нерує аерозоль, на другій поверхні опори.

4. Витратний елемент за п. 2 або п. 3, який відрі-
зняється тим, що щонайменше деяка частина мате-

ріалу, що генерує аерозоль, яка підтримується на першій поверхні опори, підтримується як одна або більше окремих частин матеріалу, що генерує аерозоль.

5. Витратний елемент за п. 3 або п. 4, який **відрізняється** тим, що щонайменше деяка частина матеріалу, що генерує аерозоль, яка підтримується на другій поверхні опори, підтримується як одна або більше окремих частин матеріалу, що генерує аерозоль.

6. Витратний елемент за п. 5, коли він залежить від п. 4, який **відрізняється** тим, що кількість окремих частин матеріалу, що генерує аерозоль, на першій поверхні відповідає кількості окремих частин на другій поверхні, а положення окремих частин на першій поверхні опори по суті відповідає положенням окремих частин, які підтримуються на другій поверхні опори.

7. Витратний елемент за будь-яким із пп. 1-6, який **відрізняється** тим, що весь матеріал, що генерує аерозоль, який підтримується на опорі, має по суті однаковий склад.

8. Витратний елемент за будь-яким із пп. 1-6, який **відрізняється** тим, що матеріал, що генерує аерозоль, який підтримується на опорі, складається з двох або більше окремих частин, і щонайменше одна окрема частина має склад, який відрізняється від складу щонайменше однієї з інших окремих частин.

9. Витратний елемент за будь-яким із пп. 1-8, який **відрізняється** тим, що одна або більше перфорацій мають щонайменше один відкритий кінець, який відкривається через поверхню опори, матеріал, що генерує аерозоль, або будь-який інший елемент витратного елемента, та відкритий кінець визначається цією поверхнею.

10. Витратний елемент за будь-яким із пп. 1-9, який **відрізняється** тим, що одна або більше перфорацій мають щонайменше один глухий кінець, закритий опорою, матеріалом, що генерує аерозоль, або будь-яким іншим елементом витратного елемента.

11. Витратний елемент за будь-яким із пп. 1-10, який **відрізняється** тим, що одна або більше перфорацій проходять щонайменше частково крізь опору.

12. Витратний елемент за будь-яким із пп. 1-11, який **відрізняється** тим, що одна або більше перфорацій проходять щонайменше частково крізь матеріал, що генерує аерозоль.

13. Витратний елемент за будь-яким із пп. 1-12, який **відрізняється** тим, що опора містить непроникний матеріал.

14. Витратний елемент за п. 13, який **відрізняється** тим, що непроникний матеріал являє собою чорний або кольоровий метал.

15. Витратний елемент за будь-яким із п. 13 або п. 14, який **відрізняється** тим, що непроникний матеріал являє собою алюмінієву фольгу.

16. Витратний елемент за пп. 13-15, який **відрізняється** тим, що непроникний матеріал являє собою струмоприймач.

17. Витратний елемент за пп. 13-17, який **відрізняється** тим, що непроникний матеріал складається з двох або більше окремих частин.

18. Витратний елемент за п. 17, коли він безпосередньо залежить від п. 4 або п. 5 або опосередковано від п. 4 або п. 5 через будь-який із пп. 6-16, який **відрізняється** тим, що окремі частини непроникного матеріалу відповідають за кількістю або роз-

ташуванням однієї або більше окремим частинам матеріалу, що генерує аерозоль.

19. Витратний елемент за п. 18, який **відрізняється** тим, що кожна окрема частина матеріалу, що генерує аерозоль, підтримується на поверхні окремої частини непроникного матеріалу.

20. Витратний елемент за будь-яким із пп. 13-19, який **відрізняється** тим, що одна або більше перфорацій мають відкритий кінець, який відкривається через поверхню непроникного матеріалу.

21. Витратний елемент за будь-яким із пп. 13-20, який **відрізняється** тим, що одна або більше перфорацій мають щонайменше один глухий кінець, закритий непроникним матеріалом.

22. Витратний елемент за будь-яким із пп. 13-21, який **відрізняється** тим, що одна або більше перфорацій проходять щонайменше частково крізь струмоприймач.

23. Витратний елемент за будь-яким із пп. 1-22, який **відрізняється** тим, що положення однієї або більше перфорацій визначається положенням матеріалу, що генерує аерозоль, який підтримується на одній або обох з першої та другої поверхонь опори.

24. Витратний елемент за будь-яким із пп. 1-23, який **відрізняється** тим, що матеріал, що генерує аерозоль, являє собою аморфну тверду речовину.

25. Витратний елемент за будь-яким із пп. 1-24, який **відрізняється** тим, що матеріал, що генерує аерозоль, являє собою здатний утворювати аерозоль гель.

26. Система надання аерозолі, яка містить пристрій для надання аерозолі та витратний елемент за будь-яким із пп. 1-25.

27. Спосіб генерування аерозолі з витратного елемента за будь-яким із пп. 1-25 з використанням пристрою, що генерує аерозоль, з щонайменше одним генератором аерозолі; при цьому генератор аерозолі являє собою резистивний нагрівальний елемент.

28. Спосіб генерування аерозолі з витратного елемента за будь-яким із п. 16 і пп. 17-25, у залежності від одного п. 16, з використанням пристрою, що генерує аерозоль, з щонайменше одним розміщеним генератором аерозолі; при цьому генератор аерозолі являє собою генератор магнітного поля, придатний для створення електричних вихрових струмів у струмоприймачі.

29. Спосіб генерування аерозолі за п. 27 або п. 28, який **відрізняється** тим, що витратний елемент містить одну або більше окремих частин матеріалу, що генерує аерозоль, при цьому цей або кожний генератор аерозолі виконаний з можливістю нагрівання однієї або більше таких окремих частин за один раз.

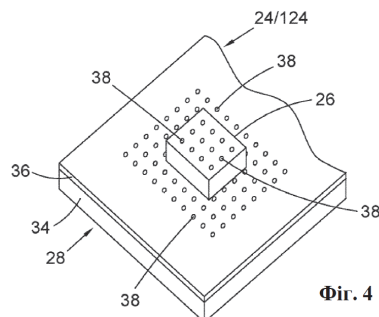


Fig. 4

(21) а 2023 05066 (51) МПК
(22) 04.03.2022 A24F 40/53 (2020.01)
A24F 40/90 (2020.01)

(31) 2021-079906
(32) 10.05.2021
(33) JP

(85) 02.02.2024

(86) PCT/JP2022/009474, 04.03.2022

(71) ДЖАПАН ТОБАККО ІНК. (JP)

(72) Аояма Тацунарі (JP), Каванаґо Хіросі (JP), Наґаха-
ма Тору (JP), Фудзікі Такасі (JP), Йосіда Ріо (JP)

(54) БЛОК ДЖЕРЕЛА ЖИВЛЕННЯ ПРИСТРОЮ ГЕНЕ-
РУВАННЯ АЕРОЗОЛЮ

(57) 1. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолі, що містить:

джерело живлення;
конектор нагрівача, до якого підключений нагрівач,
skonфігурований з можливістю нагрівання джерела
аерозолі шляхом споживання енергії, що подається
від джерела живлення;
контролер, який skonфігурований з можливістю керування поданням енергії від джерела живлення до нагрівача і який включає в себе термінал джерела живлення, на вхід до якого подається робоче живлення;

схему перезапуску, сконфігуровану з можливістю перезапуску контролера; та інтегральну мікросхему (IC), що включає термінал джерела живлення, на вхід до якого подається робоче живлення та який є відокремленим від контролера, причому термінал джерела живлення контролера сконфігурований з можливістю живлення другою системною напругою, що генерується джерелом живлення, а термінал джерела живлення IC - з можливістю живлення першою системною напругою, що генерується джерелом живлення, навіть коли контролер перезапущено схемою перезапуску.

2. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолі за п. 1, в якому друга системна напруга згенерована першою системою напругою.

3. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолів за п. 2, в якому значення другої системної напруги дорівнює значенню першої системної напруги.

4. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолі за п. 2 або 3, який додатково містить: перемикач, що включає вхідний блок, вихідний блок, підключений до терміналу джерела живлення контролера та сконфігурований з можливістю виводу другої системної напруги, а також блок керування, причому

перемикач, сконфігурований з можливістю відключення електричного з'єднання між вхідним блоком перемикача та вихідним блоком перемикача, коли напруга високого рівня надходить на вхід блока керування перемикача, а перша системна напруга подається на вхідний блок та на вхід блока керування.

5. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолів за п. 4, який відрізняється тим, що схема перезавантаження сконфігурована з можливістю подання сигналу низького рівня на вхід блока керування перемикача.

6. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолі за будь-яким одним із пп. 1-5, який додатково містить:

ІС пам'яті, сконфігуровану з можливістю зберігання вхідної інформації, причому ІС включає в себе ІС пам'яті.

7. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолі за п. 6, який відрізняється тим, що контролер, який перезавантажується схемою перезапуску, сконфігурований з можливістю здійснення попередньо визначеної функції на основі інформації, що збирається в ІС пам'яті.

8. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолів за п. 7, в якому попередньо визначена функція являє собою постійну заборону принаймні однієї з операцій заряджання джерела живлення та розряджання джерела живлення нагрівача.

9. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолю за будь-яким одним із пп. 1-8, який додатково містить:

схему перетворення напруги, сконфігурована з можливістю генерування першої системної напруги шляхом перетворення напруги, що подається від джерела живлення.

10. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолі за п. 9, в якому схема перетворення напруги включає підвищуючий/понижуючий перетворювач постійної напруги (DC/DC-перетворювач).

11. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолу за п. 10, який додатково містить: зарядний блок, електрично з'єднаний із зовнішнім джерелом живлення, при цьому схема перетворення напруги сконфігурована з можливістю перетворення напруги, що подається з зарядного блоку, для генерування першої системної напруги.

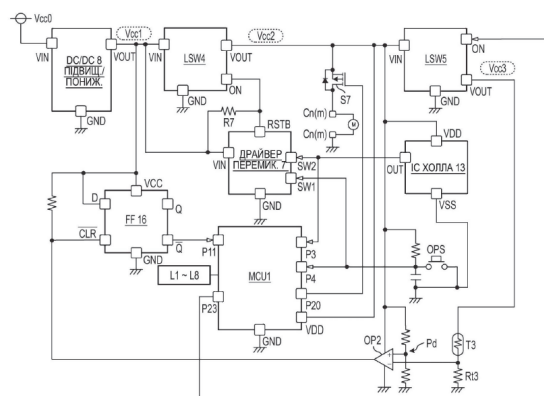


Fig. 21

(21) а 2023 05598 (51) МПК
(22) 24.05.2022 A24F 40/465 (2020.01)

(31) 2107483.6
(32) 26.05.2021
(33) GB

(85) 11.12.2023

(86) PCT/EP2022/064125, 24.05.2022

(71) НІКОВЕНЧЕРЗ ТРЕЙДІНГ ЛІМІТЕД (GB)

(72) Таверн Сід (GB)

(54) ПРИСТРІЙ НАДАННЯ АЕРОЗОЛЮ

(57) 1. Пристрій надання аерозолю для генерування аерозолю з матеріалу, що генерує аерозоль, причому пристрій містить:

корпус;

умістище в корпусі, виконане з можливістю вміщення матеріалу, що генерує аерозоль; і

систему індукційного нагрівання для забезпечення нагрівання матеріалу, що генерує аерозоль, коли матеріал, що генерує аерозоль, уміщений у вмістищі, причому система індукційного нагрівання містить спіральну індукційну котушку;

при цьому вмістище простягається через спіральну індукційну котушку; і

при цьому спіральна індукційна котушка є рухомою в корпусі відносно вмістища.

2. Пристрій за п. 1, який відрізняється тим, що спіральна індукційна котушка являє собою плоску спіральну котушку.

3. Пристрій за п. 1 або п. 2, який відрізняється тим, що містить рухомий тримач, пристосований для тримання спіральної індукційної котушки.

4. Пристрій за п. 3, який відрізняється тим, що рухомий тримач містить пластину, і плоска спіральна котушка знаходиться на першому боці пластини.

5. Пристрій за п. 3 або п. 4, який відрізняється тим, що рухомий тримач містить підкладку друкованої плати.

6. Пристрій за будь-яким із пп. 3-5, який відрізняється тим, що містить механізм регулювання котушки, пристосований для переміщення рухомого тримача вздовж вмістища.

7. Пристрій за будь-яким із пп. 1-6, який відрізняється тим, що вмістище є подовженим, і спіральна індукційна котушка є рухомою в подовжньому напрямку вздовж вмістища.

8. Пристрій за п. 7, який відрізняється тим, що спіральна індукційна котушка є рухомою між заданими положеннями.

9. Пристрій за п. 8, який відрізняється тим, що відособлені задані положення рознесені в подовжньому напрямку вздовж вмістища відносно одне одного.

10. Пристрій за будь-яким із пп. 1-9, який відрізняється тим, що пристрій виконаний із можливістю задіювання котушки, коли котушка є нерухомою відносно вмістища.

11. Пристрій за будь-яким із пп. 1-10, який відрізняється тим, що система індукційного нагрівання містить нагрівальний елемент, який містить нагрівальний матеріал, здатний нагріватися в результаті проникнення крізь нього змінюваного магнітного поля.

12. Пристрій за п. 11, який відрізняється тим, що нагрівальний елемент є подовженим, і нагрівальний елемент простягається через спіральну індукційну котушку.

13. Пристрій за п. 11 або п. 12, який відрізняється тим, що нагрівальний елемент виступає в вмістищі.

14. Пристрій за п. 11 або п. 12, який відрізняється тим, що вмістище містить нагрівальний елемент.

15. Пристрій за п. 14, який відрізняється тим, що нагрівальний елемент визначає периферійну стінку вмістища.

16. Пристрій за будь-яким із пп. 11-15, який відрізняється тим, що нагрівальний елемент є трубчастим.

17. Пристрій за будь-яким із пп. 11-16, який відрізняється тим, що нагрівальний елемент містить декілька частин нагрівального матеріалу.

18. Пристрій за п. 17, який відрізняється тим, що частини нагрівального матеріалу рознесені одна від одної в подовжньому напрямку вздовж вмістища.

19. Пристрій за будь-яким із пп. 1-12, який відрізняється тим, що вмістище не містить нагрівального матеріалу, здатного нагріватися в результаті проникнення крізь нього змінюваного магнітного поля.

20. Система надання аерозолю, яка містить:

виріб, який містить матеріал, що генерує аерозоль; пристрій надання аерозолю, який містить вмістище, виконане з можливістю вміщення матеріалу, що генерує аерозоль; і

систему індукційного нагрівання, пристосовану для створення змінюваного магнітного поля, яка містить плоску індукційну котушку;

при цьому вмістище простягається через спіральну індукційну котушку; і

при цьому плоска індукційна котушка є рухомою відносно вмістища; і

нагрівальний елемент, який містить нагрівальний матеріал, здатний нагріватися в результаті проникнення крізь нього змінюваного магнітного поля.

21. Система за п. 20, яка відрізняється тим, що виріб містить нагрівальний елемент.

22. Система за п. 20, яка відрізняється тим, що пристрій містить нагрівальний елемент.

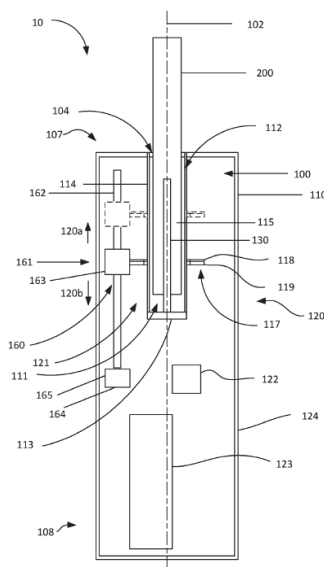
23. Система за п. 22, яка відрізняється тим, що нагрівальний елемент утворює щонайменше частину вмістища.

24. Система за п. 23, яка відрізняється тим, що нагрівальний елемент визначає вмістище.

25. Система за п. 22, яка відрізняється тим, що нагрівальний елемент виступає в вмістищі.

26. Система за будь-яким із пп. 20-25, яка відрізняється тим, що нагрівальний елемент містить декілька частин нагрівального матеріалу.

27. Система за п. 26, яка відрізняється тим, що частини нагрівального матеріалу рознесені одна від одної в подовжньому напрямку.



Фіг. 2

A 47

(21) **a 2023 04807** (51) МПК (2024.01)
(22) **09.03.2022** **A47L 5/30** (2006.01)
A47L 7/00
A47L 9/04 (2006.01)

(31) **21163046.2**

(32) **17.03.2021**

(33) **EP**

(85) **17.10.2023**

(86) **PCT/EP2022/056039, 09.03.2022**

(71) **ВЕРСУНІ ХОЛДИНГ Б.В. (NL)**

(72) **Еспін Франко Фермін (NL), Брада Ейпе Бернардус (NL), де Віт Бастіан Йоханнес (NL)**

(54) **ПЕРЕМІЩЕННЯ БРУДУ У ВСМОКТУВАЛЬНІЙ ГОЛОВЦІ ДЛЯ ВИКОРИСТАННЯ В ПИЛОСОСІ**

(57) 1. Всмоктувальна головка (101), придатна для використання в пирососі (100) та для виконання дії очищення поверхні (10), при цьому всмоктувальна головка (101) включає в себе:

корпус (30), та

щонайменше одну щітку (20), встановлену в корпусі (30) з можливістю обертання навколо осі (21) обертання, й яка придатна для взаємодії з поверхнею (10), яка підлягає очищенню,

при цьому корпус (30) виконаний, так щоб повернути частину щітки (20) до поверхні (10), яка підлягає очищенню, та накрити іншу частину щітки (20),

при цьому поверхня (32) корпусу (30), обернена до щітки (20), споряджена випускним отвором (31), придатним до сполучення з джерелом (60) всмоктування повітря, виконаним так, щоб створювати потік повітря в напрямку від ділянки корпусу (30) там, де розташована щітка (20), через випускний отвір (31), при цьому поверхня (32) корпусу (30), обернена до щітки (20), також споряджена множиною канавок (35), при цьому згадана множина канавок (35) включає в себе два набори (36, 37) канавок (35), розташовані на сторонах випускного отвору (31), які є протилежними сторонами в поздовжньому напрямку (I), який є напрямком, в якому простягається вісь (21) обертання щітки (20),

при цьому кожний з наборів (36, 37) канавок (35) включає в себе канавки (35), орієнтовані з окружною складовою навколо осі (21) обертання та з осью складовою в поздовжньому напрямку (I), та

при цьому, як видно в тому самому окружному напрямку (с) навколо осі (21) обертання, напрямком осьової складової канавок (35) одного набору (36, 37) канавок (35) є протилежним напрямку осьової складової канавок (35) іншого набору (36, 37).

2. Всмоктувальна головка (101) за п. 1, яка **відрізняється** тим, що в поздовжньому напрямку (I) випускний отвір (31) має такі розміри, щоб закривати лише частину розміру щітки (20).

3. Всмоктувальна головка (101) за п. 1 або п. 2, яка **відрізняється** тим, що в поздовжньому напрямку (I) множина канавок (35) закриває більшу частину або всю щітку (20).

4. Всмоктувальна головка (101) за будь-яким з пп. 1-3, яка **відрізняється** тим, що поверхня (32) корпусу (30), обернена до щітки (20), закриває щітку (20) на кутовій відстані, яка становить щонайменше 180° в окружному напрямку (с), й при цьому множина кана-

вок (35) вкриває більшу частину поверхні (32) корпусу (30), оберненої до щітки (20) в окружному напрямку (с).

5. Всмоктувальна головка (101) за будь-яким з пп. 1-4, яка **відрізняється** тим, що згадані два набори (36, 37) канавок (35) є дзеркально симетричними відносно уявної дзеркальної площини (M), яка перпендикулярна до осі (21) обертання щітки (20) та яка перетинає випускний отвір (31).

6. Всмоктувальна головка (101) за будь-яким з пп. 1-5, яка **відрізняється** тим, що щонайменше один з наборів (36, 37) канавок (35) включає в себе канавки (35), розташовані як сегменти однієї гвинтової спіралі навколо осі (21) обертання щітки (20), спрямованої в напрямку випускного отвору (31), якщо дивитися в напрямку обертання щітки (20) навколо осі (21) обертання, та еліптичної спіралі навколо осі (21) обертання щітки (20), спрямованої до випускного отвору (31), якщо дивитися в напрямку обертання щітки (20) навколо осі (21) обертання.

7. Всмоктувальна головка (101) за будь-яким з пп. 1-6, яка **відрізняється** тим, що окремі канавки (35) виконані так, щоб покривати відстань (o) у поздовжньому напрямку (I), яка перевищує суму розмірів (w_g) окремої канавки (35) в поздовжньому напрямку (I) та відстані (w_i) між окремими канавками (35) у поздовжньому напрямку (I).

8. Всмоктувальна головка (101) за будь-яким з пп. 1-7, яка **відрізняється** тим, що окремі канавки (35) мають пилкоподібну геометрію з крутою стороною пилкоподібного зубця (35a) та пологою стороною пилкоподібного зубця (35b).

9. Всмоктувальна головка (101) за п. 8, яка **відрізняється** тим, що в поперечному перерізі окремої канавки (35) крута сторона пилкоподібного зубця (35a) розташована під кутом (φ_2) в діапазоні 0-45° відносно уявної базової площини, перпендикулярної до поздовжнього напрямку (I), та/або полого сторона пилкоподібного зубця (35b) розташована під кутом (φ_3) в діапазоні 45-85° відносно уявної базової площини, перпендикулярної до поздовжнього напрямку (I).

10. Всмоктувальна головка (101) за будь-яким з пп. 1-9, яка **відрізняється** тим, що глибина (d) канавок (35) становить 0,5-4 мм.

11. Всмоктувальна головка (101) за будь-яким з пп. 1-10, яка **відрізняється** тим, що відстань між поверхнею (32) корпусу (30), оберненою до щітки (20), та робочим контуром щітки (20) становить від 0 мм до 2 мм на ділянках поверхні (32) корпусу (30), оберненого до щітки (20) за межами канавок (35).

12. Всмоктувальна головка (101) за будь-яким з пп. 1-11, яка **відрізняється** тим, що відстань (w_i) між окремими канавками (35) у поздовжньому напрямку (I) становить від нуля до відстані ($2\varphi_l$), охопленої канавкою (35) в окружному напрямку (с) мінус розмір (w_g) окремої канавки (35) в поздовжньому напрямку (I).

13. Всмоктувальна головка (101) за будь-яким з пп. 1-12, яка **відрізняється** тим, що робоча форма щітки (20), як правило, має форму циліндра з круглою периферією.

14. Пиросос (100) для вологого прибирання, який включає в себе всмоктувальну головку (101) за будь-яким з пп. 1-13, при цьому всмоктувальна головка (101) включає в себе змочувальний пристрій (42), призначений для подавання рідини на щонайменше

одну ділянку поверхні (10), яка підлягає очищенню, та/або на щонайменше одну ділянку всмоктувальної головки (101).

15. Бездротовий пілосос (100), який включає в себе всмоктувальну головку (101) за будь-яким з пп. 1-13.

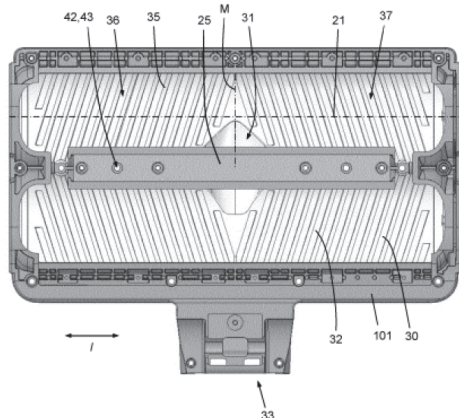


Fig. 2

A 61

(21) а 2023 05153

(22) 01.04.2022

(51) МПК (2024.01)

A61K 31/00

A61K 33/00

A61K 39/395 (2006.01)

C07K 16/28 (2006.01)

C07K 16/30 (2006.01)

(31) 63/170,320

(32) 02.04.2021

(33) US

(31) 63/313,927

(32) 25.02.2022

(33) US

(85) 01.11.2023

(86) PCT/US2022/023122, 01.04.2022

(71) РІДЖЕНЕРОН ФАРМАСЬЮТИКАЛЗ, ІНК. (US)

(72) Камен Дуглас (US), Янг Тен-Чіех (US), Скуй Сяобін (US), Цю Хайбо (US), Грегам Кеннет (US)

(54) СТАБІЛІЗОВАНІ СКЛАДИ, ЩО МІСТЯТЬ БІСПЕЦИФІЧНІ АНТИТІЛА ДО MUC16 І ДО CD3

(57) 1. Стабільний рідкий фармацевтичний склад, який містить:

(а) біспецифічне антитіло, що містить перший антигензв'язувальний домен, який специфічно зв'язується з MUC16 людини, і другий антигензв'язувальний домен, який специфічно зв'язується з CD3 людини, де перший антигензв'язувальний домен містить три ділянки, що визначають комплементарність (CDR), важкого ланцюга (A1-HCDR1, A1-HCDR2 і A1-HCDR3), що містяться у варіабельній ділянці важкого ланцюга (HCVR), і три CDR легкого ланцюга (LCDR1, LCDR2 і LCDR3), що містяться у варіабельній ділянці легкого ланцюга (LCVR), і другий антигензв'язувальний домен містить три CDR важкого ланцюга (A2-HCDR1, A2-HCDR2 і A2-HCDR3), що містяться у варіабельній ділянці важкого ланцюга (HCVR), і три CDR лег-

кого ланцюга (LCDR1, LCDR2 і LCDR3), що містяться у варіабельній ділянці легкого ланцюга (LCVR), де A1-HCDR1, A1-HCDR2 і A1-HCDR3 містять амінокислотні послідовності під SEQ ID NO: 7, 8 і 9 відповідно, A2-HCDR1, A2-HCDR2 і A2-HCDR3 містять амінокислотні послідовності під SEQ ID NO: 10, 11 і 12 відповідно, і LCDR1, LCDR2 і LCDR3 містять амінокислотні послідовності під SEQ ID NO: 13, 14 і 15 відповідно;

(b) буфер, що містить ацетат натрію;

(c) органічний співрозчинник, який містить полісорбат; і

(d) стабілізатор, що містить цукор;

де склад має pH 5,0±0,5.

2. Фармацевтичний склад за п. 1, де концентрація антитіла становить від 1 мг/мл±0,1 мг/мл до 200 мг/мл±20 мг/мл.

3. Фармацевтичний склад за п. 2, де концентрація антитіла становить від 5 мг/мл±0,5 мг/мл до 50 мг/мл±5 мг/мл.

4. Фармацевтичний склад за п. 3, де концентрація антитіла становить 5 мг/мл±0,5 мг/мл.

5. Фармацевтичний склад за п. 3, де концентрація антитіла становить 50 мг/мл±5 мг/мл.

6. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-5, де концентрація ацетатного буфера становить від 10 мМ±1 мМ до 50 мМ±5 мМ.

7. Фармацевтичний склад за п. 6, де концентрація ацетатного буфера становить від 25 мМ±2,5 мМ до 35 мМ±3,5 мМ.

8. Фармацевтичний склад за п. 7, де концентрація ацетатного буфера становить 30 мМ±3 мМ.

9. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-8, де концентрація полісорбату становить від 0,01 %±0,005 % до 0,5 %±0,05 % вага/об.

10. Фармацевтичний склад за п. 9, де концентрація полісорбату становить від 0,1 %±0,05 % до 0,3 %±0,03 % вага/об.

11. Фармацевтичний склад за п. 9, де концентрація полісорбату становить 0,2 %±0,02 % вага/об.

12. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-11, де полісорбат являє собою полісорбат 20.

13. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-12, де цукор являє собою сахарозу.

14. Фармацевтичний склад за п. 13, де концентрація сахарози становить від 5 %±1 % до 20 %±4 % вага/об.

15. Фармацевтичний склад за п. 14, де концентрація сахарози становить від 7 %±0,5 % до 12 %±0,5 % вага/об.

16. Фармацевтичний склад за п. 15, де концентрація сахарози становить 10 %±1 % вага/об.

17. Фармацевтичний склад за п. 1, який містить:

(a) 5 мг/мл±0,5 мг/мл антитіла,

(b) від 25 мМ±2 мМ до 35 мМ±2 мМ ацетатного буфера,

(c) від 0,1 %±0,05 % до 0,3 %±0,05 % вага/об. полісорбату й

(d) від 5 %±1 % до 15 %±3 % вага/об. сахарози, за pH 5,0±0,5.

18. Фармацевтичний склад за п. 17, який містить:

(a) 5 мг/мл±0,5 мг/мл антитіла,

(b) 30 мМ±1 мМ ацетатного буфера,

(c) 0,2 %±0,02 % вага/об. полісорбату й

(d) 10 %±1 % вага/об. сахарози, за pH 5,0±0,3.

19. Фармацевтичний склад за п. 1, який містить:

- (a) 50 мг/мл \pm 5 мг/мл антитіла,
- (b) від 25 мМ \pm 2 мМ до 35 мМ \pm 2 мМ ацетатного буфера,
- (c) від 0,1 % \pm 0,05 % до 0,3 % \pm 0,05 % вага/об. полісорбату й
- (d) від 5 % \pm 1 % до 15 % \pm 3 % вага/об. сахарози, за pH 5,0 \pm 0,5.

20. Фармацевтичний склад за п. 19, який містить:

- (a) 50 мг/мл \pm 0,5 мг/мл антитіла,
- (b) 30 мМ \pm 1 мМ ацетатного буфера,
- (c) 0,2 % \pm 0,02 % вага/об. полісорбату й
- (d) 10 % \pm 1 % вага/об. сахарози, за pH 5,0 \pm 0,3.

21. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 17-20, де полісорбат являє собою полісорбат 20.

22. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-21, де склад містить не більше ніж 2,5 % високомолекулярних (HMW) сполук після 12 місяців або 24 місяців зберігання при 5 °C, як визначено за допомогою SE-UPLC.

23. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-21, де склад містить не більше ніж 3,5 % високомолекулярних (HMW) сполук після 6 місяців зберігання при 25 °C і відносній вологості 60 %, як визначено за допомогою SE-UPLC.

24. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-21, де склад містить не більше ніж 1,5 % високомолекулярних (HMW) сполук після 12 місяців зберігання при -30 °C або не більше ніж 2,0 % HMW-сполук після 24 місяців зберігання при -30 °C, як визначено за допомогою SE-UPLC.

25. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-21, де склад містить не більше ніж 1,5 % високомолекулярних (HMW) сполук після 12 місяців зберігання при -80 °C або не більше ніж 2,0 % HMW-сполук після 24 місяців зберігання при -30 °C, як визначено за допомогою SE-UPLC.

26. Стабільний рідкий фармацевтичний склад, відновлений із ліофілізату, який містить:

- (a) біспецифічне антитіло в концентрації від 1 мг/мл до 30 мг/мл, де біспецифічне антитіло містить перший антигензв'язувальний домен, який специфічно зв'язується з MUC16 людини, і другий антигензв'язувальний домен, який специфічно зв'язується з CD3 людини, де перший антигензв'язувальний домен містить три ділянки, що визначають комплементарність (CDR), важкого ланцюга (A1-HCDR1, A1-HCDR2 і A1-HCDR3), що містяться у варіабельній ділянці важкого ланцюга (HCVR), і три CDR легкого ланцюга (LCDR1, LCDR2 і LCDR3), що містяться у варіабельній ділянці легкого ланцюга (LCVR), і другий антигензв'язувальний домен містить три CDR важкого ланцюга (A2-HCDR1, A2-HCDR2 і A2-HCDR3), що містяться у варіабельній ділянці важкого ланцюга (HCVR), і три CDR легкого ланцюга (LCDR1, LCDR2 і LCDR3), що містяться у варіабельній ділянці легкого ланцюга (LCVR), де A1-HCDR1, A1-HCDR2 і A1-HCDR3 містять амінокислотні послідовності під SEQ ID NO: 7, 8 і 9 відповідно, A2-HCDR1, A2-HCDR2 і A2-HCDR3 містять амінокислотні послідовності під SEQ ID NO: 10, 11 і 12 відповідно, і LCDR1, LCDR2 і LCDR3 містять амінокислотні послідовності під SEQ ID NO: 13, 14 і 15 відповідно;

- (b) буфер, що містить гістидин;

- (c) органічний співрозчинник, який містить полісорбат; і
- (d) стабілізатор, що містить цукор;

де склад має pH 6,0 \pm 0,5.

27. Фармацевтичний склад за п. 26, де концентрація антитіла становить 2 мг/мл \pm 0,5 мг/мл або 20 мг/мл \pm 2 мг/мл.

28. Фармацевтичний склад за п. 27, де концентрація гістидинового буфера становить від 5 мМ \pm 1 мМ до 15 мМ \pm 1 мМ.

29. Фармацевтичний склад за п. 28, де концентрація гістидинового буфера становить 10 мМ \pm 1 мМ.

30. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 26-29, де концентрація полісорбату становить від 0,01 % до 0,1 % вага/об.

31. Фармацевтичний склад за п. 30, де концентрація полісорбату становить 0,05 % \pm 0,01 % вага/об.

32. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 26-31, де полісорбат являє собою полісорбат 20.

33. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 26-32, де цукор являє собою сахарозу.

34. Фармацевтичний склад за п. 33, де концентрація сахарози становить від 8 % \pm 0,5 % до 12 % \pm 0,5 % вага/об.

35. Фармацевтичний склад за п. 34, де концентрація сахарози становить 10 % \pm 1 % вага/об.

36. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 26-35, де (a) щонайменше 95 % антитіла характеризуються нативною конформацією після 12 місяців, після 18 місяців, після 24 місяців або після 36 місяців зберігання при 5 °C; (b) щонайменше 95 % антитіла характеризуються нативною конформацією після 6 місяців зберігання при 25 °C і відносній вологості 60 %; (c) щонайменше 95 % антитіла характеризуються нативною конформацією після 3 місяців зберігання при 37 °C; (d) склад містить не більше ніж 1 % високомолекулярних (HMW) сполук після 12 місяців, після 18 місяців, після 24 місяців або після 36 місяців зберігання при 5 °C; (e) склад містить не більше ніж 1 % HMW-сполук після 6 місяців зберігання при 25 °C і відносній вологості 60 % або (f) склад містить не більше ніж 1 % HMW-сполук після 3 місяців зберігання при 37 °C;

як визначено за допомогою SE-UPLC.

37. Стабільний рідкий фармацевтичний склад, який містить:

- (a) біспецифічне антитіло в концентрації від 100 мг/мл до 200 мг/мл, де біспецифічне антитіло містить перший антигензв'язувальний домен, який специфічно зв'язується з MUC16 людини, і другий антигензв'язувальний домен, який специфічно зв'язується з CD3 людини, де перший антигензв'язувальний домен містить три ділянки, що визначають комплементарність (CDR), важкого ланцюга (A1-HCDR1, A1-HCDR2 і A1-HCDR3), що містяться у варіабельній ділянці важкого ланцюга (HCVR), і три CDR легкого ланцюга (LCDR1, LCDR2 і LCDR3), що містяться у варіабельній ділянці легкого ланцюга (LCVR), і другий антигензв'язувальний домен містить три CDR важкого ланцюга (A2-HCDR1, A2-HCDR2 і A2-HCDR3), що містяться у варіабельній ділянці важкого ланцюга (HCVR), і три CDR легкого ланцюга (LCDR1, LCDR2 і LCDR3), що містяться у варіабельній ділянці легкого ланцюга (LCVR), де A1-HCDR1, A1-HCDR2 і A1-HCDR3 містять амінокислотні послідовності під SEQ ID NO: 7, 8 і 9 відповідно, A2-HCDR1, A2-HCDR2 і

A2-HCDR3 містять амінокислотні послідовності під SEQ ID NO: 10, 11 і 12 відповідно, і LCDR1, LCDR2 і LCDR3 містять амінокислотні послідовності під SEQ ID NO: 13, 14 і 15 відповідно;

(b) буфер, що містить ацетат;

(c) стабілізатор, який містить цукор; і

(d) поверхнево-активну речовину, що містить полісорбат;

де склад має pH $5,0 \pm 0,5$.

38. Фармацевтичний склад за п. 37, де концентрація антитіла становить від 125 мг/мл до 175 мг/мл.

39. Фармацевтичний склад за п. 38, де концентрація антитіла становить $150 \text{ мг/мл} \pm 10 \text{ мг/мл}$.

40. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 37-39, де цукор являє собою сахарозу.

41. Фармацевтичний склад за п. 40, де концентрація сахарози становить від 4 % до 12 % вага/об.

42. Фармацевтичний склад за п. 41, де концентрація сахарози становить $8 \% \text{ вага/об.} \pm 1 \% \text{ вага/об.}$

43. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 37-42, де концентрація ацетатного буфера становить від 25 мМ до 35 мМ.

44. Фармацевтичний склад за п. 43, де концентрація ацетатного буфера становить $30 \text{ мМ} \pm 1 \text{ мМ}$.

45. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 37-44, де полісорбат являє собою полісорбат 20.

46. Фармацевтичний склад за п. 45, де концентрація полісорбату 20 становить від 0,01 % вага/об. до 0,1 % вага/об.

47. Фармацевтичний склад за п. 46, де концентрація полісорбату 20 становить $0,05 \% \text{ вага/об.} \pm 0,01 \% \text{ вага/об.}$

48. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 37-47, де (a) склад містить не більше ніж 2,5 % високомолекулярних (HMW) сполук після 12 місяців або після 24 місяців зберігання при -30°C або -80°C ; (b) склад містить не більше ніж 4 % HMW-сполук після 6 місяців зберігання при 5°C або (c) склад містить не більше ніж 6 % HMW-сполук після 6 місяців зберігання при 25°C і відносній вологості 60 %; як визначено за допомогою SE-UPLC.

49. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-48, де склад містить не більше ніж 40 % глікованих варіантів сполук, де глікований варіант сполуки характеризується глікуванням за залишком 98 в SEQ ID NO: 1 або SEQ ID NO: 4 або за залишком 2 в SEQ ID NO: 9.

50. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-49, де перший антигензв'язувальний домен містить HCVR із щонайменше 90 % ідентичністю з амінокислотною послідовністю під SEQ ID NO: 4 і LCVR із щонайменше 90 % ідентичністю з амінокислотною послідовністю під SEQ ID NO: 6, і другий антигензв'язувальний домен містить HCVR із щонайменше 90 % ідентичністю з амінокислотною послідовністю під SEQ ID NO: 5 і LCVR із щонайменше 90 % ідентичністю з амінокислотною послідовністю під SEQ ID NO: 6.

51. Фармацевтичний склад за п. 50, де перший антигензв'язувальний домен містить HCVR із щонайменше 95 % ідентичністю з амінокислотною послідовністю під SEQ ID NO: 4 і LCVR із щонайменше 95 % ідентичністю з амінокислотною послідовністю під SEQ ID NO: 6, і другий антигензв'язувальний домен містить HCVR із щонайменше 95 % ідентичністю з амінокислотною послідовністю під SEQ ID

NO: 5 і LCVR із щонайменше 95 % ідентичністю з амінокислотною послідовністю під SEQ ID NO: 6.

52. Фармацевтичний склад за п. 51, де перший антигензв'язувальний домен містить HCVR із щонайменше 99 % ідентичністю з амінокислотною послідовністю під SEQ ID NO: 4 і LCVR із щонайменше 99 % ідентичністю з амінокислотною послідовністю під SEQ ID NO: 6, і другий антигензв'язувальний домен містить HCVR із щонайменше 99 % ідентичністю з амінокислотною послідовністю під SEQ ID NO: 5 і LCVR із щонайменше 99 % ідентичністю з амінокислотною послідовністю під SEQ ID NO: 6.

53. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-52, де перший антигензв'язувальний домен містить HCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 4, і LCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 6, і другий антигензв'язувальний домен містить HCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 5, і LCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 6.

54. Стабільний фармацевтичний склад, який містить:

(a) $5 \text{ мг/мл} \pm 0,5 \text{ мг/мл}$ біспецифічного антитіла, що містить перший антигензв'язувальний домен, який специфічно зв'язується з MUC16 людини, і другий антигензв'язувальний домен, який специфічно зв'язується з CD3 людини, де перший антигензв'язувальний домен містить HCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 4, і LCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 6, і другий антигензв'язувальний домен містить HCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 5, і LCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 6;

(b) $30 \text{ мМ} \pm 1 \text{ мМ}$ буфера на основі ацетату натрію, pH $5,0 \pm 0,2$,

(c) $0,2 \% \pm 0,02 \% \text{ вага/об.}$ полісорбату 20 і

(d) $10 \% \pm 1 \% \text{ вага/об.}$ сахарози.

55. Стабільний фармацевтичний склад, який містить: (a) $50 \text{ мг/мл} \pm 5 \text{ мг/мл}$ біспецифічного антитіла, що містить перший антигензв'язувальний домен, який специфічно зв'язується з MUC16 людини, і другий антигензв'язувальний домен, який специфічно зв'язується з CD3 людини, де перший антигензв'язувальний домен містить HCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 4, і LCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 6, і другий антигензв'язувальний домен містить HCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 5, і LCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 6;

(b) $30 \text{ мМ} \pm 1 \text{ мМ}$ буфера на основі ацетату натрію, pH $5,0 \pm 0,2$,

(c) $0,2 \% \pm 0,02 \% \text{ вага/об.}$ полісорбату 20 і

(d) $10 \% \pm 1 \% \text{ вага/об.}$ сахарози.

56. Стабільний фармацевтичний склад, який містить: (a) $150 \text{ мг/мл} \pm 15 \text{ мг/мл}$ біспецифічного антитіла, що містить перший антигензв'язувальний домен, який специфічно зв'язується з MUC16 людини, і другий антигензв'язувальний домен, який специфічно зв'язується з CD3 людини, де перший антигензв'язувальний домен містить HCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 4, і LCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 6, і другий антигензв'язувальний домен містить HCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID

NO: 5, і LCVR, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 6;

(b) 30 mM \pm 1 mM буфера на основі ацетату натрію, pH 5,0 \pm 0,2,

(c) 0,05 % \pm 0,01 % вага/об. полісорбату 20 і

(d) 8 % \pm 1 % вага/об. сахарози.

57. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 50-56, де антитіло містить константну ділянку важкого ланцюга IgG людини, приєднану відповідно до HCVR кожного з першого антигензв'язувального домену й другого антигензв'язувального домену.

58. Фармацевтичний склад за п. 57, де константна ділянка важкого ланцюга стосується ізо типу IgG1.

59. Фармацевтичний склад за п. 57, де константна ділянка важкого ланцюга стосується ізо типу IgG4.

60. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 57-59, де константна ділянка важкого ланцюга, приєднана до HCVR першого антигензв'язувального домену, або константна ділянка важкого ланцюга, приєднана до HCVR другого антигензв'язувального домену, але не вони обидві, містить амінокислотну модифікацію, яка забезпечує зниження зв'язування з білком А порівняно з важким ланцюгом того самого ізо типу без модифікації.

61. Фармацевтичний склад за п. 60, де модифікація передбачає заміну H435R (нумерація згідно з EU) у важкому ланцюзі ізо типу IgG1 або IgG4.

62. Фармацевтичний склад за п. 60, де модифікація передбачає заміну H435R і заміну Y436F (нумерація згідно з EU) у важкому ланцюзі ізо типу IgG1 або IgG4.

63. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 57-59, де антитіло містить константну ділянку важкого ланцюга, що містить амінокислотну послідовність, вибрану з групи, що складається з SEQ ID NO: 16, SEQ ID NO: 17, SEQ ID NO: 18 і SEQ ID NO: 19.

64. Фармацевтичний склад за п. 63, де антитіло містить константну ділянку важкого ланцюга, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 16, і константну ділянку важкого ланцюга, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 17.

65. Фармацевтичний склад за п. 63, де антитіло містить константну ділянку важкого ланцюга, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 18, і константну ділянку важкого ланцюга, що містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 19.

66. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 50-56, де антитіло містить перший важкий ланцюг, що містить HCVR першого антигензв'язувального домену, і другий важкий ланцюг, що містить HCVR другого антигензв'язувального домену, де перший важкий ланцюг містить залишки 1-442 з амінокислотної послідовності під SEQ ID NO: 1, і другий важкий ланцюг містить залишки 1-449 з амінокислотної послідовності під SEQ ID NO: 2.

67. Фармацевтичний склад за п. 66, де антитіло містить загальний легкий ланцюг, що містить LCVR першого й другого антигензв'язувальних доменів, де загальний легкий ланцюг містить амінокислотну послідовність під SEQ ID NO: 3.

68. Фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-67, де зміна відсоткового вмісту глікованих сполук є наступною: (i) не більше ніж 1,5 % після 6 місяців зберігання при 5 °C; (ii) не більше ніж 3 % після 12 місяців зберігання при 5 °C; (iii) не більше ніж 1,5 % після 12 місяців, після 18 місяців або після 24 місяців зберігання при -30 °C або не більше ніж 1 % після

12 місяців, після 18 місяців або після 24 місяців зберігання при -80 °C, як визначено за допомогою катіонообмінної недефективної рідинної хроматографії (CEX-UPLC) і/або за допомогою рідинної хроматографії з мас-спектрометрією (LC-MS).

69. Фармацевтична композиція, де композиція містить фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-68, і композиція міститься в контейнері.

70. Фармацевтична композиція за п. 69, де контейнер являє собою флакон.

71. Фармацевтична композиція за п. 70, де флакон являє собою флакон на 2 мл, 5 мл або 10 мл із прозорого скла 1 типу.

72. Фармацевтична композиція за п. 69, де контейнер являє собою шприц.

73. Фармацевтична композиція за п. 72, де шприц виготовлений зі скла з низьким змістом вольфраму.

74. Фармацевтична композиція за п. 69, де контейнер являє собою попередньо заповнений шприц.

75. Фармацевтична композиція за п. 69, що міститься в автоін'єкторі.

76. Набір, який містить (i) контейнер, що містить композицію, яка містить фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-68, й інструкції із застосування композиції.

77. Набір за п. 76, де контейнер являє собою скляний флакон.

78. Набір за п. 76, де контейнер являє собою попередньо заповнений шприц.

79. Набір за п. 76, де контейнер являє собою автоін'єктор.

80. Набір за п. 76, де в інструкціях вказане підшкірне введення композиції.

81. Набір за п. 76, де в інструкціях вказане внутрішньовенне введення композиції.

82. Стандартна лікарська форма, яка містить фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-68, де антитіло присутнє в кількості від 0,1 мг до 500 мг.

83. Стандартна лікарська форма за п. 82, де антитіло присутнє в кількості від 1 до 20 мг.

84. Стандартна лікарська форма за п. 82, де антитіло присутнє в кількості від 100 до 200 мг.

85. Стандартна лікарська форма за п. 82, яка являє собою скляний флакон.

86. Стандартна лікарська форма за п. 82, яка являє собою попередньо заповнений шприц.

87. Стандартна лікарська форма за п. 82, яка являє собою автоін'єктор.

88. Контейнер, який містить композицію, що містить фармацевтичний склад за будь-яким із пп. 1-68.

89. Контейнер за п. 88, який являє собою скляний флакон.

90. Контейнер за п. 88, який являє собою попередньо заповнений шприц.

91. Контейнер за п. 88, який являє собою автоін'єктор.

(21) а 2023 05355
(22) 21.04.2022

(51) МПК (2024.01)
A61K 31/00
A61K 33/00
A61K 39/395 (2006.01)
C07K 16/28 (2006.01)
C12N 9/26 (2006.01)

- (31) 63/177,518
(32) 21.04.2021
(33) US
(31) 63/180,690
(32) 28.04.2021
(33) US
(31) 63/309,230
(32) 11.02.2022
(33) US
(85) 10.11.2023
(86) РСТ/ІВ2022/053733, 21.04.2022
(71) ЯНССЕН БАЙОТЕК, ІНК. (US)
(72) Кноблаух Роланд (US), Торне Сатьен (US)
(54) ВИСОКОКОНЦЕНТРОВАНІ СКЛАДИ БІСПЕЦИФІЧНИХ АНТИТІЛ
(57) 1. Стабільна водна фармацевтична композиція, що містить біспецифічне антитіло до рецептора епідермального фактора росту (EGFR)/рецептора фактора росту гепатоцитів (с-Met) і гіалуронідазу, при цьому антитіло містить:
а. перший важкий ланцюг (HC1), що містить варіабельну ділянку 1 (VH1) HC1, що містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO:13;
b. перший легкий ланцюг (LC1), що містить варіабельну ділянку 1 (VL1) легкого ланцюга, що містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO:14;
с. другий важкий ланцюг (HC2), що містить варіабельну ділянку 2 (VH2) HC2, що містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO:15;
d. другий легкий ланцюг (LC2), що містить варіабельну ділянку 2 (VL2) легкого ланцюга, що містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO:16;
і при цьому композиція містить від приблизно 1050 мг до приблизно 2240 мг біспецифічного антитіла до EGFR/с-Met і від приблизно 13 000 Од до приблизно 28 000 Од гіалуронідази.
2. Стабільна композиція за п. 1, де композиція містить приблизно 1050 мг біспецифічного антитіла до EGFR/с-Met.
3. Стабільна композиція за п. 1, де композиція містить приблизно 1400 мг біспецифічного антитіла до EGFR/с-Met.
4. Стабільна композиція за п. 1, де композиція містить приблизно 1575 мг біспецифічного антитіла до EGFR/с-Met.
5. Стабільна композиція за п. 1, де композиція містить приблизно 1600 мг біспецифічного антитіла до EGFR/с-Met.
6. Стабільна композиція за п. 1, де композиція містить приблизно 2100 мг біспецифічного антитіла до EGFR/с-Met.
7. Стабільна композиція за п. 1, де композиція містить приблизно 2240 мг біспецифічного антитіла до EGFR/с-Met.
8. Стабільна водна фармацевтична композиція, яка містить:
а) від приблизно 144 мг/мл до приблизно 176 мг/мл біспецифічних антитіл до рецептора епідермального фактора росту (EGFR) / рецептора фактора росту гепатоцитів (с-Met), причому біспецифічне антитіло містить:
перший важкий ланцюг (HC1), який містить варіабельну ділянку 1 HC1 (VH1);
перший легкий ланцюг (LC1), який містить варіабельну ділянку легкого ланцюга 1 (VL1);

- другий важкий ланцюг (HC2), який містить варіабельну ділянку 2 HC2 (VH2); і
другий легкий ланцюг (LC2), який містить варіабельну ділянку легкого ланцюга 2 (VL2),
де VH1 містить амінокислотні послідовності ділянки, що визначає комплементарність важкого ланцюга 1 (HCDR1), HCDR2 і HCDR3, із SEQ ID NO: 1, 2 і 3 відповідно; VL1 містить амінокислотні послідовності ділянки, що визначає комплементарність легкого ланцюга 1 (LCDR1), LCDR2 і LCDR3, із SEQ ID NO: 4, 5 і 6 відповідно; VH2 містить амінокислотні послідовності HCDR1, HCDR2 і HCDR3 із SEQ ID NO: 7, 8 і 9 відповідно; і VL2 містить амінокислотні послідовності LCDR1, LCDR2 і LCDR3 із SEQ ID NO: 10, 11 і 12 відповідно;
b) від приблизно 10 мМ до приблизно 50 мМ ацетату та/або фармацевтично прийнятної ацетатної солі,
с) від приблизно 6,8 % (мас./об.) до приблизно 10,2 % (мас./об.) сахарози,
d) від приблизно 0,036 % (мас./об.) до приблизно 0,084 % (мас./об.) полісорбату 80 (PS80),
е) від приблизно 0,8 мг/мл до приблизно 1,2 мг/мл метіоніну,
f) від приблизно 16 мкг/мл до приблизно 24 мкг/мл етилендіамінтетраоцтової кислоти (ЕДТА),
g) необов'язково, від приблизно 1000 Од/мл до приблизно 3000 Од/мл гіалуронідази; і
h) рівень рН від приблизно 5,2 до приблизно 6,2.
9. Стабільна водна фармацевтична композиція за п. 8, де біспецифічне антитіло до EGFR/сMet містить варіабельну ділянку HC1, що містить амінокислотну послідовність із SEQ ID NO:13, та варіабельну ділянку LC1, що містить амінокислотну послідовність із SEQ ID NO:14.
10. Стабільна водна фармацевтична композиція за п. 8 або п. 9, де біспецифічне антитіло до EGFR/сMet містить варіабельну ділянку HC2, що містить амінокислотну послідовність із SEQ ID NO:15, та варіабельну ділянку LC2, що містить амінокислотну послідовність із SEQ ID NO:16.
11. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-10, де HC1 містить амінокислотну послідовність із SEQ ID NO:17 та LC1 містить амінокислотну послідовність із SEQ ID NO:18.
12. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-11, де HC2 містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO: 19, а LC2 містить амінокислотну послідовність із SEQ ID NO:20.
13. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-12, де біспецифічне антитіло до EGFR/сMet являє собою амівантамаб або його біоаналог.
14. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-13, де концентрація біспецифічного антитіла до EGFR/сMet становить приблизно 160 мг/мл.
15. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-14, де концентрація ацетату та/або фармацевтично прийнятної ацетатної солі становить приблизно 30 мМ.
16. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-15, де ацетат та/або фармацевтично прийнятна ацетатну сіль містять льодяну оцтову кислоту та/або тригідрат ацетату натрію.
17. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-16, яка містить приблизно 8,5 % (мас./об.) сахарози.

18. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-17, яка містить приблизно 0,06 % (мас./об.) PS80.

19. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-18, де метіонін включає L-метіонін і має концентрацію приблизно 1 мг/мл.

20. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-19, де концентрація ЕДТА становить приблизно 20 мкг/мл.

21. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-20, де рН становить приблизно 5,7.

22. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-21, де гіалуронідаза являє собою гіалуронідазу людини, необов'язково розчинну РН20 людини, що містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO: 25.

23. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-22, де концентрація гHuPH20 становить від приблизно 1000 Од/мл до приблизно 3000 Од/мл.

24. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-23, де концентрація гHuPH20 становить приблизно 2000 Од/мл.

25. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-24, де стабільність визначають за кольором розчину, рН, каламутністю, кількістю невидимих неозброєним оком частинок, відсотком аглікозильованого важкого ланцюга (AGHC), відсотком нового(-их) піку(-ів), відсотком високомолекулярних сполук (ВМС), відсотком низькомолекулярних сполук (НМС), відсотком суми кислотних піків, відсотком суми основних піків, концентрацією білку, відсотком активності зв'язування EGFR, відсотком активності зв'язування cMet, відсотком PS80, відсоткового значення активності гHuPH20 або будь-якою їхньою комбінацією.

26. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 8-25, де загальний об'єм композиції становить від приблизно 6 мл до приблизно 9 мл.

27. Стабільна водна фармацевтична композиція за п. 24, де загальний обсяг композиції становить приблизно 7,1 мл.

28. Стабільна водна фармацевтична композиція за п. 24, де загальний обсяг композиції становить приблизно 6,6 мл.

29. Стабільна водна фармацевтична композиція за п. 24, де загальний обсяг композиції становить приблизно 8,75 мл.

30. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 1-29, що містить приблизно 160 мг/мл біспецифічного антитіла до EGFR-cMet, приблизно 30 мМ ацетату та/або фармацевтично прийнятної ацетатної солі, приблизно 8,5 % сахарози та приблизно 1 мг/мл L-метіоніну, з полісорбатом 80 до кінцевої концентрації приблизно 0,06 % (мас./об.) та ЕДТА до кінцевої концентрації приблизно 20 мкг/мл, при цьому стабільна водна фармацевтична композиція має рН приблизно 5,7, при цьому біспецифічне антитіло до EGFR-cMet містить важкий ланцюг 1 (HC1), що містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO:17, HC2, що містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO:19, легкий ланцюг 1 (LC1), що містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO:18, і LC2, що містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO:20.

31. Стабільна водна фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 1-29, що містить приблизно 160 мг/мл

біспецифічного антитіла до EGFR-cMet, приблизно 30 мМ ацетату та/або фармацевтично прийнятної ацетатної солі, приблизно 8,5 % сахарози та приблизно 1 мг/мл L-метіоніну, з полісорбатом 80 до кінцевої концентрації приблизно 0,06 % (мас./об.) та ЕДТА до кінцевої концентрації приблизно 20 мкг/мл, і гHuPH20 до кінцевої концентрації приблизно 2000 Од/мл, при цьому стабільна водна фармацевтична композиція має рН приблизно 5,7,

при цьому біспецифічне антитіло до EGFR-cMet містить важкий ланцюг 1 (HC1), що містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO:17, HC2, що містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO:19, легкий ланцюг 1 (LC1), що містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO:18, і LC2, що містить амінокислотну послідовність SEQ ID NO:20.

32. Спосіб лікування раку у суб'єкта, який цього потребує, що включає введення суб'єкту фармацевтичної композиції за будь-яким із пп. 1-31.

33. Спосіб за п. 32, де введення здійснюють підшкірно.

34. Спосіб за пп. 30-31, де рак включає рак легенів, плоскоклітинну карциному голови та шиї (ПКСГШ), гепатоцелюлярний рак (ГЦР), колоректальний рак (КРР), нирково-клітинний рак (НКТ), медулярний рак шлункової залози (МРШЗ), рак шлунково-кишкового тракту (РШКТ), мезотеліому, рак молочної залози (РМЗ) або рак яєчника (РЯ).

35. Спосіб за пп. 32-33, де рак являє собою недрібноклітинний рак легенів (НДРЛ).

36. Спосіб одержання стабільної водної фармацевтичної композиції біспецифічного антитіла, націленого на EGFR та cMet, де біспецифічне антитіло, націлене на EGFR та cMet, містить перший важкий ланцюг (HC1), що містить варіабельну ділянку 1 HC1 (VH1); перший легкий ланцюг (LC1), який містить варіабельну ділянку легкого ланцюга 1 (VL1); другий важкий ланцюг (HC2), який містить варіабельну ділянку 2 HC2 (VH2); і другий легкий ланцюг (LC2), що містить варіабельну ділянку легкого ланцюга 2 (VL2), де VH1 містить ділянку, що визначає комплементарність важкого ланцюга 1 (HCDR1), HCDR2 і HCDR3, що містить амінокислотні послідовності із SEQ ID NO: 1, 2 і 3 відповідно; VL1 містить ділянку, що визначає комплементарність легкого ланцюга 1 (LCDR1), LCDR2 і LCDR3, що містить амінокислотні послідовності із SEQ ID NO: 4, 5 і 6 відповідно; VH2 містить амінокислотні послідовності HCDR1, HCDR2 і HCDR3 із SEQ ID NO: 7, 8 і 9 відповідно; і VL2 містить амінокислотні послідовності LCDR1, LCDR2 і LCDR3 із SEQ ID NO: 10, 11 і 12 відповідно; причому спосіб включає:

поєднання композиції, що містить приблизно 160 мг/мл біспецифічного антитіла, приблизно 30 мМ ацетату та/або фармацевтично прийнятної ацетатної солі, приблизно 8,5 % сахарози та приблизно 1 мг/мл L-метіоніну, з полісорбатом 80 до кінцевої концентрації приблизно 0,06 % (мас./об.) та ЕДТА до кінцевої концентрації приблизно 20 мкг/мл, необов'язково, гHuPH20 до кінцевої концентрації приблизно 2000 Од/мл, при цьому стабільна водна фармацевтична композиція має рН приблизно 5,7.

37. Спосіб за п. 36, де біспецифічне антитіло до EGFR/cMet містить варіабельну ділянку HC1, що містить амінокислотну послідовність із SEQ ID NO:13, та варіабельну ділянку LC1, що містить амінокислотну послідовність із SEQ ID NO:14.

38. Спосіб за будь-яким із пп. 36-37, де біспецифічне антитіло до EGFR/cMet містить варіабельну ділянку

HC2, що містить амінокислотну послідовність із SEQ ID NO:15, та варіабельну ділянку LC2, що містить амінокислотну послідовність із SEQ ID NO:16.

39. Спосіб за будь-яким із пп. 36-38, де антитіло містить важкий ланцюг 1(HC1), що містить амінокислотну послідовність із SEQ ID NO:17, та легкий ланцюг 1(LC1), що містить амінокислотну послідовність із SEQ ID NO:18.

40. Спосіб за будь-яким із пп. 36-39, де антитіло містить HC2, що містить амінокислотну послідовність із SEQ ID NO:19, та LC2, що містить амінокислотну послідовність із SEQ ID NO:20.

41. Спосіб за будь-яким із пп. 36-40, де антитіло являє собою амівантамаб або його біоаналог.

42. Набір, що містить стабільну водну фармацевтичну композицію за будь-яким із пп. 1-31 та інструкцію щодо його застосування.

43. Готовий виріб, що включає контейнер, який містить стабільну водну фармацевтичну композицію за будь-яким із пп. 1-31.

44. Готовий виріб за п. 43, де контейнер являє собою флакон з пробкою, виконаною з можливістю проколання шприцом.

45. Готовий виріб за п. 44, де флакон являє собою флакон для одноразового використання.

46. Фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 1-31 для застосування в лікуванні раку.

47. Фармацевтична композиція за п. 46, де рак включає рак легень, плоскоклітинну карциному голови та шиї (ПККГШ), гепатоцелюлярний рак (ГЦР), колоректальний рак (КРР), нирково-клітинний рак (НКТ), медуллярний рак щитовидної залози (МРЩЗ), рак шлунково-кишкового тракту (РШКТ), мезотеліому, рак молочної залози (РМЗ) або рак яєчника (РЯ).

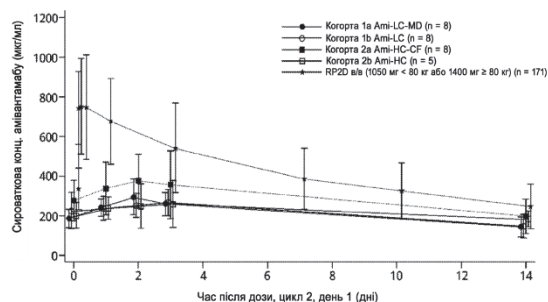
48. Фармацевтична композиція за п. 46, де рак являє собою недрібноклітинний рак легень (НДКРЛ).

49. Фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 1-31 для застосування у виготовленні лікарського засобу для лікування раку.

50. Застосування фармацевтичної композиції для лікування раку у суб'єкта, який цього потребує, шляхом введення фармацевтичної композиції за будь-яким із пп. 1-31.

51. Застосування фармацевтичної композиції за п. 50, де введення здійснюють підшкірно.

52. Спосіб зменшення кількості пов'язаних з інфузією реакцій у пацієнта, який проходить лікування амівантамабом, що включає підшкірне введення пацієнту стабільної фармацевтичної водної композиції за п. 1.



Фіг. 1

(21) а 2023 05956
(22) 19.05.2022

(51) МПК (2024.01)
A61K 31/56 (2006.01)
A61P 1/04 (2006.01)
A61K 9/46 (2006.01)
A61K 9/00
A61K 9/20 (2006.01)

(31) 21174941.1

(32) 20.05.2021

(33) EP

(85) 19.12.2023

(86) PCT/EP2022/063514, 19.05.2022

(71) ДР. ФАЛЬК ФАРМА ГМБХ (DE)

(72) Вільгельм Рудольф (DE), Мюллер Ральф (DE), Грайнвальд Роланд (DE), Прьольс Маркус (DE)

(54) ШИПУЧІ ТАБЛЕТКИ, ЩО ДИСПЕРГУЮТЬСЯ У РОТІ, ЯКІ МІСТЯТЬ БУДЕСОНІД ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ЕОЗИНОФІЛЬНОГО ЕЗОФАГІТУ

(57) 1. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, яка містить будесонід, для застосування при лікуванні еозинофільного езофагіту, яка характеризується тим, що повне загоєння слизової оболонки досягається шляхом введення шипучої таблетки, що диспергується у роті, два рази на день протягом щонайменше шести тижнів лікування, яке можна підтримувати до 144 тижнів.

2. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за п. 1, яка характеризується тим, що таблетка, яка диспергується у роті, містить 0,5 мг будесоніду.

3. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за п. 1, яка характеризується тим, що таблетка, яка диспергується у роті, містить 1 мг будесоніду.

4. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за п. 1, яка характеризується тим, що таблетка, яка диспергується у роті, містить 2 мг будесоніду і її вводять один раз на день.

5. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за будь-яким із пп. 1-4, яка характеризується тим, що глибоку ендоскопічну ремісію визначають як 0 балів за ендоскопічною еталонною оцінкою.

6. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за будь-яким із пп. 1-4, яка характеризується тим, що глибоку гістологічну ремісію визначають як 0 еозинофілів у полі зору мікроскопа при великому збільшенні у всіх біопсіях.

7. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за пп. 1, 2, 5 і 6, яка характеризується тим, що таблетку, яка диспергується у роті, яка містить 0,5 мг будесоніду, вводять два рази на день протягом 6-12 тижнів для досягнення індукції повного загоєння слизової оболонки.

8. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за пп. 1, 3, 5 і 6, яка характеризується тим, що таблетку, яка диспергується у роті, яка містить 1 мг будесоніду, вводять два рази на день протягом 6-12 тижнів для досягнення індукції повного загоєння слизової оболонки.

9. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за будь-яким із пп. 1-7, яка характеризується тим, що повне загоєння слизової оболонки приводить до підвищеної розтяжності стравоходу.

10. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за будь-яким із пп. 1-8, яка характери-

зується тим, що повне загоєння слизової оболонки являє собою глибоку ендоскопічну і глибоку гістологічну ремісію.

11. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за будь-яким із попередніх пунктів, яка характеризується тим, що глибока клінічна ремісія, визначена як "0" балів за числовою рейтинговою шкалою NRS для дисфагії і "0" балів за числовою рейтинговою шкалою NRS для болю при ковтанні, досягаються щонайменше у 85 % пацієнтів, які отримували лікування.

12. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за будь-яким із попередніх пунктів, яка характеризується тим, що глибока ремісія захворювання, що являє собою поєднання глибокої клінічної ремісії з дисфагією і одиофагією, які обидві оцінюються як "0" балів (за числовою рейтинговою шкалою NRS від 0 до 10 балів, де 0 балів означає "повну відсутність симптомів", а 10 балів означають "найбільш важкий симптом") щодня протягом останніх 7 днів, глибока ендоскопічна ремісія з ендоскопічною еталонною оцінкою EREFS=0 балів і глибока гістологічна ремісія при 0 еозинофілів у полі зору мікроскопу при великому збільшенні, підтримується у 70 % пацієнтів, які отримували лікування, більше 3 років.

13. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за будь-яким із пп. 1-10, яка характеризується тим, що розчинення у роті шипучої таблетки, яка диспергується у роті, відбувається у проміжок часу від 2 хвилин до 20 хвилин під дією слини.

14. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за будь-яким із пп. 1-10, яка характеризується тим, що розчинення у роті шипучої таблетки, що диспергується у роті, відбувається у проміжок часу від 2 хвилин до 5 хвилин під дією слини.

15. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за пп. 1 і 3, яка характеризується тим, що добову дозу 2 мг вводять у вигляді однієї таблетки, що містить 1,0 мг будесоніду, вранці та додаткової таблетки, що містить 1,0 мг будесоніду, ввечері.

16. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за будь-яким із пп. 1-12, де повне загоєння слизової оболонки приводить до прийнятної розтяжності стравоходу.

17. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за будь-яким із пп. 1 і 4, яка характеризується тим, що добова доза будесоніду становить 2 мг, яку вводять у підтримуючій фазі.

18. Шипуча таблетка, що диспергується у роті, для застосування за будь-яким із пп. 1-14, де підтримуюче лікування проводять протягом періоду часу від шести тижнів до трьох років.

(85) 06.02.2024

(86) PCT/KR2022/007115, 18.05.2022

(71) ОНКОНИК ТЕРАПЬЮТИКС ІНК. (KR)

(72) Чха Хен Чу (KR), Лі Чанг Сеок (KR), Хан Сан У (KR), Кім Джон (KR)

(54) ТЕРАПЕВТИЧНИЙ АГЕНТ ПРОТИ РАКУ, РЕЗИСТЕНТНОГО ДО ІНГІБІТОРА PARP

(57) 1. Фармацевтична композиція, яка містить 6-{4-[(5-оксо-1,2,3,4,5,6-гексагідробензо[h][1,6]нафтиридин-8-іл)метил]піперазин-1-іл}нікотинітрил або його фармацевтично прийнятну сіль для лікування або профілактики раку у пацієнта з солідним раком, резистентним до інгібітора PARP.

2. Фармацевтична композиція за п. 1, яка відрізняється тим, що пацієнт з солідним раком має пухлину з дефіцитом гомологічної рекомбінації (HRD).

3. Фармацевтична композиція за п. 2, яка відрізняється тим, що пацієнт з солідним раком має мутацію BRCA1/2.

4. Фармацевтична композиція за п. 3, де мутація BRCA1/2 являє собою мутацію зародкової лінії.

5. Фармацевтична композиція за п. 3, яка відрізняється тим, що мутація BRCA1/2 являє собою соматичну мутацію.

6. Фармацевтична композиція за п. 1, яка відрізняється тим, що у пацієнта з солідним раком немає мутації BRCA1/2.

7. Фармацевтична композиція за п. 1, яка відрізняється тим, що інгібітор PARP являє собою щонайменше один інгібітор, вибраний з олапарибу, рупаратибу, нірапарибу і талазопарибу.

8. Фармацевтична композиція за п. 7, яка відрізняється тим, що інгібітор PARP являє собою олапариб.

9. Фармацевтична композиція за п. 1, яка відрізняється тим, що солідний рак являє собою щонайменше один раку, вибраний з раку молочної залози, раку передміхурової залози, раку підшлункової залози, раку яєчників, прогресуючого раку яєчників, серозного раку яєчників високого ступеня злоякісності (включаючи рак фаллопієвих труб або первинний рак очеревини) і метастатичного раку, що поширився з первинного раку яєчників.

10. Фармацевтична композиція за п. 9, яка відрізняється тим, що солідний рак являє собою рак яєчників.

11. Фармацевтична композиція за п. 9, яка відрізняється тим, що солідний рак являє собою метастатичний рак, що поширився з первинного раку яєчників.

12. Фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 1-11, яка відрізняється тим, що фармацевтично прийнята сіль 6-{4-[(5-оксо-1,2,3,4,5,6-гексагідробензо[h][1,6]нафтиридин-8-іл)метил]піперазин-1-іл}нікотинітрилу являє собою цитрат.

13. Фармацевтична композиція за будь-яким із пп. 1-11, яка відрізняється тим, що фармацевтична композиція додатково містить фармацевтично прийнятний носій або ексципієнт.

14. 6-{4-[(5-Оксо-1,2,3,4,5,6-гексагідробензо[h][1,6]нафтиридин-8-іл)метил]піперазин-1-іл}нікотинітрил або його фармацевтично прийнятну сіль для лікування пацієнта з солідним раком, резистентним до інгібітора PARP.

15. Спосіб лікування пацієнта з солідним раком, резистентним до інгібітора PARP, шляхом введення ефективної кількості 6-{4-[(5-оксо-1,2,3,4,5,6-гексагід-

(21) а 2023 06107
(22) 18.05.2022

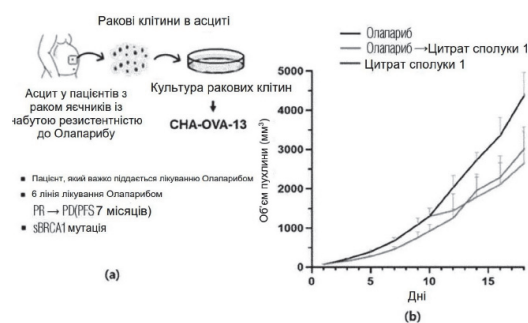
(51) МПК (2024.01)
A61K 31/496 (2006.01)
A61P 35/00

(31) 10-2021-0064278
(32) 18.05.2021
(33) KR
(31) 10-2022-0060706
(32) 18.05.2022
(33) KR

робензо[h][1,6]нафтиридин-8-іл)метил]піперазин-1-іл]нікотинітрилу або його фармацевтично прийнятної солі.

16. Застосування 6-{4-[(5-оксо-1,2,3,4,5,6-гексагідро-бензо[h][1,6]нафтиридин-8-іл)метил]піперазин-1-іл]нікотинітрилу або його фармацевтично прийнятної солі для виробництва лікарського засобу для лікування пацієнта з солідним раком, резистентним до інгібітора PARP.

Протипухлинна дія цитрату сполуки 1 в моделі PDX, що важко піддається лікуванню Олапарибом



Фіг. 4

(21) а 2023 04140
(22) 03.02.2022

(51) МПК (2024.01)
A61K 47/68 (2017.01)
A61K 31/4745 (2006.01)
A61P 35/00

(31) 63/145,367

(32) 03.02.2021

(33) US

(85) 01.09.2023

(86) PCT/US2022/015157, 03.02.2022

(71) СІДЖЕН ІНК. (US), РІДЖЕНТС ОФ ДЗЕ ЮНІВЕРСИТИ ОФ МІННЕСОТА (US)

(72) Ванг Кунг-Перн (US), Сміт Елісон (US), Нойманн Крістофер Скотт (US), Гардай Шира Дж. (US), Фергюсон Девід (US)

(54) ІМУНОСТИМУЛЮЮЧІ СПОЛУКИ І КОН'ЮГАТИ

(57) 1. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:

Ab-(L-D)_p

або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

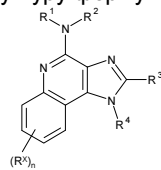
кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або ε-аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

кожен D має структуру формули (A):



(A)

або її фармацевтично прийнятої солі;

де:

R¹ (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з

гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ алкокситіокарбонілу, C₁-C₆ карбамоїлу, C₁-C₆ амідину, C₁-C₆ сульфону, C₁-C₆ тіону, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканол, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₁-C₆ алкокситіокарбоніл, C₁-C₆ карбамоїл, C₁-C₆ амідин, C₁-C₆ сульфон, C₁-C₆ тіон, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтіо та -NR⁴R⁵;

R² (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканол, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтіо та -NR⁴R⁵; або

R¹ і R², разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R³ (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, -NR⁴R⁵, -C(=O)NR⁴R⁵, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ алканоліокси, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканол, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₁-C₆ алканоліокси, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтіо та -NR⁴R⁵; R⁴ являє собою (a) точку ковалентного приєднання до L; (b) -ORᶜ; (c) -S(=O)₂Rᶜ; (d) -C(=O)NRᶜRᶜ; (e) -C(=O)ORᶜ; (f) -C(=O)SRᶜ; (g) -C(=S)Rᶜ; (h) -PO₃Rᶜ; або (j) C₁-C₆ алкіл, необов'язково заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) -ORᶜ;

(iii) -SRᶜ;

(iv) -NH-S(O)₂Rᶜ;

(v) -OC(=O)Rᶜ;

(vi) -CO₂H;

(vii) C₁-C₆ алкоксикарбонілом;

(viii) -C(=O)NRᶜRᶜ;

(ix) -NRᶜRᶜ;

(x) -[N(C₁-C₆ алкіл)RᶜRᶜ]⁺;

(xi) -(феніл)C₁-C₆ алкілом, де C₁-C₆ алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NRᶜRᶜ, -[N(C₁-C₆ алкіл)RᶜRᶜ]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщеним галогеном, гідроксилом, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NRᶜRᶜ або -CO₂H;

(xiii) -(5-10-членний гетероарил)C₁-C₆ алкіл, де C₁-C₆ алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^DR^E, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, -NR^DR^E, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^DR^E, -SR^C, (C₁-C₆)алкоксикарбонілом або -CO₂H; при цьому коли R^A являє собою (j), C₁-C₆ алкіл або його замісник можуть бути додатково заміщені точкою ковалентного приєднання до L;

кожен R^X (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, -C(=O)OR^F, -C(=O)NR^GR^H, -S(O₂)NR^GR^H, -N(R^I)-C(=O)R^J, -N(R^I)-S(O₂)R^K, галогену, гідроксилу, нітро, ціано, -CF₃, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алканоліокси, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ галогеналкілу, C₁-C₆ галогеналкокси та -NR^AR^B; при цьому не більше одного R^X являє собою точку ковалентного приєднання до L;

нижній індекс n дорівнює 0, 1, 2, 3 або 4;

кожен R^A та R^B (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L, (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C₁-C₆ алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами; при цьому тільки один з R^A та R^B являє собою точку ковалентного приєднання до L;

R^C (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C₁-C₁₀ алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

кожен R^D, R^E, R^G та R^H (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₃-C₈ циклоалкілу, C₃-C₈ циклоалкіл(C₁-C₆ алкіл)-, арилу та арил(C₁-C₆ алкіл)-; або R^D та R^E або R^G та R^H разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами; при цьому тільки один із R^D, R^E, R^G та R^H являє собою точку ковалентного приєднання до L;

R^F (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₃-C₈ циклоалкілу, арилу, арил(C₁-C₆ алкіл)- і C₁-C₆ алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C₁-C₆ алканоліокси, C₁-C₆ алкокси та C₃-C₈ циклоалкілу;

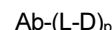
кожен R^I, R^J та R^K (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C₁-C₆ алкілу; при цьому тільки один з R^I, R^J та R^K являє собою точку ковалентного приєднання до L;

при цьому тільки один із R¹, R², R³, R⁴, R^X, R^A, R^B, R^C, R^D, R^E, R^F, R^G, R^H, R^I, R^J та R^K являє собою точку ковалентного приєднання до L;

кожен R¹ та R⁴ необов'язково заміщений соліюбілізуючою групою (S₆) вибраною з групи, що складається з фосфорилу, сульфурилу, нітро, C₅-C₉ моносахариду, C₁₀-C₁₈ дисахариду та C₁₅-C₂₇ трисахариду; і

при цьому кожен D має лише одну точку ковалентного приєднання до L.

2. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

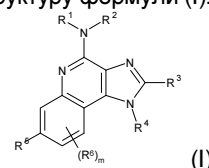
кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або ε-аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

кожен D має структуру формули (I):



або її фармацевтично прийнятої солі;

де:

R¹ (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ алкокситіокарбонілу, C₁-C₆ карбаміолу, C₁-C₆ амідину, C₁-C₆ сульфону, C₁-C₆ тіону, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканол, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₁-C₆ алкокситіокарбоніл, C₁-C₆ карбаміол, C₁-C₆ амідин, C₁-C₆ сульфон, C₁-C₆ тіон, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтію та -NR^AR^B;

R² (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканол, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтію та -NR^AR^B; або

R¹ і R², разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R³ (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, -NR^AR^B, -C(=O)NR^AR^B, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ алканоліокси, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканол, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₁-C₆ алканоліокси, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл

необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранилу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтіо та -NR^AR^B;

R⁴ являє собою (a) точку ковалентного приєднання до L; (b) -OR^C; (c) -S(=O)₂R^C; (d) -C(=O)NR^DR^E; (e) -C(=O)OR^C; (f) -C(=O)SR^C; (g) -C(=S)R^C; (h) -PO₃R^C; або (j) C₁-C₆ алкіл, необов'язково заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) -OR^C;

(iii) -SR^C;

(iv) -NH-S(O)₂R^C;

(v) -OC(=O)R^C;

(vi) -CO₂H;

(vii) C₁-C₆ алкоксикарбонілом;

(viii) -C(=O)NR^DR^E;

(ix) -NR^DR^E;

(x) -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺;

(xi) -(феніл)C₁-C₆ алкілом, де C₁-C₆ алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^DR^E, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксиллом, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^DR^E або -CO₂H;

(xiii) -(5-10-членний гетероарил)C₁-C₆ алкіл, де C₁-C₆ алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^DR^E, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, -NR^DR^E, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^DR^E, -SR^C, (C₁-C₆)алкоксикарбонілом або -CO₂H;

при цьому коли R⁴ являє собою (j), C₁-C₆ алкіл або його замісник можуть бути додатково заміщені точкою ковалентного приєднання до L;

R⁵ (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, -C(=O)OR^F, -NO₂, -CN, -CF₃-C(=O)NR^GR^H, -S(O)₂NR^GR^H, -N(R^I)-C(=O)R^J, -N(R^I)-S(O)₂R^K і SO₃R^K; кожен R⁶ (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алканоліокси, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ галогеналкілу, C₁-C₆ галогеналкокси та -NR^AR^B; при цьому не більше одного R⁶ являє собою точку ковалентного приєднання до L;

нижній індекс m дорівнює 0, 1, 2 або 3; кожен R^A та R^B (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L, (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C₁-C₆ алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикліт, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами; при цьому тільки один з R^A та R^B являє собою точку ковалентного приєднання до L;

R^C (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C₁-C₁₀ алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

кожен R^D, R^E, R^G та R^H (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₃-C₈ циклоалкілу, C₃-C₈ циклоалкіл(C₁-C₆ алкіл)-, арилу та арил(C₁-C₆ алкіл)-; або R^D та R^E або R^G та R^H разом з атомом нітрогену, до

якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикліт, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами; при цьому тільки один із R^D, R^E, R^G та R^H являє собою точку ковалентного приєднання до L;

R^F (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₃-C₈ циклоалкілу, арилу, арил(C₁-C₆ алкіл)- і C₁-C₆ алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C₁-C₆ алканоліокси, C₁-C₆ алкокси та C₃-C₈ циклоалкілу;

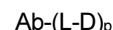
кожен R^I, R^J та R^K (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C₁-C₆ алкілу; при цьому тільки один з R^I, R^J та R^K являє собою точку ковалентного приєднання до L;

при цьому тільки один із R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R^A, R^B, R^C, R^D, R^E, R^F, R^G, R^H, R^I, R^J і R^K являє собою точку ковалентного приєднання до L;

кожен R¹ та R⁴ необов'язково заміщений солубілізуючою групою (S_b) вибраною з групи, що складається з фосфорилу, сульфурілу, нітро, C₅-C₉ моносахариду, C₁₀-C₁₈ дисахариду та C₁₅-C₂₇ трисахариду; і

при цьому кожен D має лише одну точку ковалентного приєднання до L.

3. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

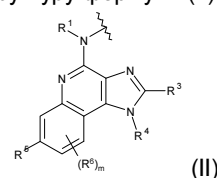
Ab являє собою антитіло;

де кожен D кон'югований з лінкером (L);

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або ε-аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

кожен D має структуру формули (II):



або її фармацевтично прийнятої солі;

де:

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до L;

R<sup>1</sup> вибраний із групи, що складається з гідрогену, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкінілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканолу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбонілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокситіокарбонілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> карбамолу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> амідину, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> сульфону, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> тіону, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкініл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканол, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокситіокарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> карбамол, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> амідин, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> сульфон, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> тіон, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранилу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілтіо та -NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>;

$R^3$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $-NR^A R^B$ ,  $-C(=O)NR^A R^B$ ,  $C_1-C_6$  алкілу,  $C_2-C_6$  алкенілу,  $C_2-C_6$  алкінілу,  $C_1-C_6$  алканолілу,  $C_1-C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_1-C_6$  алканоліокси,  $C_3-C_6$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен  $C_1-C_6$  алкіл,  $C_2-C_6$  алкеніл,  $C_2-C_6$  алкініл,  $C_1-C_6$  алканоліл,  $C_1-C_6$  алкоксикарбоніл,  $C_1-C_6$  алканоліокси,  $C_3-C_6$  циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу,  $C_3-C_8$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу,  $C_1-C_6$  алкокси,  $C_1-C_6$  алкілтію та  $-NR^A R^B$ ;

$R^4$  являє собою (a)  $-OR^C$ ; (b)  $-S(=O)2R^C$ ; (c)  $-C(=O)NR^D R^E$ ; (d)  $-C(=O)OR^C$ ; (e)  $-C(=O)SR^C$ ; (f)  $-C(=S)R^C$ ; (g)  $-PO_3R^C$ ; або (h)  $C_1-C_6$  алкіл, необов'язково заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii)  $-OR^C$ ;

(iii)  $-SR^C$ ;

(iv)  $-NH-S(O_2)R^C$ ;

(v)  $-OC(=O)R^C$ ;

(vi)  $-CO_2H$ ;

(vii)  $C_1-C_6$  алкоксикарбонілом;

(viii)  $-C(=O)NR^D R^E$ ;

(ix)  $-NR^D R^E$ ;

(x)  $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ ;

(xi)  $-(\text{феніл})C_1-C_6$  алкілом, де  $C_1-C_6$  алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом,  $-NR^D R^E$ ,  $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$  або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксилом,  $C_1-C_6$  алкокси,  $-C(=O)NR^D R^E$  або  $-CO_2H$ ;

(xiii)  $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_1-C_6$  алкіл, де  $C_1-C_6$  алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом,  $-NR^D R^E$ ,  $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$  або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном,  $-NR^D R^E$ ,  $C_1-C_6$  алкокси,  $-C(=O)NR^D R^E$  або  $-CO_2H$ ;

$R^5$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $-C(=O)OR^F$ ,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-C(=O)NR^G R^H$ ,  $-S(O_2)NR^G R^H$ ,  $-N(R^I)-C(=O)R^J$ ,  $-N(R^I)-S(O_2)R^K$  і  $SO_3R^K$ ;

кожен  $R^6$  незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано,  $C_1-C_6$  алкілу,  $C_2-C_6$  алкенілу,  $C_2-C_6$  алкінілу,  $C_1-C_6$  алкокси,  $C_1-C_6$  алканолілу,  $C_1-C_6$  алканоліокси,  $C_1-C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_1-C_6$  галогеналкілу,  $C_1-C_6$  галогеналкокси і  $-NR^A R^B$ ;

нижній індекс  $m$  дорівнює 0, 1, 2 або 3;

кожен  $R^A$  та  $R^B$  незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та  $C_1-C_6$  алкілу; або  $R^A$  та  $R^B$  разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  $C_1-C_6$  алкілами;

$R^C$  вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та  $C_1-C_{10}$  алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен  $R^D$ ,  $R^E$ ,  $R^G$  та  $R^H$  незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $C_1-C_6$  алкілу,  $C_2-C_6$  алкенілу,  $C_3-C_8$  циклоалкілу,  $C_3-C_8$  циклоалкіл( $C_1-C_6$  алкіл)-, арилу та арил( $C_1-C_6$  алкіл)-; або  $R^D$  та  $R^E$  або  $R^G$  та  $R^H$  разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі,

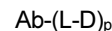
необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  $C_1-C_6$  алкілами;

кожен  $R^1$  та  $R^4$  необов'язково заміщений солубілізуючою групою ( $S_b$ ) вибраною з групи, що складається з фосфорилу, сульфурілу, нітро,  $C_5-C_9$  моносахариду,  $C_{10}-C_{18}$  дисахариду та  $C_{15}-C_{27}$  трисахариду;

$R^F$  вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу,  $C_2-C_6$  алкенілу,  $C_2-C_6$  алкінілу,  $C_3-C_8$  циклоалкілу, арилу, арил( $C_1-C_6$  алкіл)- і  $C_1-C_6$  алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену,  $C_1-C_6$  алканоліокси,  $C_1-C_6$  алкокси та  $C_3-C_8$  циклоалкілу; і

кожен  $R^I$ ,  $R^J$  і  $R^K$  незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і  $C_1-C_6$  алкілу.

4. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

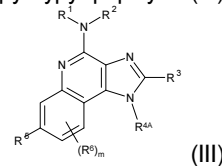
кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або  $\epsilon$ -аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс  $p$  являє собою ціле число від 1 до 16;

кожен D має структуру формули (III):



(III)

або її фармацевтично прийнятої солі;

де:

$R^1$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $C_1-C_6$  алкілу,  $C_2-C_6$  алкенілу,  $C_2-C_6$  алкінілу,  $C_1-C_6$  алканолілу,  $C_1-C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_1-C_6$  алкокситіокарбонілу,  $C_1-C_6$  карбамоїлу,  $C_1-C_6$  амідину,  $C_1-C_6$  сульфону,  $C_1-C_6$  тіону,  $C_3-C_6$  циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен  $C_1-C_6$  алкіл,  $C_2-C_6$  алкеніл,  $C_2-C_6$  алкініл,  $C_1-C_6$  алканоліл,  $C_1-C_6$  алкоксикарбоніл,  $C_1-C_6$  алкокситіокарбоніл,  $C_1-C_6$  карбамоїл,  $C_1-C_6$  амідин,  $C_1-C_6$  сульфону,  $C_1-C_6$  тіон,  $C_3-C_6$  циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу,  $C_3-C_8$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу,  $C_1-C_6$  алкокси,  $C_1-C_6$  алкілтію та  $-NR^A R^B$ ;

$R^2$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $C_1-C_6$  алкілу,  $C_2-C_6$  алкенілу,  $C_2-C_6$  алкінілу,  $C_1-C_6$  алканолілу,  $C_1-C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_3-C_6$  циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен  $C_1-C_6$  алкіл,  $C_2-C_6$  алкеніл,  $C_2-C_6$  алкініл,  $C_1-C_6$  алканоліл,  $C_1-C_6$  алкоксикарбоніл,  $C_3-C_6$  циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу,  $C_3-C_8$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу,  $C_1-C_6$  алкокси,  $C_1-C_6$  алкілтію та  $-NR^A R^B$ ; або

$R^1$  і  $R^2$ , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необо-



в'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілами;

R<sup>3</sup> вибраний із групи, що складається з гідрогену, -NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>, -C(=O)NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкінілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканолу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбонілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканолікси, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкініл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканол, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканолікси, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранилу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілію та -NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>;

R<sup>4A</sup> являє собою (а) точку ковалентного приєднання до L; або (b) C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) -OR<sup>C</sup>;

(iii) -SR<sup>C</sup>;

(iv) -NH-S(O<sub>2</sub>)R<sup>C</sup>;

(v) -OC(=O)R<sup>C</sup>;

(vi) -CO<sub>2</sub>H;

(vii) C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбонілом;

(viii) -C(=O)NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>;

(ix) -NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>;

(x) -[N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)R<sup>D</sup>R<sup>E</sup>]<sup>+</sup>;

(xi) -(феніл)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілом, де C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>, -[N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)R<sup>D</sup>R<sup>E</sup>]<sup>+</sup> або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксилом, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, -C(=O)NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup> або -CO<sub>2</sub>H;

(xiii) -(5-10-членний гетероарил)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, де C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>, -[N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)R<sup>D</sup>R<sup>E</sup>]<sup>+</sup> або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, -NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, -C(=O)NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup> або -CO<sub>2</sub>H;

при цьому коли R<sup>4A</sup> являє собою (b), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл або його замісник додатково заміщені точкою ковалентного приєднання до L;

R<sup>5</sup> вибраний із групи, що складається з гідрогену, -C(=O)OR<sup>F</sup>, -NO<sub>2</sub>, -CN, -CF<sub>3</sub>-C(=O)NR<sup>G</sup>R<sup>H</sup>, -S(O<sub>2</sub>)NR<sup>G</sup>R<sup>H</sup>, -N(R<sup>I</sup>)-C(=O)R<sup>I</sup>, -N(R<sup>I</sup>)-S(O<sub>2</sub>)R<sup>K</sup> і -SO<sub>3</sub>R<sup>K</sup>; кожен R<sup>6</sup> незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкінілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканолу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканолікси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбонілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкокси і -NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>;

нижній індекс m дорівнює 0, 1, 2 або 3;

кожен R<sup>A</sup> та R<sup>B</sup> незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу; або R<sup>A</sup> та R<sup>B</sup> разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілами;

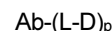
R<sup>C</sup> вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен R<sup>D</sup>, R<sup>E</sup>, R<sup>G</sup> та R<sup>H</sup> незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенілу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкілу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкіл(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)-, арилу та арил(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)-; або R<sup>D</sup> та R<sup>E</sup> або

R<sup>G</sup> та R<sup>H</sup> разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілами;

R<sup>F</sup> вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкінілу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкілу, арилу, арил(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)- і C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканолікси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси та C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкілу;

R<sup>I</sup> необов'язково заміщений солубілізуючою групою (S<sub>b</sub>), вибраною з групи, що складається з фосфорилу, сульфурілу, нітро, C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub> моносахариду, C<sub>10</sub>-C<sub>18</sub> дисахариду та C<sub>15</sub>-C<sub>27</sub> трисахариду; і кожен R<sup>I</sup>, R<sup>J</sup> і R<sup>K</sup> незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу.

5. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

де кожен D кон'югований з лінкером (L);

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або ε-аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

L має формулу -M-(A)<sub>a</sub>-(W)<sub>w</sub>-(Y)<sub>y</sub>-(X)<sub>x</sub>-, де:

нижній індекс a дорівнює 0 або 1;

нижній індекс u дорівнює 0 або 1;

нижній індекс w дорівнює 0 або 1;

нижній індекс x дорівнює 0 або 1;

M являє собою сукцинімід, гідролізований сукцинімід, амід, метилкетон або триазол;

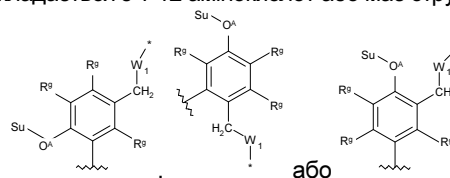
A являє собою C<sub>2-20</sub> алкілен необов'язково заміщений 1-4 R<sup>a1</sup>; або 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-4 R<sup>b1</sup>;

кожен R<sup>a1</sup> незалежно вибраний із групи, яка складається з: C<sub>1-6</sub> алкілу, C<sub>1-6</sub> галогеналкілу, C<sub>1-6</sub> алкокси, C<sub>1-6</sub> галогеналкокси, галогену, -OH, =O, -NR<sup>d1</sup>R<sup>e1</sup>, -(C<sub>1-6</sub> алкілен)-NR<sup>d1</sup>R<sup>e1</sup>, -C(=O)NR<sup>d1</sup>R<sup>e1</sup>, -C(=O)(C<sub>1-6</sub> алкіл) і -C(=O)O(C<sub>1-6</sub> алкіл);

кожен R<sup>b1</sup> незалежно вибраний із групи, яка складається з: C<sub>1-6</sub> алкілу, C<sub>1-6</sub> галогеналкілу, C<sub>1-6</sub> алкокси, C<sub>1-6</sub> галогеналкокси, галогену, -OH, -NR<sup>d1</sup>R<sup>e1</sup>, -(C<sub>1-6</sub> алкілен)-NR<sup>d1</sup>R<sup>e1</sup>, -C(=O)NR<sup>d1</sup>R<sup>e1</sup>, -C(=O)(C<sub>1-6</sub> алкіл) і -C(=O)O(C<sub>1-6</sub> алкіл);

кожен R<sup>d1</sup> і R<sup>e1</sup> незалежно являє собою гідроген або C<sub>1-3</sub> алкіл;

W складається з 1-12 амінокислот або має структуру:



де Su являє собою цукровий фрагмент;

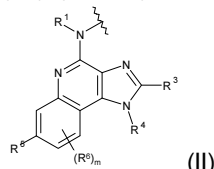
-O<sup>A</sup>- представляє атом оксигену або глікозидний зв'язок;

кожен R<sup>g</sup> незалежно являє собою гідроген, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, -N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)<sub>2</sub>, -NHC(=O)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл), -CN, -CF<sub>3</sub>, ацил, карбоксамід, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл або -NO<sub>2</sub>;

W<sup>1</sup> відсутній, являє собою \*-C(=O)-O- або \*-O-C(=O)-;

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до A або M;

* представляє ковалентне приєднання до X, Y або D;
Y являє собою самознищуваний фрагмент, несамо-
знищуваний фрагмент, що вивільняється, або нероз-
щеплюваний фрагмент;
X являє собою C₁-C₆ алкілен або 3-6-членний гете-
роалкілен;
L необов'язково заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1
до ПЕГ72;
кожен D має структуру формули (II):



або її фармацевтично прийнятої солі;
де:

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до L;  
R<sup>1</sup> вибраний із групи, що складається з гідрогену,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкінілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
алканолу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбонілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси-  
тіокарбонілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> карбамілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> амідину, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
сульфону, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> тіону, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкілу, фенілу та  
5-10-членного гетероарилу; де кожен C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкініл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканоліл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
алкоксикарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокситіокарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
карбамііл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> амідин, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> сульфон, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> тіон,  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил  
необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалеж-  
но вибраними з групи, що складається з гідроксилу,  
галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> цик-  
лоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілтію та -NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>;  
R<sup>3</sup> вибраний із групи, що складається з гідрогену,  
-NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>, -C(=O)NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенілу,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкінілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканолу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикар-  
бонілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканоліокси, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкілу, фені-  
лу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гете-  
роциклу; де кожен C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>  
алкініл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканоліл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
алканоліокси, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкіл, феніл, 5-10-членний  
гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково  
заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними  
з групи, що складається з гідроксилу, галогену,  
сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> цикло-  
алкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілтію та -NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>;  
R<sup>4</sup> являє собою (a) -OR<sup>C</sup>; (b) -S(=O)<sub>2</sub>R<sup>C</sup>; (c)  
-C(=O)NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>; (d) -C(=O)OR<sup>C</sup>; (e) -C(=O)SR<sup>C</sup>; (f)  
-C(=S)R<sup>C</sup>; (g) -PO<sub>3</sub>R<sup>C</sup>; або (h) C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, необов'яз-  
ково заміщений:

- (i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;
- (ii) -OR<sup>C</sup>;
- (iii) -SR<sup>C</sup>;
- (iv) -NH-S(O)<sub>2</sub>R<sup>C</sup>;
- (v) -OC(=O)R<sup>C</sup>;
- (vi) -CO<sub>2</sub>H;
- (vii) C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбонілом;
- (viii) -C(=O)NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>;
- (ix) -NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>;
- (x) -[N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)R<sup>D</sup>R<sup>E</sup>]<sup>+</sup>;
- (xi) -(феніл)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілом, де C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл заміщений  
5-10-членним гетероарилом, -NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>, -[N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> ал-  
кіл)R<sup>D</sup>R<sup>E</sup>]<sup>+</sup> або 1-3 незалежно вибраними галогенами;
- (xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксилом, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
алкокси, -C(=O)NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup> або -CO<sub>2</sub>H;

(xiii) -(5-10-членний гетероарил)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, де C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>,  
-[N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)R<sup>D</sup>R<sup>E</sup>]<sup>+</sup> або 1-3 незалежно вибраними  
галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково замі-  
щеним галогеном, -NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, -C(=O)NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>  
або -CO<sub>2</sub>H;

R<sup>5</sup> вибраний із групи, що складається з гідрогену,  
-C(=O)OR<sup>F</sup>, -NO<sub>2</sub>, -CN, -CF<sub>3</sub>-C(=O)NR<sup>G</sup>R<sup>H</sup>, -S(O)<sub>2</sub>NR<sup>G</sup>R<sup>H</sup>,  
-N(R<sup>I</sup>)-C(=O)R<sup>J</sup>, -N(R<sup>I</sup>)-S(O)<sub>2</sub>R<sup>K</sup> і SO<sub>3</sub>R<sup>K</sup>;

кожен R<sup>6</sup> незалежно вибраний із групи, що скла-  
дається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
алкілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкінілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканолу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканоліокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси-  
карбонілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкокси  
і -NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>;

нижній індекс m дорівнює 0, 1, 2 або 3;

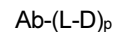
кожен R<sup>A</sup> та R<sup>B</sup> незалежно вибраний із групи, що  
складається з гідрогену та C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу; або R<sup>A</sup> та  
R<sup>B</sup> разом з атомом нітрогену, до якого вони приєд-  
нані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'яз-  
ково заміщений 1-3 незалежно вибраними C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> ал-  
кілами;

R<sup>C</sup> вибраний із групи, що складається з гідрогену,  
фенілу та C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкілу, необов'язково заміщеного  
фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами;  
кожен R<sup>D</sup>, R<sup>E</sup>, R<sup>G</sup> та R<sup>H</sup> незалежно вибраний із гру-  
пи, що складається з гідрогену, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>  
алкенілу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкілу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкіл(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
алкіл)-, арилу та арил(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)-; або R<sup>D</sup> та R<sup>E</sup>  
або R<sup>G</sup> та R<sup>H</sup> разом з атомом нітрогену, до якого во-  
ни приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі,  
необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілами;

R<sup>F</sup> вибраний із групи, що складається з гідрогену,  
трифторметилу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкінілу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>  
циклоалкілу, арилу, арил(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)- і C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкі-  
лу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, неза-  
лежно вибраними з групи, що складається з галоген-  
ну, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканоліокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси та C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> цик-  
лоалкілу;

кожен R<sup>1</sup> та R<sup>4</sup> необов'язково заміщений солубілі-  
зуючою групою (S<sub>b</sub>) вибраною з групи, що складає-  
ться з фосфорилу, сульфурілу, нітро, C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub> моноса-  
хариду, C<sub>10</sub>-C<sub>18</sub> дисахариду та C<sub>15</sub>-C<sub>27</sub> трисахариду; і  
кожен R<sup>I</sup>, R<sup>J</sup> і R<sup>K</sup> незалежно вибраний з групи, що  
складається з гідрогену і C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу.

6. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC)  
що має структуру:



або його фармацевтично прийнята сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допо-  
могою атома сірки залишку цистеїну або ε-аміногру-  
пи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

L має формулу -M-(A)<sub>a</sub>-(W)<sub>w</sub>-(Y)<sub>y</sub>-(X)<sub>x</sub>, де:

нижній індекс a дорівнює 0 або 1;

нижній індекс u дорівнює 0 або 1;

нижній індекс w дорівнює 0 або 1;

нижній індекс x дорівнює 0 або 1;

M являє собою сукцинімід, гідролізований сукцині-  
мід, амід, метилкетон або триазол;

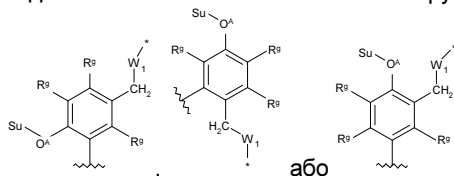
А являє собою  $C_{2-20}$  алкілен необов'язково заміщений 1-4  $R^{a1}$ ; або 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-4  $R^{b1}$ ;

кожен  $R^{a1}$  незалежно вибраний із групи, яка складається з:  $C_{1-6}$  алкілу,  $C_{1-6}$  галогеналкілу,  $C_{1-6}$  алкокси,  $C_{1-6}$  галогеналкокси, галогену,  $-OH$ ,  $=O$ ,  $-NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$  і  $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$ ;

кожен  $R^{b1}$  незалежно вибраний із групи, яка складається з:  $C_{1-6}$  алкілу,  $C_{1-6}$  галогеналкілу,  $C_{1-6}$  алкокси,  $C_{1-6}$  галогеналкокси, галогену,  $-OH$ ,  $-NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$  і  $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$ ;

кожен  $R^{d1}$  і  $R^{e1}$  незалежно являє собою гідроген або  $C_{1-3}$  алкіл;

W складається з 1-12 амінокислот або має структуру:



де Su являє собою цукровий фрагмент;

$-O^A$  представляє атом оксигену або глікозидний зв'язок;

кожен  $R^9$  незалежно являє собою гідроген, галоген,  $C_{1-6}$  алкокси,  $-N(C_{1-6} \text{ алкіл})_2$ ,  $-NHC(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$ ,  $-CN$ ,  $-CF_3$ , ацил, карбоксамід,  $C_{1-6}$  алкіл або  $-NO_2$ ;

$W^1$  відсутній, являє собою  $-C(=O)-O-$  або  $-O-C(=O)-$ ;

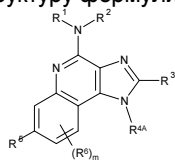
~~~~~ представляє ковалентне приєднання до А або М;

* представляє ковалентне приєднання до Х, Y або D; Y являє собою самознищений фрагмент, несамознищений фрагмент, що вивільняється, або нерозщеплюваний фрагмент;

X являє собою C_{1-6} алкілен або 3-6-членний гетероалкілен;

L необов'язково заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72;

кожен D має структуру формули (III):



або її фармацевтично прийнятої солі;

де:

R^1 вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкенілу, C_{2-6} алкінілу, C_{1-6} алканолу, C_{1-6} алкоксикарбонілу, C_{1-6} алкокситіокарбонілу, C_{1-6} карбамілу, C_{1-6} амідину, C_{1-6} сульфону, C_{1-6} тіону, C_{3-6} циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алканол, C_{1-6} алкоксикарбоніл, C_{1-6} амідин, C_{1-6} сульфон, C_{1-6} тіон, C_{3-6} циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C_{3-8} циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} алкілію та $-NR^A R^B$;

R^2 вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкенілу, C_{2-6} алкінілу, C_{1-6} алканолу, C_{1-6} алкоксикарбонілу, C_{3-6} циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C_{1-6}

алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алканол, C_{1-6} алкоксикарбоніл, C_{3-6} циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C_{3-8} циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} алкілію та $-NR^A R^B$; або

R^1 і R^2 , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_{1-6} алкілами;

R^3 вибраний із групи, що складається з гідрогену, $-NR^A R^B$, $-C(=O)NR^A R^B$, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкенілу, C_{2-6} алкінілу, C_{1-6} алканолу, C_{1-6} алкоксикарбонілу, C_{1-6} алканоліокси, C_{3-6} циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алканол, C_{1-6} алкоксикарбоніл, C_{1-6} алканоліокси, C_{3-6} циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C_{3-8} циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} алкілію та $-NR^A R^B$;

R^{4A} являє собою (а) точку ковалентного приєднання до L; або (b) C_{1-6} алкіл, заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) $-OR^C$;

(iii) $-SR^C$;

(iv) $-NH-S(O_2)R^C$;

(v) $-OC(=O)R^C$;

(vi) $-CO_2H$;

(vii) C_{1-6} алкоксикарбонілом;

(viii) $-C(=O)NR^D R^E$;

(ix) $-NR^D R^E$;

(x) $-[N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^D R^E]^+$;

(xi) $-(\text{феніл})C_{1-6} \text{ алкілом}$, де C_{1-6} алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксилом, C_{1-6} алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$ або $-CO_2H$;

(xiii) $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_{1-6} \text{ алкіл}$, де C_{1-6} алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, $-NR^D R^E$, C_{1-6} алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$ або $-CO_2H$;

при цьому коли R^{4A} являє собою (b), C_{1-6} алкіл або його замісник додатково заміщені точкою ковалентного приєднання до L;

R^5 вибраний із групи, що складається з гідрогену, $-C(=O)OR^F$, $-NO_2$, $-CN$, $-CF_3-C(=O)NR^G R^H$, $-S(O_2)NR^G R^H$, $-N(R^I)-C(=O)R^J$, $-N(R^I)-S(O_2)R^K$ і $SO_3 R^K$;

кожен R^6 незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкенілу, C_{2-6} алкінілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} алканолу, C_{1-6} алканоліокси, C_{1-6} алкоксикарбонілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} галогеналкокси і $-NR^A R^B$;

нижній індекс m дорівнює 0, 1, 2 або 3;

кожен R^A та R^B незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C_{1-6} алкілу; або R^A та R^B

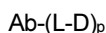
разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R^C вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C₁-C₁₀ алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен R^D, R^E, R^G та R^H незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₃-C₈ циклоалкілу, C₃-C₈ циклоалкіл(C₁-C₆ алкіл)-, арилу та арил(C₁-C₆ алкіл)-; або R^D та R^E або R^G та R^H разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R^F вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₃-C₈ циклоалкілу, арилу, арил(C₁-C₆ алкіл)- і C₁-C₆ алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C₁-C₆ алканоліокси, C₁-C₆ алкокси та C₃-C₈ циклоалкілу;

R^I необов'язково заміщений солубілізуючою групою (S_b), вибраною з групи, що складається з фосфору, сульфурілу, нітро, C₅-C₉ моносахариду, C₁₀-C₁₈ дисахариду та C₁₅-C₂₇ трисахариду; і кожен R^I, R^J і R^K незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і C₁-C₆ алкілу.

7. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнятна сіль; де:

Ab являє собою антитіло;

кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або ε-аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

L має формулу -M-(A)_a-(W)_w-(Y)_y-(X)_x-, де:

нижній індекс a дорівнює 0 або 1;

нижній індекс y дорівнює 0 або 1;

нижній індекс w дорівнює 0 або 1;

нижній індекс x дорівнює 0 або 1;

M являє собою сукцинімід, гідролізований сукцинімід, амід, метилкетон або триазол;

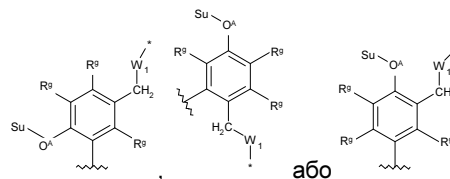
A являє собою C₂-20 алкілен необов'язково заміщений 1-4 R^{a1}; або 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-4 R^{b1};

кожен R^{a1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C₁-6 алкілу, C₁-6 галогеналкілу, C₁-6 алкокси, C₁-6 галогеналкокси, галогену, -OH, =O, -NR^{d1}R^{e1}, -(C₁-6 алкілен)-NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)(C₁-6 алкіл) і -C(=O)O(C₁-6 алкіл);

кожен R^{b1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C₁-6 алкілу, C₁-6 галогеналкілу, C₁-6 алкокси, C₁-6 галогеналкокси, галогену, -OH, -NR^{d1}R^{e1}, -(C₁-6 алкілен)-NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)(C₁-6 алкіл) і -C(=O)O(C₁-6 алкіл);

кожен R^{d1} і R^{e1} незалежно являє собою гідроген або C₁-3 алкіл;

W складається з 1-12 амінокислот або має структуру:



де Su являє собою цукровий фрагмент;

-O^A- представляє атом оксигену або глікозидний зв'язок;

кожен R^g незалежно являє собою гідроген, галоген, C₁-C₆ алкокси, -N(C₁-C₆ алкіл)₂, -NHC(=O)(C₁-C₆ алкіл), -CN, -CF₃, ацил, карбоксамід, C₁-C₆ алкіл або -NO₂;

W¹ відсутній, являє собою *-C(=O)-O- або *-O-C(=O)-;

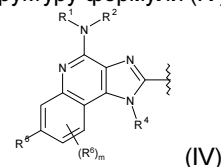
~~~~~ представляє ковалентне приєднання до A або M;

\* представляє ковалентне приєднання до X, Y або D; Y являє собою самознижуваний фрагмент, несамознижуваний фрагмент, що вивільняється, або нерозщеплюваний фрагмент;

X являє собою C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілен або 3-6-членний гетероалкілен;

L необов'язково заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72;

кожен D має структуру формули (IV):



або її фармацевтично прийнятої солі;

де:

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до L;

R¹ вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолілу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ алкокситіокарбонілу, C₁-C₆ карбамоїлу, C₁-C₆ амідину, C₁-C₆ сульфону, C₁-C₆ тіону, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканоліл, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₁-C₆ алкокситіокарбоніл, C₁-C₆ карбамоїл, C₁-C₆ амідин, C₁-C₆ сульфон, C₁-C₆ тіон, C₃-C₈ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілітію та -NR^AR^B;

R² вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолілу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканоліл, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₃-C₈ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілітію та -NR^AR^B; або

R¹ і R², разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R^4 являє собою (a) $-OR^C$; (b) $-S(=O)_2R^C$; (c) $-C(=O)NR^DR^E$; (d) $-C(=O)OR^C$; (e) $-C(=O)SR^C$; (f) $-C(=S)R^C$; (g) $-PO_3R^C$; або (h) C_1-C_6 алкіл, необов'язково заміщений;

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) $-OR^C$;

(iii) $-SR^C$;

(iv) $-NH-S(O)_2R^C$;

(v) $-OC(=O)R^C$;

(vi) $-CO_2H$;

(vii) C_1-C_6 алкоксикарбонілом;

(viii) $-C(=O)NR^DR^E$;

(ix) $-NR^DR^E$;

(x) $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^DR^E]^+$;

(xi) $-(\text{феніл})C_1-C_6$ алкілом, де C_1-C_6 алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^DR^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^DR^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксилом, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^DR^E$ або $-CO_2H$;

(xiii) $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_1-C_6$ алкіл, де C_1-C_6 алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^DR^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^DR^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, $-NR^DR^E$, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^DR^E$ або $-CO_2H$;

R^5 вибраний із групи, що складається з гідрогену, $-C(=O)OR^F$, $-NO_2$, $-CN$, $-CF_3$, $-C(=O)NR^GR^H$, $-S(O)_2NR^GR^H$, $-N(R^I)-C(=O)R^J$, $-N(R^I)-S(O)_2R^K$ і SO_3R^K ;

кожен R^6 незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 алканолу, C_1-C_6 алканоліокси, C_1-C_6 алкоксикарбонілу, C_1-C_6 галогеналкілу, C_1-C_6 галогеналкокси і $-NR^AR^B$;

нижній індекс m дорівнює 0, 1, 2 або 3;

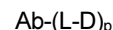
кожен R^A та R^B незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C_1-C_6 алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами;

R^C вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C_1-C_{10} алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен R^D , R^E , R^G та R^H незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_3-C_8 циклоалкілу, C_3-C_8 циклоалкіл(C_1-C_6 алкіл)-, арилу та арил(C_1-C_6 алкіл)-; або R^D та R^E або R^G та R^H разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами;

R^F вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_3-C_8 циклоалкілу, арилу, арил(C_1-C_6 алкіл)- і C_1-C_6 алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C_1-C_6 алканоліокси, C_1-C_6 алкокси та C_3-C_8 циклоалкілу;

кожен R^1 та R^4 необов'язково заміщений солубілізуючою групою (S_b) вибраною з групи, що складається з фосфорилу, сульфурілу, нітро, C_5-C_9 моносахариду, $C_{10}-C_{18}$ дисахариду та $C_{15}-C_{27}$ трисахариду; і кожен R^I , R^J і R^K незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і C_1-C_6 алкілу.

8. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або ϵ -аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

L має формулу $-M(A)_a(W)_w(Y)_y(X)_x-$, де:

нижній індекс a дорівнює 0 або 1;

нижній індекс y дорівнює 0 або 1;

нижній індекс w дорівнює 0 або 1;

нижній індекс x дорівнює 0 або 1;

M являє собою сукцинімід, гідролізований сукцинімід, амід, метилкетон або триазол;

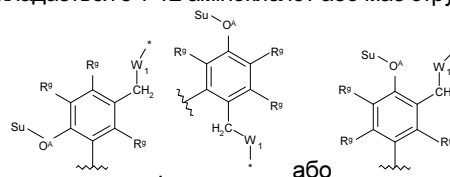
A являє собою C_{2-20} алкілен необов'язково заміщений 1-4 R^{a1} ; або 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-4 R^{b1} ;

кожен R^{a1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} галогеналкокси, галогену, $-OH$, $=O$, $-NR^{d1}R^{e1}$, $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$ і $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$;

кожен R^{b1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} галогеналкокси, галогену, $-OH$, $-NR^{d1}R^{e1}$, $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$ і $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$;

кожен R^{d1} і R^{e1} незалежно являє собою гідроген або C_{1-3} алкіл;

W складається з 1-12 амінокислот або має структуру:



де Su являє собою цукровий фрагмент;

$-O^A-$ представляє атом оксигену або глікозидний зв'язок;

кожен R^9 незалежно являє собою гідроген, галоген, C_1-C_6 алкокси, $-N(C_1-C_6 \text{ алкіл})_2$, $-NHC(=O)(C_1-C_6 \text{ алкіл})$, $-CN$, $-CF_3$, ацил, карбоксамід, C_1-C_6 алкіл або $-NO_2$; W^1 відсутній, являє собою $*C(=O)-O-$ або $*O-C(=O)-$;

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до A або M;

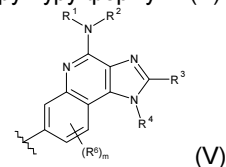
\* представляє ковалентне приєднання до X, Y або D;

Y являє собою самознищуваний фрагмент, несамознищуваний фрагмент, що вивільняється, або нерозщеплюваний фрагмент;

X являє собою  $C_1-C_6$  алкілен або 3-6-членний гетероалкілен;

L необов'язково заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72;

кожен D має структуру формули (V):



або її фармацевтично прийнятної солі;

де:

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до L;  
R¹ вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканойлу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ алкокситіокарбонілу, C₁-C₆ карбамоїлу, C₁-C₆ амідину, C₁-C₆ сульфону, C₁-C₆ тіону, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканойл, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₁-C₆ алкокситіокарбоніл, C₁-C₆ карбамоїл, C₁-C₆ амідин, C₁-C₆ сульфон, C₁-C₆ тіон, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтіо та -NR^AR^B;

R² вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканойлу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканойл, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтіо та -NR^AR^B, або

R¹ і R², разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R³ вибраний із групи, що складається з гідрогену, -NR^AR^B, -C(=O)NR^AR^B, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканойлу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ алканойлокси, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканойл, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₁-C₆ алканойлокси, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтіо та -NR^AR^B;

R⁴ являє собою (a) -OR^C; (b) -S(=O)₂R^C; (c) -C(=O)NR^DR^E; (d) -C(=O)OR^C; (e) -C(=O)SR^C; (f) -C(=S)R^C; (g) -PO₃R^C; або (h) C₁-C₆ алкіл, необов'язково заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) -OR^C;

(iii) -SR^C;

(iv) -NH-S(O₂)R^C;

(v) -OC(=O)R^C;

(vi) -CO₂H;

(vii) C₁-C₆ алкоксикарбонілом;

(viii) -C(=O)NR^DR^E;

(ix) -NR^DR^E;

(x) -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺;

(xi) -(феніл)C₁-C₆ алкілом, де C₁-C₆ алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^DR^E, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксилом, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^DR^E або -CO₂H;

(xiii) -(5-10-членний гетероарил)C₁-C₆ алкіл, де C₁-C₆ алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^DR^E, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, -NR^DR^E, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^DR^E або -CO₂H;

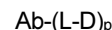
кожен R⁶ незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алканойлу, C₁-C₆ алканойлокси, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ галогеналкілу, C₁-C₆ галогеналкокси і -NR^AR^B;

нижній індекс m дорівнює 0, 1, 2 або 3;

кожен R^A та R^B незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C₁-C₆ алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R^C вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C₁-C₁₀ алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен R^D і R^E незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₃-C₈ циклоалкілу, C₃-C₈ циклоалкіл(C₁-C₆ алкіл)-, арилу та арил(C₁-C₆ алкіл)-; або R^D і R^E разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами; і кожен R¹ та R⁴ необов'язково заміщений солубілізуючою групою (S_b) вибраною з групи, що складається з фосфорилу, сульфурілу, нітро, C₅-C₉ моносахариду, C₁₀-C₁₈ дисахариду та C₁₅-C₂₇ трисахариду.

9. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або ε-аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

L має формулу -M-(A)_a-(W)_w-(Y)_y-(X)_x, де:

нижній індекс a дорівнює 0 або 1;

нижній індекс y дорівнює 0 або 1;

нижній індекс w дорівнює 0 або 1;

нижній індекс x дорівнює 0 або 1;

M являє собою сукцинімід, гідролізований сукцинімід, амід, метилкетон або триазол;

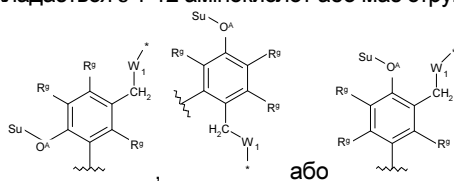
A являє собою C₂₋₂₀ алкілен необов'язково заміщений 1-4 R^{a1}; або 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-4 R^{b1};

кожен R^{a1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C₁₋₆ алкілу, C₁₋₆ галогеналкілу, C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ галогеналкокси, галогену, -OH, =O, -NR^{d1}R^{e1}, -(C₁₋₆ алкілен)-NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)(C₁₋₆ алкіл) і -C(=O)O(C₁₋₆ алкіл);

кожен R^{b1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C₁₋₆ алкілу, C₁₋₆ галогеналкілу, C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ галогеналкокси, галогену, -OH, -NR^{d1}R^{e1}, -(C₁₋₆ алкілен)-NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)(C₁₋₆ алкіл) і -C(=O)O(C₁₋₆ алкіл);

кожен R^{d1} і R^{e1} незалежно являє собою гідроген або C_{1-3} алкіл;

W складається з 1-12 амінокислот або має структуру:



де Su являє собою цукровий фрагмент;

$-O^A$ - представляє атом кисню або глікозидний зв'язок;

кожен R^g незалежно являє собою гідроген, галоген, C_{1-6} алкокси, $-N(C_{1-6} \text{ алкіл})_2$, $-NHC(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$, $-CN$, $-CF_3$, ацил, карбоксамідо, C_{1-6} алкіл або $-NO_2$;

W^1 відсутній, являє собою $*-C(=O)-O-$ або $*-O-C(=O)-$;

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до A або M;

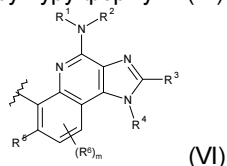
\* представляє ковалентне приєднання до X, Y або D;

Y являє собою самознищуваний фрагмент, несамознищуваний фрагмент, що вивільняється, або нерозщеплюваний фрагмент;

X являє собою  $C_{1-6}$  алкілен або 3-6-членний гетероалкілен;

L необов'язково заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72;

кожен D має структуру формули (VI):



або її фармацевтично прийнятної солі;

де:

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до L;

R^1 вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкенілу, C_{2-6} алкінілу, C_{1-6} алканолу, C_{1-6} алкоксикарбонілу, C_{1-6} алкокситіокарбонілу, C_{1-6} карбамоїлу, C_{1-6} амідину, C_{1-6} сульфону, C_{1-6} тіону, C_{3-6} циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алканол, C_{1-6} алкоксикарбоніл, C_{1-6} алкокситіокарбоніл, C_{1-6} карбамоїл, C_{1-6} амідин, C_{1-6} сульфон, C_{1-6} тіон, C_{3-6} циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C_{3-8} циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} алкілтію та $-NR^AR^B$;

R^2 вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкенілу, C_{2-6} алкінілу, C_{1-6} алканолу, C_{1-6} алкоксикарбонілу, C_{3-6} циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алканол, C_{1-6} алкоксикарбоніл, C_{3-6} циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C_{3-8} циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} алкілтію та $-NR^AR^B$; або

R^1 і R^2 , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, не-

обов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_{1-6} алкілами;

R^3 вибраний із групи, що складається з гідрогену, $-NR^AR^B$, $-C(=O)NR^AR^B$, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкенілу, C_{2-6} алкінілу, C_{1-6} алканолу, C_{1-6} алкоксикарбонілу, C_{1-6} алканоліокси, C_{3-6} циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алканол, C_{1-6} алкоксикарбоніл, C_{1-6} алканоліокси, C_{3-6} циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C_{3-8} циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} алкілтію та $-NR^AR^B$;

R^4 являє собою (a) $-OR^C$; (b) $-S(=O)_2R^C$; (c) $-C(=O)NR^DR^E$; (d) $-C(=O)OR^C$; (e) $-C(=O)SR^C$; (f) $-C(=S)R^C$; (g) $-PO_3R^C$; або (h) C_{1-6} алкіл, необов'язково заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) $-OR^C$;

(iii) $-SR^C$;

(iv) $-NH-S(O)_2R^C$;

(v) $-OC(=O)R^C$;

(vi) $-CO_2H$;

(vii) C_{1-6} алкоксикарбонілом;

(viii) $-C(=O)NR^DR^E$;

(ix) $-NR^DR^E$;

(x) $-[N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^DR^E]^+$;

(xi) $-(\text{феніл})C_{1-6}$ алкілом, де C_{1-6} алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^DR^E$, $-[N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^DR^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксилу, C_{1-6} алкокси, $-C(=O)NR^DR^E$ або $-CO_2H$;

(xiii) $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_{1-6}$ алкіл, де C_{1-6} алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^DR^E$, $-[N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^DR^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, $-NR^DR^E$, C_{1-6} алкокси, $-C(=O)NR^DR^E$ або $-CO_2H$;

R^5 вибраний із групи, що складається з гідрогену, $-C(=O)OR^F$, $-NO_2$, $-CN$, $-CF_3$, $-C(=O)NR^GR^H$, $-S(O)_2NR^GR^H$, $-N(R^I)-C(=O)R^J$, $-N(R^I)-S(O)_2R^K$ і $-SO_3R^K$;

кожен R^{GA} незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкенілу, C_{2-6} алкінілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} алканолу, C_{1-6} алканоліокси, C_{1-6} алкоксикарбонілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} галогеналкокси і $-NR^AR^B$;

нижній індекс q дорівнює 0, 1 або 2;

кожен R^A та R^B незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C_{1-6} алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_{1-6} алкілами;

R^C вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C_{1-10} алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен R^D , R^E , R^G та R^H незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкенілу, C_{3-8} циклоалкілу, C_{3-8} циклоалкіл(C_{1-6} алкіл)-, арилу та арил(C_{1-6} алкіл)-; або R^D та R^E або R^G та R^H разом з атомом нітрогену, до якого во-

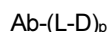
ни приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R^F вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₃-C₈ циклоалкілу, арилу, арил(C₁-C₆ алкіл)- і C₁-C₆ алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C₁-C₆ алканоліокси, C₁-C₆ алкокси та C₃-C₈ циклоалкілу;

кожен R¹ та R⁴ необов'язково заміщений соліобільзуючою групою (S_b) вибраною з групи, що складається з фосфорилу, сульфурілу, нітро, C₅-C₉ моносахариду, C₁₀-C₁₈ дисахариду та C₁₅-C₂₇ трисахариду; і

кожен R¹, R¹ і R^K незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і C₁-C₆ алкілу.

10. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнятна сіль; де:

Ab являє собою антитіло;

кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або ε-аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

L має формулу -M-(A)_a-(W)_w-(Y)_y-(X)_x-, де:

нижній індекс a дорівнює 0 або 1;

нижній індекс y дорівнює 0 або 1;

нижній індекс w дорівнює 0 або 1;

нижній індекс x дорівнює 0 або 1;

M являє собою сукцинімід, гідролізований сукцинімід, амід, метилкетон або триазол;

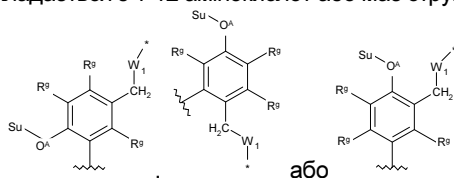
A являє собою C₂₋₂₀ алкілен необов'язково заміщений 1-4 R^{a1}; або 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-4 R^{b1};

кожен R^{a1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C₁₋₆ алкілу, C₁₋₆ галогеналкілу, C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ галогеналкокси, галогену, -OH, =O, -NR^{d1}R^{e1}, -(C₁₋₆ алкілен)-NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)(C₁₋₆ алкіл) і -C(=O)O(C₁₋₆ алкіл);

кожен R^{b1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C₁₋₆ алкілу, C₁₋₆ галогеналкілу, C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ галогеналкокси, галогену, -OH, -NR^{d1}R^{e1}, -(C₁₋₆ алкілен)-NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)(C₁₋₆ алкіл) і -C(=O)O(C₁₋₆ алкіл);

кожен R^{d1} і R^{e1} незалежно являє собою гідроген або C₁₋₃ алкіл;

W складається з 1-12 амінокислот або має структуру:



де Su являє собою цукровий фрагмент;

-OAc- представляє атом оксигену або глікозидний зв'язок;

кожен R⁹ незалежно являє собою гідроген, галоген, C₁-C₆ алкокси, -N(C₁-C₆ алкіл)₂, -NHC(=O)(C₁-C₆ алкіл), -CN, -CF₃, ацил, карбоксамід, C₁-C₆ алкіл або -NO₂;

W¹ відсутній, являє собою *-C(=O)-O- або *-O-C(=O)-;

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до A або M;

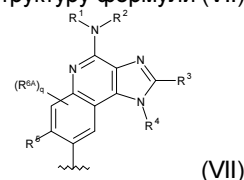
\* представляє ковалентне приєднання до X, Y або D;

Y являє собою самознищуваний фрагмент, несамознищуваний фрагмент, що вивільняється, або нерозщеплюваний фрагмент;

X являє собою C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілен або 3-6-членний гетероалкілен;

L необов'язково заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72;

кожен D має структуру формули (VII):





$R^4$  являє собою (a)  $-OR^C$ ; (b)  $-S(=O)_2R^C$ ; (c)  $-C(=O)NR^D R^E$ ; (d)  $-C(=O)OR^C$ ; (e)  $-C(=O)SR^C$ ; (f)  $-C(=S)R^C$ ; (g)  $-PO_3R^C$ ; або (h)  $C_1-C_6$  алкіл, необов'язково заміщений;

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii)  $-OR^C$ ;

(iii)  $-SR^C$ ;

(iv)  $-NH-S(O_2)R^C$ ;

(v)  $-OC(=O)R^C$ ;

(vi)  $-CO_2H$ ;

(vii)  $C_1-C_6$  алкоксикарбонілом;

(viii)  $-C(=O)NR^D R^E$ ;

(ix)  $-NR^D R^E$ ;

(x)  $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ ;

(xi)  $-(\text{феніл})C_1-C_6$  алкілом, де  $C_1-C_6$  алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом,  $-NR^D R^E$ ,  $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$  або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксилом,  $C_1-C_6$  алкокси,  $-C(=O)NR^D R^E$  або  $-CO_2H$ ;

(xiii)  $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_1-C_6$  алкіл, де  $C_1-C_6$  алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом,  $-NR^D R^E$ ,  $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$  або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном,  $-NR^D R^E$ ,  $C_1-C_6$  алкокси,  $-C(=O)NR^D R^E$  або  $-CO_2H$ ;

$R^5$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $-C(=O)OR^F$ ,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-C(=O)NR^G R^H$ ,  $-S(O_2)NR^G R^H$ ,  $-N(R^I)-C(=O)R^J$ ,  $-N(R^I)-S(O_2)R^K$  і  $-SO_3R^K$ ;

кожен  $R^{6A}$  незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано,  $C_1-C_6$  алкілу,  $C_2-C_6$  алкенілу,  $C_2-C_6$  алкінілу,  $C_1-C_6$  алкокси,  $C_1-C_6$  алканолілу,  $C_1-C_6$  алканолілокси,  $C_1-C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_1-C_6$  галогеналкілу,  $C_1-C_6$  галогеналкокси і  $-NR^A R^B$ ;

нижній індекс q дорівнює 0, 1 або 2;

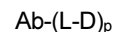
кожен  $R^A$  та  $R^B$  незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та  $C_1-C_6$  алкілу; або  $R^A$  та  $R^B$  разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  $C_1-C_6$  алкілами;

$R^C$  вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та  $C_1-C_{10}$  алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен  $R^D$ ,  $R^E$ ,  $R^G$  та  $R^H$  незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $C_1-C_6$  алкілу,  $C_2-C_6$  алкенілу,  $C_3-C_8$  циклоалкілу,  $C_3-C_8$  циклоалкіл( $C_1-C_6$  алкіл)-, арилу та арил( $C_1-C_6$  алкіл)-; або  $R^D$  та  $R^E$  або  $R^G$  та  $R^H$  разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  $C_1-C_6$  алкілами;

$R^F$  вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу,  $C_2-C_6$  алкенілу,  $C_2-C_6$  алкінілу,  $C_3-C_8$  циклоалкілу, арилу, арил( $C_1-C_6$  алкіл)- і  $C_1-C_6$  алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену,  $C_1-C_6$  алканолілокси,  $C_1-C_6$  алкокси та  $C_3-C_8$  циклоалкілу; і

кожен  $R^1$  та  $R^4$  необов'язково заміщений солубілізуючою групою ( $S_b$ ) вибраною з групи, що складається з фосфорилу, сульфурілу, нітро,  $C_5-C_9$  моносахариду,  $C_{10}-C_{18}$  дисахариду та  $C_{15}-C_{27}$  трисахариду; і кожен  $R^I$ ,  $R^J$  і  $R^K$  незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і  $C_1-C_6$  алкілу.

11. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або  $\epsilon$ -аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

L має формулу  $-M-(A)_a-(W)_w-(Y)_y-(X)_x-$ , де:

нижній індекс a дорівнює 0 або 1;

нижній індекс y дорівнює 0 або 1;

нижній індекс w дорівнює 0 або 1;

нижній індекс x дорівнює 0 або 1;

M являє собою сукцинімід, гідролізований сукцинімід, амід, метилкетон або триазол;

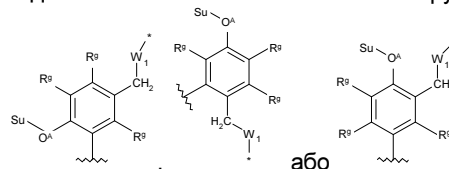
A являє собою  $C_{2-20}$  алкілен необов'язково заміщений 1-4  $R^{a1}$ ; або 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-4  $R^{b1}$ ;

кожен  $R^{a1}$  незалежно вибраний із групи, яка складається з:  $C_{1-6}$  алкілу,  $C_{1-6}$  галогеналкілу,  $C_{1-6}$  алкокси,  $C_{1-6}$  галогеналкокси, галогену,  $-OH$ ,  $=O$ ,  $-NR^{d1} R^{e1}$ ,  $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1} R^{e1}$ ,  $-C(=O)NR^{d1} R^{e1}$ ,  $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$  і  $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$ ;

кожен  $R^{b1}$  незалежно вибраний із групи, яка складається з:  $C_{1-6}$  алкілу,  $C_{1-6}$  галогеналкілу,  $C_{1-6}$  алкокси,  $C_{1-6}$  галогеналкокси, галогену,  $-OH$ ,  $-NR^{d1} R^{e1}$ ,  $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1} R^{e1}$ ,  $-C(=O)NR^{d1} R^{e1}$ ,  $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$  і  $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$ ;

кожен  $R^{d1}$  і  $R^{e1}$  незалежно являє собою гідроген або  $C_{1-3}$  алкіл;

W складається з 1-12 амінокислот або має структуру:



де Su являє собою цукровий фрагмент;

$-O^A$  представляє атом оксигену або глікозидний зв'язок;

кожен  $R^a$  незалежно являє собою гідроген, галоген,  $C_1-C_6$  алкокси,  $-N(C_1-C_6 \text{ алкіл})_2$ ,  $-NHC(=O)(C_1-C_6 \text{ алкіл})$ ,  $-CN$ ,  $-CF_3$ , ацил, карбоксамід,  $C_1-C_6$  алкіл або  $-NO_2$ ;

$W^1$  відсутній, являє собою  $*-C(=O)-O-$  або  $*-O-C(=O)-$ ;

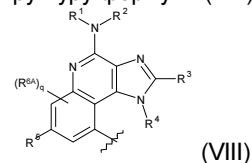
~~~~~ представляє ковалентне приєднання до A або M;

* представляє ковалентне приєднання до X, Y або D; Y являє собою самознищуваний фрагмент, несамознищуваний фрагмент, що вивільняється, або нерозщеплюваний фрагмент;

X являє собою C_1-C_6 алкілен або 3-6-членний гетероалкілен;

L необов'язково заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72;

кожен D має структуру формули (VIII):



де:

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до L;  
 $R^1$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $C_1$ - $C_6$  алкілу,  $C_2$ - $C_6$  алкенілу,  $C_2$ - $C_6$  алкінілу,  $C_1$ - $C_6$  алканойлу,  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_1$ - $C_6$  алкокситіокарбонілу,  $C_1$ - $C_6$  карбамойлу,  $C_1$ - $C_6$  амідину,  $C_1$ - $C_6$  сульфону,  $C_1$ - $C_6$  тіону,  $C_3$ - $C_6$  циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен  $C_1$ - $C_6$  алкіл,  $C_2$ - $C_6$  алкеніл,  $C_2$ - $C_6$  алкініл,  $C_1$ - $C_6$  алканойл,  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбоніл,  $C_1$ - $C_6$  алкокситіокарбоніл,  $C_1$ - $C_6$  карбамойл,  $C_1$ - $C_6$  амідин,  $C_1$ - $C_6$  сульфон,  $C_1$ - $C_6$  тіон,  $C_3$ - $C_6$  циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу,  $C_3$ - $C_8$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу,  $C_1$ - $C_6$  алкокси,  $C_1$ - $C_6$  алкілтію та  $-NR^A R^B$ ;

$R^2$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $C_1$ - $C_6$  алкілу,  $C_2$ - $C_6$  алкенілу,  $C_2$ - $C_6$  алкінілу,  $C_1$ - $C_6$  алканойлу,  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_3$ - $C_6$  циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен  $C_1$ - $C_6$  алкіл,  $C_2$ - $C_6$  алкеніл,  $C_2$ - $C_6$  алкініл,  $C_1$ - $C_6$  алканойл,  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбоніл,  $C_3$ - $C_6$  циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу,  $C_3$ - $C_8$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу,  $C_1$ - $C_6$  алкокси,  $C_1$ - $C_6$  алкілтію та  $-NR^A R^B$ ; або

$R^1$  і  $R^2$ , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  $C_1$ - $C_6$  алкілами;

$R^3$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $-NR^A R^B$ ,  $-C(=O)NR^A R^B$ ,  $C_1$ - $C_6$  алкілу,  $C_2$ - $C_6$  алкенілу,  $C_2$ - $C_6$  алкінілу,  $C_1$ - $C_6$  алканойлу,  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_1$ - $C_6$  алканойлокси,  $C_3$ - $C_6$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен  $C_1$ - $C_6$  алкіл,  $C_2$ - $C_6$  алкеніл,  $C_2$ - $C_6$  алкініл,  $C_1$ - $C_6$  алканойл,  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбоніл,  $C_1$ - $C_6$  алканойлокси,  $C_3$ - $C_6$  циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу,  $C_3$ - $C_8$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу,  $C_1$ - $C_6$  алкокси,  $C_1$ - $C_6$  алкілтію та  $-NR^A R^B$ ;

$R^4$  являє собою (a)  $-OR^C$ ; (b)  $-S(=O)_2R^C$ ; (c)  $-C(=O)NR^D R^E$ ; (d)  $-C(=O)OR^C$ ; (e)  $-C(=O)SR^C$ ; (f)  $-C(=S)R^C$ ; (g)  $-PO_3R^C$ ; або (h)  $C_1$ - $C_6$  алкіл, необов'язково заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii)  $-OR^C$ ;

(iii)  $-SR^C$ ;

(iv)  $-NH-S(O)_2R^C$ ;

(v)  $-OC(=O)R^C$ ;

(vi)  $-CO_2H$ ;

(vii)  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбонілом;

(viii)  $-C(=O)NR^D R^E$ ;

(ix)  $-NR^D R^E$ ;

(x)  $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ ;

(xi)  $-(\text{феніл})C_1-C_6$  алкілом, де  $C_1$ - $C_6$  алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом,  $-NR^D R^E$ ,  $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$  або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксилом,  $C_1$ - $C_6$  алкокси,  $-C(=O)NR^D R^E$  або  $-CO_2H$ ;

(xiii)  $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_1-C_6$  алкіл, де  $C_1$ - $C_6$  алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом,  $-NR^D R^E$ ,  $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$  або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном,  $-NR^D R^E$ ,  $C_1$ - $C_6$  алкокси,  $-C(=O)NR^D R^E$  або  $-CO_2H$ ;

$R^5$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $-C(=O)OR^F$ ,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-CF_3$ ,  $-C(=O)NR^G R^H$ ,  $-S(O)_2NR^G R^H$ ,  $-N(R^I)-C(=O)R^J$ ,  $-N(R^I)-S(O)_2R^K$  і  $-SO_3R^K$ ;

кожен  $R^{6A}$  незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано,  $C_1$ - $C_6$  алкілу,  $C_2$ - $C_6$  алкенілу,  $C_2$ - $C_6$  алкінілу,  $C_1$ - $C_6$  алкокси,  $C_1$ - $C_6$  алканойлу,  $C_1$ - $C_6$  алканойлокси,  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_1$ - $C_6$  галогеналкілу,  $C_1$ - $C_6$  галогеналкокси і  $-NR^A R^B$ ;

нижній індекс q дорівнює 0, 1 або 2;

кожен  $R^A$  та  $R^B$  незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та  $C_1$ - $C_6$  алкілу; або  $R^A$  та  $R^B$  разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  $C_1$ - $C_6$  алкілами;

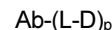
$R^C$  вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та  $C_1$ - $C_{10}$  алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен  $R^D$ ,  $R^E$ ,  $R^G$  та  $R^H$  незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $C_1$ - $C_6$  алкілу,  $C_2$ - $C_6$  алкенілу,  $C_3$ - $C_8$  циклоалкілу,  $C_3$ - $C_8$  циклоалкіл( $C_1$ - $C_6$  алкіл)-, арилу та арил( $C_1$ - $C_6$  алкіл)-; або  $R^D$  та  $R^E$  або  $R^G$  та  $R^H$  разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  $C_1$ - $C_6$  алкілами;

$R^F$  вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу,  $C_2$ - $C_6$  алкенілу,  $C_2$ - $C_6$  алкінілу,  $C_3$ - $C_8$  циклоалкілу, арилу, арил( $C_1$ - $C_6$  алкіл)- і  $C_1$ - $C_6$  алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену,  $C_1$ - $C_6$  алканойлокси,  $C_1$ - $C_6$  алкокси та  $C_3$ - $C_8$  циклоалкілу;

кожен  $R^1$  та  $R^4$  необов'язково заміщений солубілізуючою групою ( $S_b$ ) вибраною з групи, що складається з фосфорилу, сульфурілу, нітро,  $C_5$ - $C_9$  моносахариду,  $C_{10}$ - $C_{18}$  дисахариду та  $C_{15}$ - $C_{27}$  трисахариду; і

кожен  $R^I$ ,  $R^J$  і  $R^K$  незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і  $C_1$ - $C_6$  алкілу.

12. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

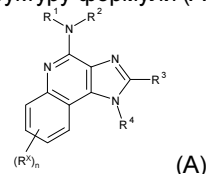
кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або є-аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

кожен D має структуру формули (A):



(A)

або її фармацевтично прийнятої солі;

де:

$R^1$  (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $C_1-C_6$  алкілу,  $C_2-C_6$  алкенілу,  $C_2-C_6$  алкінілу,  $C_1-C_6$  алканойлу,  $C_1-C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_3-C_6$  циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен  $C_1-C_6$  алкіл,  $C_2-C_6$  алкеніл,  $C_2-C_6$  алкініл,  $C_1-C_6$  алканойл,  $C_1-C_6$  алкоксикарбоніл,  $C_3-C_6$  циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу,  $C_3-C_8$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу,  $C_1-C_6$  алкокси,  $C_1-C_6$  алкілтію та  $-NR^A R^B$ ;

$R^2$  (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $C_1-C_6$  алкілу,  $C_2-C_6$  алкенілу,  $C_2-C_6$  алкінілу,  $C_1-C_6$  алканойлу,  $C_1-C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_3-C_6$  циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен  $C_1-C_6$  алкіл,  $C_2-C_6$  алкеніл,  $C_2-C_6$  алкініл,  $C_1-C_6$  алканойл,  $C_1-C_6$  алкоксикарбоніл,  $C_3-C_6$  циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу,  $C_3-C_8$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу,  $C_1-C_6$  алкокси,  $C_1-C_6$  алкілтію та  $-NR^A R^B$ ; або

$R^1$  і  $R^2$ , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  $C_1-C_6$  алкілами;

$R^3$  (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $-NR^A R^B$ ,  $-C(=O)NR^A R^B$ ,  $C_1-C_6$  алкілу,  $C_2-C_6$  алкенілу,  $C_2-C_6$  алкінілу,  $C_1-C_6$  алканойлу,  $C_1-C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_1-C_6$  алканойлокси,  $C_3-C_6$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен  $C_1-C_6$  алкіл,  $C_2-C_6$  алкеніл,  $C_2-C_6$  алкініл,  $C_1-C_6$  алканойл,  $C_1-C_6$  алкоксикарбоніл,  $C_1-C_6$  алканойлокси,  $C_3-C_6$  циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу,  $C_3-C_8$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу,  $C_1-C_6$  алкокси,  $C_1-C_6$  алкілтію та  $-NR^A R^B$ ;

$R^4$  являє собою (a) точку ковалентного приєднання L; (b)  $-OR^C$ ; або (c)  $C_1-C_6$  алкіл, необов'язково заміщений;

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii)  $-OR^C$ ;

(iii)  $-SR^C$ ;

(iv)  $-NH-S(O_2)R^C$ ;

(v)  $-OC(=O)R^C$ ;

(vi)  $-CO_2H$ ;

(vii)  $C_1-C_6$  алкоксикарбонілом;

(viii)  $-C(=O)NR^D R^E$ ;

(ix)  $-NR^D R^E$ ;

(x)  $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ ;

(xi)  $-(\text{феніл})C_1-C_6$  алкілом, де  $C_1-C_6$  алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом,  $-NR^D R^E$ ,  $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$  або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксиллом,  $C_1-C_6$  алкокси,  $-C(=O)NR^D R^E$  або  $-CO_2H$ ;

(xiii)  $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_1-C_6$  алкіл, де  $C_1-C_6$  алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом,  $-NR^D R^E$ ,  $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$  або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном,  $-NR^D R^E$ ,  $C_1-C_6$  алкокси,  $-C(=O)NR^D R^E$ ,  $-SR^C$ ,  $(C_1-C_6)$  алкоксикарбонілом або  $-CO_2H$ ;

при цьому коли  $R^4$  являє собою (c),  $C_1-C_6$  алкіл або його замісник можуть бути додатково заміщені точкою ковалентного приєднання до L;

кожен  $R^X$  (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $-C(=O)OR^F$ ,  $-C(=O)NR^G R^H$ ,  $-S(O_2)NR^G R^H$ ,  $-N(R^I)-C(=O)R^J$ ,  $-N(R^I)-S(O_2)R^K$ , галогену, гідроксилу, нітро, ціано,  $C_1-C_6$  алкілу,  $C_2-C_6$  алкенілу,  $C_2-C_6$  алкінілу,  $C_1-C_6$  алкокси,  $C_1-C_6$  алканойлу,  $C_1-C_6$  алканойлокси,  $C_1-C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_1-C_6$  галогеналкілу,  $C_1-C_6$  галогеналкокси та  $-NR^A R^B$ ; при цьому не більше одного  $R^X$  являє собою точку ковалентного приєднання до L;

нижній індекс n дорівнює 0, 1, 2, 3 або 4;

кожен  $R^A$  та  $R^B$  (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L, (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та  $C_1-C_6$  алкілу; або  $R^A$  та  $R^B$  разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  $C_1-C_6$  алкілами; при цьому тільки один з  $R^A$  та  $R^B$  являє собою точку ковалентного приєднання до L;

$R^C$  (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та  $C_1-C_{10}$  алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

кожен  $R^D$ ,  $R^E$ ,  $R^G$  та  $R^H$  (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $C_1-C_6$  алкілу,  $C_2-C_6$  алкенілу,  $C_3-C_8$  циклоалкілу,  $C_3-C_8$  циклоалкіл( $C_1-C_6$  алкіл)-, арилу та арил( $C_1-C_6$  алкіл)-; або  $R^D$  та  $R^E$  або  $R^G$  та  $R^H$  разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  $C_1-C_6$  алкілами; при цьому тільки один із  $R^D$ ,  $R^E$ ,  $R^G$  та  $R^H$  являє собою точку ковалентного приєднання до L;

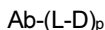
$R^F$  (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу,  $C_2-C_6$  алкенілу,  $C_2-C_6$  алкінілу,  $C_3-C_8$  циклоалкілу, арилу, арил( $C_1-C_6$  алкіл)- і  $C_1-C_6$  алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену,  $C_1-C_6$  алканойлокси,  $C_1-C_6$  алкокси та  $C_3-C_8$  циклоалкілу;

кожен  $R^I$ ,  $R^J$  та  $R^K$  (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та  $C_1-C_6$  алкілу; при цьому тільки один з  $R^I$ ,  $R^J$  та  $R^K$  являє собою точку ковалентного приєднання до L;

при цьому тільки один із  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^X$ ,  $R^A$ ,  $R^B$ ,  $R^C$ ,  $R^D$ ,  $R^E$ ,  $R^F$ ,  $R^G$ ,  $R^H$ ,  $R^I$ ,  $R^J$  та  $R^K$  являє собою точку ковалентного приєднання до L; і

при цьому кожен D має лише одну точку ковалентного приєднання до L.

13. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

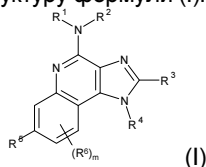
кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або ε-аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

кожен D має структуру формули (I):



(I)

або її фармацевтично прийнятої солі;

де:

R<sup>1</sup> (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкінілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканойлу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбонілу, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкініл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканойл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбоніл, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілтію та -NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>;

R<sup>2</sup> (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкінілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканойлу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбонілу, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкініл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканойл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбоніл, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілтію та -NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>; або

R<sup>1</sup> і R<sup>2</sup>, разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілами;

R<sup>3</sup> (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, -NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>, -C(=O)NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкінілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканойлу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбонілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканойлокси, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкеніл, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкініл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканойл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканойлокси, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілтію та -NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>;

R<sup>4</sup> являє собою (a) точку ковалентного приєднання до L; (b) -OR<sup>C</sup>; або (c) C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, необов'язково заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) -OR<sup>C</sup>;

(iii) -SR<sup>C</sup>;

(iv) -NH-S(O<sub>2</sub>)R<sup>C</sup>;

(v) -OC(=O)R<sup>C</sup>;

(vi) -CO<sub>2</sub>H;

(vii) C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбонілом;

(viii) -C(=O)NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>;

(ix) -NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>;

(x) -[N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)R<sup>D</sup>R<sup>E</sup>]<sup>+</sup>;

(xi) -(феніл)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілом, де C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>, -[N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)R<sup>D</sup>R<sup>E</sup>]<sup>+</sup> або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщеним галогеном, гідроксилом, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, -C(=O)NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup> або -CO<sub>2</sub>H;

(xiii) -(5-10-членний гетероарил)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, де C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>, -[N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)R<sup>D</sup>R<sup>E</sup>]<sup>+</sup> або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, -NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, -C(=O)NR<sup>D</sup>R<sup>E</sup>, -SR<sup>C</sup>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкоксикарбонілом або -CO<sub>2</sub>H;

при цьому коли R<sup>4</sup> являє собою (c), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл або його замісник можуть бути додатково заміщені точкою ковалентного приєднання до L;

R<sup>5</sup> (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, -C(=O)OR<sup>F</sup>, -C(=O)NR<sup>G</sup>R<sup>H</sup>, -S(O<sub>2</sub>)NR<sup>G</sup>R<sup>H</sup>, -N(R<sup>I</sup>)-C(=O)R<sup>J</sup> і -N(R<sup>I</sup>)-S(O<sub>2</sub>)R<sup>K</sup>;

кожен R<sup>6</sup> (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкінілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканойлу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканойлокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкоксикарбонілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкілу, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкокси та -NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>; при цьому не більше одного R<sup>6</sup> являє собою точку ковалентного приєднання до L; нижній індекс m дорівнює 0, 1, 2 або 3;

кожен R<sup>A</sup> та R<sup>B</sup> (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L, (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу; або R<sup>A</sup> та R<sup>B</sup> разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілами; при цьому тільки один з R<sup>A</sup> та R<sup>B</sup> являє собою точку ковалентного приєднання до L;

R<sup>C</sup> (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

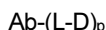
кожен R<sup>D</sup>, R<sup>E</sup>, R<sup>G</sup> та R<sup>H</sup> (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенілу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкілу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкіл(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)-, арилу та арил(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)-; або R<sup>D</sup> та R<sup>E</sup> або R<sup>G</sup> та R<sup>H</sup> разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілами; при цьому тільки один із R<sup>D</sup>, R<sup>E</sup>, R<sup>G</sup> та R<sup>H</sup> являє собою точку ковалентного приєднання до L;

R<sup>F</sup> (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенілу, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкінілу, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкілу, арилу, арил(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкіл)- і



C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алканоліокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси та C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкілу; кожен R<sup>1</sup>, R<sup>J</sup> та R<sup>K</sup> (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілу; при цьому тільки один з R<sup>1</sup>, R<sup>J</sup> та R<sup>K</sup> являє собою точку ковалентного приєднання до L; при цьому тільки один із R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>A</sup>, R<sup>B</sup>, R<sup>C</sup>, R<sup>D</sup>, R<sup>E</sup>, R<sup>F</sup>, R<sup>G</sup>, R<sup>H</sup>, R<sup>I</sup>, R<sup>J</sup> і R<sup>K</sup> являє собою точку ковалентного приєднання до L; і при цьому кожен D має лише одну точку ковалентного приєднання до L.

14. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

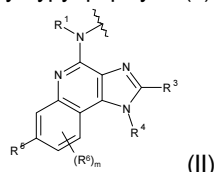
Ab являє собою антитіло;

де кожен D кон'югований з лінкером (L);

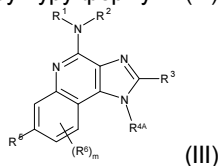
де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або ε-аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

кожен D має структуру формули (II):



нижній індекс  $p$  являє собою ціле число від 1 до 16; кожен  $D$  має структуру формули (III):



або її фармацевтично прийнятій солі;

де:

$R^1$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $C_1$ - $C_6$  алкілу,  $C_2$ - $C_6$  алкенілу,  $C_2$ - $C_6$  алкінілу,  $C_1$ - $C_6$  алканолу,  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_3$ - $C_6$  циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен  $C_1$ - $C_6$  алкіл,  $C_2$ - $C_6$  алкеніл,  $C_2$ - $C_6$  алкініл,  $C_1$ - $C_6$  алканол,  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбоніл,  $C_3$ - $C_6$  циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу,  $C_3$ - $C_8$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу,  $C_1$ - $C_6$  алкокси,  $C_1$ - $C_6$  алкілію та  $-NR^A R^B$ ;  $R^2$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $C_1$ - $C_6$  алкілу,  $C_2$ - $C_6$  алкенілу,  $C_2$ - $C_6$  алкінілу,  $C_1$ - $C_6$  алканолу,  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_3$ - $C_6$  циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен  $C_1$ - $C_6$  алкіл,  $C_2$ - $C_6$  алкеніл,  $C_2$ - $C_6$  алкініл,  $C_1$ - $C_6$  алканол,  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбоніл,  $C_3$ - $C_6$  циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу,  $C_3$ - $C_8$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу,  $C_1$ - $C_6$  алкокси,  $C_1$ - $C_6$  алкілію та  $-NR^A R^B$ ; або

$R^1$  і  $R^2$ , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  $C_1$ - $C_6$  алкілами;

$R^3$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $-NR^A R^B$ ,  $-C(=O)NR^A R^B$ ,  $C_1$ - $C_6$  алкілу,  $C_2$ - $C_6$  алкенілу,  $C_2$ - $C_6$  алкінілу,  $C_1$ - $C_6$  алканолу,  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_1$ - $C_6$  алканолікси,  $C_3$ - $C_6$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен  $C_1$ - $C_6$  алкіл,  $C_2$ - $C_6$  алкеніл,  $C_2$ - $C_6$  алкініл,  $C_1$ - $C_6$  алканол,  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбоніл,  $C_1$ - $C_6$  алканолікси,  $C_3$ - $C_6$  циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу,  $C_3$ - $C_8$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу,  $C_1$ - $C_6$  алкокси,  $C_1$ - $C_6$  алкілію та  $-NR^A R^B$ ;

$R^{4A}$  являє собою (a) точку ковалентного приєднання до L; або (b)  $C_1$ - $C_6$  алкіл, заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii)  $-OR^C$ ;

(iii)  $-SR^C$ ;

(iv)  $-NH-S(O)_2 R^C$ ;

(v)  $-OC(=O)R^C$ ;

(vi)  $-CO_2H$ ;

(vii)  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбонілом;

(viii)  $-C(=O)NR^D R^E$ ;

(ix)  $-NR^D R^E$ ;

(x)  $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ ;

(xi)  $-(\text{феніл})C_1-C_6 \text{ алкілом}$ , де  $C_1$ - $C_6$  алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом,  $-NR^D R^E$ ,  $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$  або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщеним галогеном, гідроксилом,  $C_1$ - $C_6$  алкокси,  $-C(=O)NR^D R^E$  або  $-CO_2H$ ;

(xiii)  $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_1-C_6 \text{ алкіл}$ , де  $C_1$ - $C_6$  алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом,  $-NR^D R^E$ ,  $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$  або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном,  $-NR^D R^E$ ,  $C_1$ - $C_6$  алкокси,  $-C(=O)NR^D R^E$  або  $-CO_2H$ ;

при цьому коли  $R^{4A}$  являє собою (b),  $C_1$ - $C_6$  алкіл або його замісник додатково заміщені точкою ковалентного приєднання до L;

$R^5$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $-C(=O)OR^F$ ,  $-C(=O)NR^G R^H$ ,  $-S(O)_2 NR^G R^H$ ,  $-N(R^I)-C(=O)R^J$  і  $-N(R^I)-S(O)_2 R^K$ ;

кожен  $R^6$  незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано,  $C_1$ - $C_6$  алкілу,  $C_2$ - $C_6$  алкенілу,  $C_2$ - $C_6$  алкінілу,  $C_1$ - $C_6$  алкокси,  $C_1$ - $C_6$  алканолу,  $C_1$ - $C_6$  алканолікси,  $C_1$ - $C_6$  алкоксикарбонілу,  $C_1$ - $C_6$  галогеналкілу,  $C_1$ - $C_6$  галогеналкокси і  $-NR^A R^B$ ; нижній індекс  $m$  дорівнює 0, 1, 2 або 3;

кожен  $R^A$  та  $R^B$  незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та  $C_1$ - $C_6$  алкілу; або  $R^A$  та  $R^B$  разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  $C_1$ - $C_6$  алкілами;

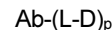
$R^C$  вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та  $C_1$ - $C_{10}$  алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

кожен  $R^D$ ,  $R^E$ ,  $R^G$  та  $R^H$  незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $C_1$ - $C_6$  алкілу,  $C_2$ - $C_6$  алкенілу,  $C_3$ - $C_8$  циклоалкілу,  $C_3$ - $C_8$  циклоалкіл( $C_1$ - $C_6$  алкіл)-, арилу та арил( $C_1$ - $C_6$  алкіл)-; або  $R^D$  та  $R^E$  або  $R^G$  та  $R^H$  разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  $C_1$ - $C_6$  алкілами;

$R^F$  вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу,  $C_2$ - $C_6$  алкенілу,  $C_2$ - $C_6$  алкінілу,  $C_3$ - $C_8$  циклоалкілу, арилу, арил( $C_1$ - $C_6$  алкіл)- і  $C_1$ - $C_6$  алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену,  $C_1$ - $C_6$  алканолікси,  $C_1$ - $C_6$  алкокси та  $C_3$ - $C_8$  циклоалкілу; і

кожен  $R^I$ ,  $R^J$  і  $R^K$  незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і  $C_1$ - $C_6$  алкілу.

16. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнята сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

де кожен  $D$  кон'югований з лінкером (L);

де кожен  $L$  ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або  $\epsilon$ -аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс  $p$  являє собою ціле число від 1 до 16;

$L$  має формулу  $-M-(A)_a-(W)_w-(Y)_y-(X)_x$ , де:

нижній індекс  $a$  дорівнює 0 або 1;

нижній індекс  $y$  дорівнює 0 або 1;

нижній індекс  $w$  дорівнює 0 або 1;

нижній індекс  $x$  дорівнює 0 або 1;

$M$  являє собою сукцинімід, гідролізований сукцинімід, амід або триазол;

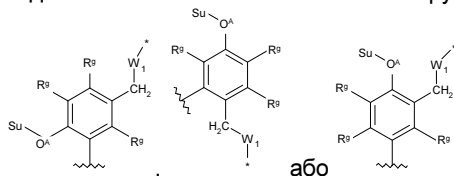
А являє собою  $C_{2-20}$  алкілен необов'язково заміщений 1-3  $R^{a1}$ ; або 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-3  $R^{b1}$ ;

кожен  $R^{a1}$  незалежно вибраний із групи, яка складається з:  $C_{1-6}$  алкілу,  $C_{1-6}$  галогеналкілу,  $C_{1-6}$  алкокси,  $C_{1-6}$  галогеналкокси, галогену,  $-OH$ ,  $=O$ ,  $-NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$  і  $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$ ;

кожен  $R^{b1}$  незалежно вибраний із групи, яка складається з:  $C_{1-6}$  алкілу,  $C_{1-6}$  галогеналкілу,  $C_{1-6}$  алкокси,  $C_{1-6}$  галогеналкокси, галогену,  $-OH$ ,  $-NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$  і  $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$ ;

кожен  $R^{d1}$  і  $R^{e1}$  незалежно являє собою гідроген або  $C_{1-3}$  алкіл;

W складається з 1-12 амінокислот або має структуру:



де Su являє собою цукровий фрагмент;

$-O^A$  представляє атом оксигену або глікозидний зв'язок;

кожен  $R^9$  незалежно являє собою гідроген, галоген,  $C_{1-6}$  алкокси,  $-N(C_{1-6} \text{ алкіл})_2$ ,  $-NHC(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$ ,  $-CN$ ,  $-CF_3$ , ацил, карбоксамідо,  $C_{1-6}$  алкіл або  $-NO_2$ ;  $W^1$  відсутній, являє собою  $*C(=O)-O-$  або  $*-O-C(=O)-$ ;

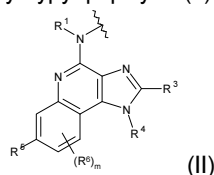
~~~~~ представляє ковалентне приєднання до А або М;

* представляє ковалентне приєднання до Х, Y або D; Y являє собою самознищуваний фрагмент, несамознищуваний фрагмент, що вивільняється, або нерозщеплюваний фрагмент;

X являє собою C_{1-6} алкілен або 3-6-членний гетероалкілен;

L необов'язково заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72;

кожен D має структуру формули (II):



або її фармацевтично прийнятої солі;

де:

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до L;

$R^1$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $C_{1-6}$  алкілу,  $C_{2-6}$  алкенілу,  $C_{2-6}$  алкінілу,  $C_{1-6}$  алканолу,  $C_{1-6}$  алкоксикарбонілу,  $C_{3-6}$  циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен  $C_{1-6}$  алкіл,  $C_{2-6}$  алкеніл,  $C_{2-6}$  алкініл,  $C_{1-6}$  алканол,  $C_{1-6}$  алкоксикарбоніл,  $C_{3-6}$  циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу,  $C_{3-8}$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу,  $C_{1-6}$  алкокси,  $C_{1-6}$  алкілію та  $-NR^AR^B$ ;

$R^3$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $-NR^AR^B$ ,  $-C(=O)NR^AR^B$ ,  $C_{1-6}$  алкілу,  $C_{2-6}$  алкенілу,  $C_{2-6}$  алкінілу,  $C_{1-6}$  алканолу,  $C_{1-6}$  алкоксикарбонілу,  $C_{1-6}$  алканоліокси,  $C_{3-6}$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гете-

роциклу; де кожен  $C_{1-6}$  алкіл,  $C_{2-6}$  алкеніл,  $C_{2-6}$  алкініл,  $C_{1-6}$  алканол,  $C_{1-6}$  алкоксикарбоніл,  $C_{1-6}$  алканоліокси,  $C_{3-6}$  циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу,  $C_{3-8}$  циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу,  $C_{1-6}$  алкокси,  $C_{1-6}$  алкілію та  $-NR^AR^B$ ;

$R^4$  являє собою (a)  $-OR^C$  або (b)  $C_{1-6}$  алкіл, необов'язково заміщений;

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii)  $-OR^C$ ;

(iii)  $-SR^C$ ;

(iv)  $-NH-S(O_2)R^C$ ;

(v)  $-OC(=O)R^C$ ;

(vi)  $-CO_2H$ ;

(vii)  $C_{1-6}$  алкоксикарбонілом;

(viii)  $-C(=O)NR^DR^E$ ;

(ix)  $-NR^DR^E$ ;

(x)  $-[N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^DR^E]^+$ ;

(xi)  $-(\text{феніл})C_{1-6} \text{ алкілом}$ , де  $C_{1-6}$  алкіл заміщений 5-10-членним гетероариллом,  $-NR^DR^E$ ,  $-[N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^DR^E]^+$  або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщеним галогеном, гідроксильом,  $C_{1-6}$  алкокси,  $-C(=O)NR^DR^E$  або  $-CO_2H$ ;

(xiii)  $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_{1-6} \text{ алкіл}$ , де  $C_{1-6}$  алкіл, заміщений 5-10-членним гетероариллом,  $-NR^DR^E$ ,  $-[N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^DR^E]^+$  або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероариллом, необов'язково заміщеним галогеном,  $-NR^DR^E$ ,  $C_{1-6}$  алкокси,  $-C(=O)NR^DR^E$  або  $-CO_2H$ ;

$R^5$  вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $-C(=O)OR^F$ ,  $-C(=O)NR^GR^H$ ,  $-S(O_2)NR^GR^H$ ,  $-N(R^I)-C(=O)R^J$  і  $-N(R^I)-S(O_2)R^K$ ;

кожен  $R^6$  незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано,  $C_{1-6}$  алкілу,  $C_{2-6}$  алкенілу,  $C_{2-6}$  алкінілу,  $C_{1-6}$  алкокси,  $C_{1-6}$  алканолу,  $C_{1-6}$  алканоліокси,  $C_{1-6}$  алкоксикарбонілу,  $C_{1-6}$  галогеналкілу,  $C_{1-6}$  галогеналкокси і  $-NR^AR^B$ ; нижній індекс m дорівнює 0, 1, 2 або 3;

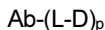
кожен  $R^A$  та  $R^B$  незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та  $C_{1-6}$  алкілу; або  $R^A$  та  $R^B$  разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  $C_{1-6}$  алкілами;

$R^C$  вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та  $C_{1-10}$  алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен  $R^D$ ,  $R^E$ ,  $R^G$  та  $R^H$  незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену,  $C_{1-6}$  алкілу,  $C_{2-6}$  алкенілу,  $C_{3-8}$  циклоалкілу,  $C_{3-8}$  циклоалкіл( $C_{1-6}$  алкіл)-, арилу та арил( $C_{1-6}$  алкіл)-; або  $R^D$  та  $R^E$  або  $R^G$  та  $R^H$  разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними  $C_{1-6}$  алкілами;

$R^F$  вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу,  $C_{2-6}$  алкенілу,  $C_{2-6}$  алкінілу,  $C_{3-8}$  циклоалкілу, арилу, арил( $C_{1-6}$  алкіл)- і  $C_{1-6}$  алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену,  $C_{1-6}$  алканоліокси,  $C_{1-6}$  алкокси та  $C_{3-8}$  циклоалкілу; і

кожен  $R^I$ ,  $R^J$  і  $R^K$  незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і  $C_1$ - $C_6$  алкілу.

17. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнята сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або  $\epsilon$ -аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

L має формулу  $-M-(A)_a-(W)_w-(Y)_y-(X)_x$ , де:

нижній індекс a дорівнює 0 або 1;

нижній індекс y дорівнює 0 або 1;

нижній індекс w дорівнює 0 або 1;

нижній індекс x дорівнює 0 або 1;

M являє собою сукцинімід, гідролізований сукцинімід, амід або триазол;

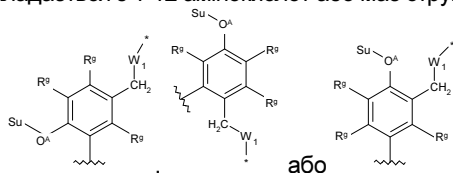
A являє собою  $C_{2-20}$  алкілен необов'язково заміщений 1-3  $R^{a1}$ ; або 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-3  $R^{b1}$ ;

кожен  $R^{a1}$  незалежно вибраний із групи, яка складається з:  $C_{1-6}$  алкілу,  $C_{1-6}$  галогеналкілу,  $C_{1-6}$  алкокси,  $C_{1-6}$  галогеналкокси, галогену,  $-OH$ ,  $=O$ ,  $-NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$  і  $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$ ;

кожен  $R^{b1}$  незалежно вибраний із групи, яка складається з:  $C_{1-6}$  алкілу,  $C_{1-6}$  галогеналкілу,  $C_{1-6}$  алкокси,  $C_{1-6}$  галогеналкокси, галогену,  $-OH$ ,  $-NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$ ,  $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$  і  $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$ ;

кожен  $R^{d1}$  і  $R^{e1}$  незалежно являє собою гідроген або  $C_{1-3}$  алкіл;

W складається з 1-12 амінокислот або має структуру:



де Su являє собою цукровий фрагмент;

$-O^A$  представляє атом кисню або глікозидний зв'язок;

кожен  $R^9$  незалежно являє собою гідроген, галоген,  $C_1$ - $C_6$  алкокси,  $-N(C_{1-6} \text{ алкіл})_2$ ,  $-NHC(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$ ,  $-CN$ ,  $-CF_3$ , ацил, карбоксамід,  $C_1$ - $C_6$  алкіл або  $-NO_2$ ;  $W^1$  відсутній, являє собою  $-C(=O)-O-$  або  $-O-C(=O)-$ ;

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до A або M;

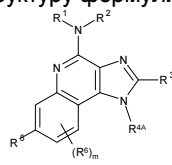
* представляє ковалентне приєднання до X, Y або D;

Y являє собою самознищений фрагмент, несамознищений фрагмент, що вивільняється, або нерозщеплюваний фрагмент;

X являє собою C_1 - C_6 алкілен або 3-6-членний гетероалкілен;

L необов'язково заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72;

кожен D має структуру формули (III):



(III)

або її фармацевтично прийнятної солі;

де:

R^1 вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_1 - C_6 алкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_1 - C_6 алканолу, C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, C_3 - C_6 циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_1 - C_6 алканол, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_3 - C_6 циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C_3 - C_8 циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 алкілію та $-NR^A R^B$; R^2 вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_1 - C_6 алкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_1 - C_6 алканолу, C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, C_3 - C_6 циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_1 - C_6 алканол, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_3 - C_6 циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C_3 - C_8 циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 алкілію та $-NR^A R^B$; або

R^1 і R^2 , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1 - C_6 алкілами;

R^3 вибраний із групи, що складається з гідрогену, $-NR^A R^B$, $-C(=O)NR^A R^B$, C_1 - C_6 алкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_1 - C_6 алканолу, C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, C_1 - C_6 алканоліокси, C_3 - C_6 циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_1 - C_6 алканол, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алканоліокси, C_3 - C_6 циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C_3 - C_8 циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 алкілію та $-NR^A R^B$;

R^{4A} являє собою (a) точку ковалентного приєднання до L; або (b) C_1 - C_6 алкіл, заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) $-OR^C$;

(iii) $-SR^C$;

(iv) $-NH-S(O_2)R^C$;

(v) $-OC(=O)R^C$;

(vi) $-CO_2H$;

(vii) C_1 - C_6 алкоксикарбонілом;

(viii) $-C(=O)NR^D R^E$;

(ix) $-NR^D R^E$;

(x) $-[N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^D R^E]^+$;

(xi) $-(\text{феніл})C_{1-6} \text{ алкілом}$, де C_{1-6} алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксилом, C_1 - C_6 алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$ або $-CO_2H$;

(xiii) $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_{1-6} \text{ алкіл}$, де C_{1-6} алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, $-NR^D R^E$, C_1 - C_6 алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$ або $-CO_2H$;

при цьому коли R^{4A} являє собою (b), C_{1-6} алкіл або його замісник додатково заміщені точкою ковалентного приєднання до L;

R^5 вибраний із групи, що складається з гідрогену, $-C(=O)OR^F$, $-C(=O)NR^GR^H$, $-S(O_2)NR^GR^H$, $-N(R^I)-C(=O)R^J$ і $-N(R^I)-S(O_2)R^K$;

кожен R^6 незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкенілу, C_{2-6} алкінілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} алканолу, C_{1-6} алканоліокси, C_{1-6} алкоксикарбонілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} галогеналкокси і $-NR^AR^B$;

нижній індекс m дорівнює 0, 1, 2 або 3;

кожен R^A та R^B незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C_{1-6} алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_{1-6} алкілами;

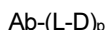
R^C вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C_{1-10} алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

кожен R^D , R^E , R^G та R^H незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкенілу, C_{3-8} циклоалкілу, C_{3-8} циклоалкіл(C_{1-6} алкіл)-, арилу та арил(C_{1-6} алкіл)-; або R^D та R^E або R^G та R^H разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_{1-6} алкілами;

R^F вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C_{2-6} алкенілу, C_{2-6} алкінілу, C_{3-8} циклоалкілу, арилу, арил(C_{1-6} алкіл)- і C_{1-6} алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C_{1-6} алканоліокси, C_{1-6} алкокси та C_{3-8} циклоалкілу; і

кожен R^I , R^J і R^K незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і C_{1-6} алкілу.

18. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнята сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або є-аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

L має формулу $-M-(A)_a-(W)_w-(Y)_y-(X)_x-$, де:

нижній індекс a дорівнює 0 або 1;

нижній індекс y дорівнює 0 або 1;

нижній індекс w дорівнює 0 або 1;

нижній індекс x дорівнює 0 або 1;

M являє собою сукцинімід, гідролізований сукцинімід, амід або триазол;

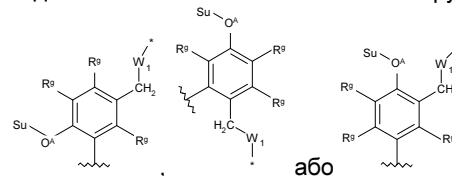
A являє собою C_{2-20} алкілен необов'язково заміщений 1-3 R^{a1} ; або 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-3 R^{b1} ;

кожен R^{a1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} галогеналкокси, галогену, $-OH$, $=O$, $-NR^{d1}R^{e1}$, $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$ і $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$;

кожен R^{b1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} галогеналкокси, галогену, $-OH$, $-NR^{d1}R^{e1}$, $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$ і $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$;

кожен R^{d1} і R^{e1} незалежно являє собою гідроген або C_{1-3} алкіл;

W складається з 1-12 амінокислот або має структуру:



обов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами;

R^4 являє собою (a) $-OR^C$ або (b) C_1-C_6 алкіл, необов'язково заміщений;

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) $-OR^C$;

(iii) $-SR^C$;

(iv) $-NH-S(O_2)R^C$;

(v) $-OC(=O)R^C$;

(vi) $-CO_2H$;

(vii) C_1-C_6 алкоксикарбонілом;

(viii) $-C(=O)NR^D R^E$;

(ix) $-NR^D R^E$;

(x) $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$;

(xi) $-(\text{феніл})C_1-C_6$ алкілом, де C_1-C_6 алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщеним галогеном, гідроксилом, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$ або $-CO_2H$;

(xiii) $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_1-C_6$ алкіл, де C_1-C_6 алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, $-NR^D R^E$, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$ або $-CO_2H$;

R^5 вибраний із групи, що складається з гідрогену, $-C(=O)OR^F$, $-C(=O)NR^G R^H$, $-S(O_2)NR^G R^H$, $-N(R^I)-C(=O)R^J$ і $-N(R^I)-S(O_2)R^K$;

кожен R^6 незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 алканойлу, C_1-C_6 алканойлокси, C_1-C_6 алкоксикарбонілу, C_1-C_6 галогеналкілу, C_1-C_6 галогеналкокси і $-NR^A R^B$;

нижній індекс m дорівнює 0, 1, 2 або 3;

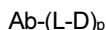
кожен R^A та R^B незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C_1-C_6 алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами;

R^C вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C_1-C_{10} алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен R^D , R^E , R^G та R^H незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_3-C_8 циклоалкілу, C_3-C_8 циклоалкіл(C_1-C_6 алкіл)-, арилу та арил(C_1-C_6 алкіл)-; або R^D та R^E або R^G та R^H разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами;

R^F вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_3-C_8 циклоалкілу, арилу, арил(C_1-C_6 алкіл)- і C_1-C_6 алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C_1-C_6 алканойлокси, C_1-C_6 алкокси та C_3-C_8 циклоалкілу; і

кожен R^I , R^J і R^K незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і C_1-C_6 алкілу.

19. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнята сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або ϵ -аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

L має формулу $-M-(A)_a-(W)_w-(Y)_y-(X)_x$, де:

нижній індекс a дорівнює 0 або 1;

нижній індекс y дорівнює 0 або 1;

нижній індекс w дорівнює 0 або 1;

нижній індекс x дорівнює 0 або 1;

M являє собою сукцинімід, гідролізований сукцинімід, амід або триазол;

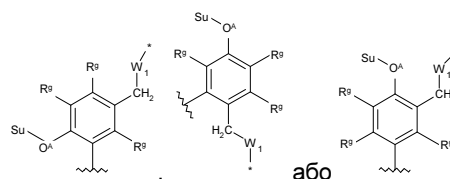
A являє собою C_{2-20} алкілен необов'язково заміщений 1-3 R^{a1} ; або 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-3 R^{b1} ;

кожен R^{a1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} галогеналкокси, галогену, $-OH$, $=O$, $-NR^{d1} R^{e1}$, $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1} R^{e1}$, $-C(=O)NR^{d1} R^{e1}$, $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$ і $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$;

кожен R^{b1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} галогеналкокси, галогену, $-OH$, $-NR^{d1} R^{e1}$, $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1} R^{e1}$, $-C(=O)NR^{d1} R^{e1}$, $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$ і $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$;

кожен R^{d1} і R^{e1} незалежно являє собою гідроген або C_{1-3} алкіл;

W складається з 1-12 амінокислот або має структуру:



де Su являє собою цукровий фрагмент;

$-O^A$ представляє атом кисню або глікозидний зв'язок;

кожен R^a незалежно являє собою гідроген, галоген, C_1-C_6 алкокси, $-N(C_1-C_6 \text{ алкіл})_2$, $-NHC(=O)(C_1-C_6 \text{ алкіл})$, $-CN$, $-CF_3$, ацил, карбоксамід, C_1-C_6 алкіл або $-NO_2$;

W^1 відсутній, являє собою $*C(=O)-O-$ або $*-O-C(=O)-$;

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до A або M;

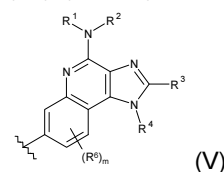
\* представляє ковалентне приєднання до X, Y або D;

Y являє собою самознищений фрагмент, несамознищений фрагмент, що вивільняється, або нерозщеплюваний фрагмент;

X являє собою  $C_1-C_6$  алкілен або 3-6-членний гетероалкілен;

L необов'язково заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72;

кожен D має структуру формули (V):



або її фармацевтично прийнятої солі;

де:

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до L;

R^1 вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_1 - C_6 алкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_1 - C_6 алканойлу, C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, C_3 - C_6 циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_1 - C_6 алканойл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_3 - C_6 циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C_3 - C_8 циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 алкілтію та $-NR^A R^B$;

R^2 вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_1 - C_6 алкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_1 - C_6 алканойлу, C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, C_3 - C_6 циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_1 - C_6 алканойл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_3 - C_6 циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C_3 - C_8 циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 алкілтію та $-NR^A R^B$; або

R^1 і R^2 , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1 - C_6 алкілами;

R^3 вибраний із групи, що складається з гідрогену, $-NR^A R^B$, $-C(=O)NR^A R^B$, C_1 - C_6 алкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_1 - C_6 алканойлу, C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, C_1 - C_6 алканойлокси, C_3 - C_6 циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_1 - C_6 алканойл, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алканойлокси, C_3 - C_6 циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C_3 - C_8 циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 алкілтію та $-NR^A R^B$;

R^4 являє собою (a) $-OR^C$ або (b) C_1 - C_6 алкіл, необов'язково заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) $-OR^C$;

(iii) $-SR^C$;

(iv) $-NH-S(O_2)R^C$;

(v) $-OC(=O)R^C$;

(vi) $-CO_2H$;

(vii) C_1 - C_6 алкоксикарбонілом;

(viii) $-C(=O)NR^D R^E$;

(ix) $-NR^D R^E$;

(x) $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$;

(xi) $-(\text{феніл})C_1-C_6$ алкілом, де C_1 - C_6 алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксилом, C_1 - C_6 алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$ або $-CO_2H$;

(xiii) $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_1-C_6$ алкіл, де C_1 - C_6 алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, $-NR^D R^E$, C_1 - C_6 алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$ або $-CO_2H$;

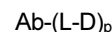
кожен R^6 незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C_1 - C_6 алкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 алканойлу, C_1 - C_6 алканойлокси, C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, C_1 - C_6 галогеналкілу, C_1 - C_6 галогеналкокси і $-NR^A R^B$;

нижній індекс m дорівнює 0, 1, 2 або 3;

кожен R^A та R^B незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C_1 - C_6 алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1 - C_6 алкілами;

R^C вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C_1 - C_{10} алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен R^D і R^E незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_1 - C_6 алкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_3 - C_8 циклоалкілу, C_3 - C_8 циклоалкіл(C_1 - C_6 алкіл)-, арилу та арил(C_1 - C_6 алкіл)-; або R^D і R^E разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1 - C_6 алкілами.

20. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або ϵ -аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

L має формулу $-M-(A)_a-(W)_w-(Y)_y-(X)_x$, де:

нижній індекс a дорівнює 0 або 1;

нижній індекс y дорівнює 0 або 1;

нижній індекс w дорівнює 0 або 1;

нижній індекс x дорівнює 0 або 1;

M являє собою сукцинїмід, гідролізований сукцинїмід, амід або триазол;

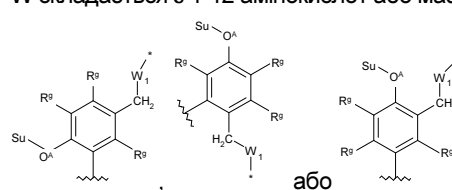
A являє собою C_{2-20} алкілен необов'язково заміщений 1-3 R^{a1} ; або 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-3 R^{b1} ;

кожен R^{a1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} галогеналкокси, галогену, $-OH$, $=O$, $-NR^{d1}R^{e1}$, $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$ і $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$;

кожен R^{b1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} галогеналкокси, галогену, $-OH$, $-NR^{d1}R^{e1}$, $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$ і $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$;

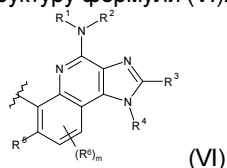
кожен R^{d1} і R^{e1} незалежно являє собою гідроген або C_{1-3} алкіл;

W складається з 1-12 амінокислот або має структуру:



де Su являє собою цукровий фрагмент;

-O^A- представляє атом оксигену або глікозидний зв'язок;
кожен R⁹ незалежно являє собою гідроген, галоген, C₁-C₆ алкокси, -N(C₁-C₆ алкіл)₂, -NHC(=O)(C₁-C₆ алкіл), -CN, -CF₃, ацил, карбоксамід, C₁-C₆ алкіл або -NO₂;
W¹ відсутній, являє собою *-C(=O)-O- або *-O-C(=O)-;
~~~~~ представляє ковалентне приєднання до A або M;  
\* представляє ковалентне приєднання до X, Y або D;  
Y являє собою самознищений фрагмент, несамознищений фрагмент, що вивільняється, або нерозщеплюваний фрагмент;  
X являє собою C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілен або 3-6-членний гетероалкілен;  
L необов'язково заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72;  
кожен D має структуру формули (VI):



або її фармацевтично прийнятної солі;  
де:

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до L;  
R¹ вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканол, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілію та -NR^AR^B;
R² вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканол, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілію та -NR^AR^B;
або

R¹ і R², разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R³ вибраний із групи, що складається з гідрогену, -NR^AR^B, -C(=O)NR^AR^B, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ алканоліокси, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканол, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₁-C₆ алканоліокси, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілію та -NR^AR^B;

R⁴ являє собою (a) -OR^C або (b) C₁-C₆ алкіл, необов'язково заміщений:

- (i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;
- (ii) -OR^C;
- (iii) -SR^C;
- (iv) -NH-S(O₂)R^C;
- (v) -OC(=O)R^C;
- (vi) -CO₂H;
- (vii) C₁-C₆ алкоксикарбонілом;
- (viii) -C(=O)NR^DR^E;
- (ix) -NR^DR^E;
- (x) -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺;
- (xi) -(феніл)C₁-C₆ алкілом, де C₁-C₆ алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^DR^E, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;
- (xii) феніл, заміщеним галогеном, гідроксилем, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^DR^E або -CO₂H;
- (xiii) -(5-10-членний гетероарил)C₁-C₆ алкіл, де C₁-C₆ алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^DR^E, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або
- (xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, -NR^DR^E, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^DR^E або -CO₂H;

R⁵ вибраний із групи, що складається з гідрогену, -C(=O)OR^F, -C(=O)NR^GR^H, -S(O₂)NR^GR^H, -N(R^I)-C(=O)R^J і -N(R^I)-S(O₂)R^K;

кожен R^{6A} незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алканоліокси, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ галогеналкілу, C₁-C₆ галогеналкокси і -NR^AR^B; нижній індекс q дорівнює 0, 1 або 2;

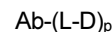
кожен R^A та R^B незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C₁-C₆ алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R^C вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C₁-C₁₀ алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен R^D, R^E, R^G та R^H незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₃-C₈ циклоалкілу, C₃-C₈ циклоалкіл(C₁-C₆ алкіл)-, арилу та арил(C₁-C₆ алкіл)-; або R^D та R^E або R^G та R^H разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R^F вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₃-C₈ циклоалкілу, арилу, арил(C₁-C₆ алкіл)- і C₁-C₆ алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C₁-C₆ алканоліокси, C₁-C₆ алкокси та C₃-C₈ циклоалкілу; і

кожен R^I, R^J і R^K незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і C₁-C₆ алкілу.

21. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



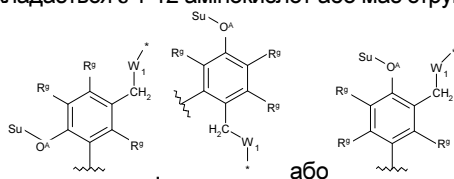
або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

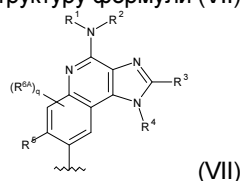
Ab являє собою антитіло;

кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;
 де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або ε-аміногрупи залишку лізину;
 нижній індекс р являє собою ціле число від 1 до 16;
 L має формулу $-M-(A)_a-(W)_w-(Y)_y-(X)_x$, де:
 нижній індекс а дорівнює 0 або 1;
 нижній індекс у дорівнює 0 або 1;
 нижній індекс w дорівнює 0 або 1;
 нижній індекс x дорівнює 0 або 1;
 M являє собою сукцинімід, гідролізований сукцинімід, амід або триазол;
 A являє собою C_{2-20} алкілен необов'язково заміщений 1-3 R^{a1} ; або 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-3 R^{b1} ;
 кожен R^{a1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} галогеналкокси, галогену, $-OH$, $=O$, $-NR^{d1}R^{e1}$, $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$ і $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$;
 кожен R^{b1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} галогеналкокси, галогену, $-OH$, $-NR^{d1}R^{e1}$, $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$ і $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$;
 кожен R^{d1} і R^{e1} незалежно являє собою водень або C_{1-3} алкіл;
 W складається з 1-12 амінокислот або має структуру:



де Su являє собою цукровий фрагмент;
 $-O^A$ представляє атом кисню або глікозидний зв'язок;
 кожен R^g незалежно являє собою водень, галоген, C_{1-6} алкокси, $-N(C_{1-6} \text{ алкіл})_2$, $-NHC(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$, $-CN$, $-CF_3$, ацил, карбоксамід, C_{1-6} алкіл або $-NO_2$;
 W^1 відсутній, являє собою $*C(=O)-O-$ або $*O-C(=O)-$;
 \sim представляє ковалентне приєднання до A або M;
 $*$ представляє ковалентне приєднання до X, Y або D;
 Y являє собою самознищуваний фрагмент, несамознищуваний фрагмент, що вивільняється, або нерозщеплюваний фрагмент;
 X являє собою C_{1-6} алкілен або 3-6-членний гетероалкілен;
 L необов'язково заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72;
 кожен D має структуру формули (VII):



або її фармацевтично прийнятної солі;

де:

\sim представляє ковалентне приєднання до L;
 R^1 вибраний із групи, що складається з воденю, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкенілу, C_{2-6} алкінілу, C_{1-6} алканойлу, C_{1-6} алкоксикарбонілу, C_{3-6} циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алканойл,

C_{1-6} алкоксикарбоніл, C_{3-6} циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C_{3-8} циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} алкілію та $-NR^AR^B$; R^2 вибраний із групи, що складається з воденю, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкенілу, C_{2-6} алкінілу, C_{1-6} алканойлу, C_{1-6} алкоксикарбонілу, C_{3-6} циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алканойл, C_{1-6} алкоксикарбоніл, C_{3-6} циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C_{3-8} циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} алкілію та $-NR^AR^B$; або

R^1 і R^2 , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_{1-6} алкілами;

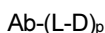
R^3 вибраний із групи, що складається з воденю, $-NR^AR^B$, $-C(=O)NR^AR^B$, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкенілу, C_{2-6} алкінілу, C_{1-6} алканойлу, C_{1-6} алкоксикарбонілу, C_{1-6} алканойлокси, C_{3-6} циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алканойл, C_{1-6} алкоксикарбоніл, C_{1-6} алканойлокси, C_{3-6} циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C_{3-8} циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} алкілію та $-NR^AR^B$;

R^4 являє собою (a) $-OR^C$ або (b) C_{1-6} алкіл, необов'язково заміщений:

- 1-3 незалежно вибраними галогенами;
 - $-OR^C$;
 - $-SR^C$;
 - $-NH-S(O_2)R^C$;
 - $-OC(=O)R^C$;
 - $-CO_2H$;
 - C_{1-6} алкоксикарбонілом;
 - $-C(=O)NR^DR^E$;
 - $-NR^DR^E$;
 - $-[N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^DR^E]^+$;
 - $-(\text{феніл})C_{1-6} \text{ алкілом}$, де C_{1-6} алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилу, $-NR^DR^E$, $-[N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^DR^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;
 - феніл, заміщений галогеном, гідроксильом, C_{1-6} алкокси, $-C(=O)NR^DR^E$ або $-CO_2H$;
 - $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_{1-6} \text{ алкіл}$, де C_{1-6} алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилу, $-NR^DR^E$, $-[N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^DR^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або
 - 5-10-членним гетероарилу, необов'язково заміщений галогеном, $-NR^DR^E$, C_{1-6} алкокси, $-C(=O)NR^DR^E$ або $-CO_2H$;
- R^5 вибраний із групи, що складається з воденю, $-C(=O)OR^F$, $-C(=O)NR^GR^H$, $-S(O_2)NR^GR^H$, $-N(R^I)-C(=O)R^J$ і $-N(R^I)-S(O_2)R^K$;
- кожен R^{6A} незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C_{1-6} алкілу, C_{2-6} алкенілу, C_{2-6} алкінілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} ал-

каноїлу, C₁-C₆ алканоліокси, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ галогеналкілу, C₁-C₆ галогеналкокси і -NR^AR^B; нижній індекс q дорівнює 0, 1 або 2; кожен R^A та R^B незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C₁-C₆ алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами; R^C вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C₁-C₁₀ алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен R^D, R^E, R^G та R^H незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₃-C₈ циклоалкілу, C₃-C₈ циклоалкіл(C₁-C₆ алкіл)-, арилу та арил(C₁-C₆ алкіл)-; або R^D та R^E або R^G та R^H разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами; R^F вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₃-C₈ циклоалкілу, арилу, арил(C₁-C₆ алкіл)- і C₁-C₆ алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алканоліокси, C₁-C₆ алкокси та C₃-C₈ циклоалкілу; і кожен R^I, R^J і R^K незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і C₁-C₆ алкілу.

22. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:



або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

Ab являє собою антитіло;

кожен L являє собою лінкер;

де кожен D кон'югований з лінкером;

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або ε-аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

L має формулу -M-(A)_a-(W)_w-(Y)_y-(X)_x-, де:

нижній індекс a дорівнює 0 або 1;

нижній індекс y дорівнює 0 або 1;

нижній індекс w дорівнює 0 або 1;

нижній індекс x дорівнює 0 або 1;

M являє собою сукцинімід, гідролізований сукцинімід, амід або триазол;

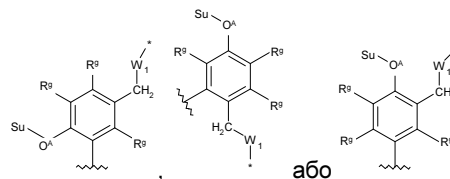
A являє собою C₂₋₂₀ алкілен необов'язково заміщений 1-3 R^{a1}; або 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-3 R^{b1};

кожен R^{a1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C₁₋₆ алкілу, C₁₋₆ галогеналкілу, C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ галогеналкокси, галогену, -OH, =O, -NR^{d1}R^{e1}, -(C₁₋₆ алкілен)-NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)(C₁₋₆ алкіл) і -C(=O)O(C₁₋₆ алкіл);

кожен R^{b1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C₁₋₆ алкілу, C₁₋₆ галогеналкілу, C₁₋₆ алкокси, C₁₋₆ галогеналкокси, галогену, -OH, -NR^{d1}R^{e1}, -(C₁₋₆ алкілен)-NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)NR^{d1}R^{e1}, -C(=O)(C₁₋₆ алкіл) і -C(=O)O(C₁₋₆ алкіл);

кожен R^{d1} і R^{e1} незалежно являє собою гідроген або C₁₋₃ алкіл;

W складається з 1-12 амінокислот або має структуру:



де Su являє собою цукровий фрагмент;

-O^A- представляє атом оксигену або глікозидний зв'язок;

кожен R^g незалежно являє собою гідроген, галоген, C₁-C₆ алкокси, -N(C₁-C₆ алкіл)₂, -NHC(=O)(C₁-C₆ алкіл), -CN, -CF₃, ацил, карбоксамід, C₁-C₆ алкіл або -NO₂; W¹ відсутній, являє собою *-C(=O)-O- або *-O-C(=O)-;

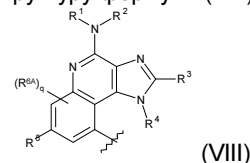
~~~~~ представляє ковалентне приєднання до A або M;

\* представляє ковалентне приєднання до X, Y або D; Y являє собою самознищуваний фрагмент, несамознищуваний фрагмент, що вивільняється, або нерозщеплюваний фрагмент;

X являє собою C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкілен або 3-6-членний гетероалкілен;

L необов'язково заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72;

кожен D має структуру формули (VIII):



(VIII)

або її фармацевтично прийнятої солі;

де:

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до L;

R¹ вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолілу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканоліл, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілію та -NR^AR^B;

R² вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолілу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканоліл, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілію та -NR^AR^B;

або R¹ і R², разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R³ вибраний із групи, що складається з гідрогену, -NR^AR^B, -C(=O)NR^AR^B, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолілу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ алканоліокси, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гете-

роциклу; де кожен C_1-C_6 алкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_1-C_6 алканоліл, C_1-C_6 алкоксикарбоніл, C_1-C_6 алканоліокси, C_3-C_6 циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранилу, C_3-C_8 циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 алкілію та $-NR^A R^B$; R^4 являє собою (a) $-OR^C$ або (b) C_1-C_6 алкіл, необов'язково заміщений:

- (i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;
- (ii) $-OR^C$;
- (iii) $-SR^C$;
- (iv) $-NH-S(O_2)R^C$;
- (v) $-OC(=O)R^C$;
- (vi) $-CO_2H$;
- (vii) C_1-C_6 алкоксикарбонілом;
- (viii) $-C(=O)NR^D R^E$;
- (ix) $-NR^D R^E$;
- (x) $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$;
- (xi) $-(\text{феніл})C_1-C_6$ алкілом, де C_1-C_6 алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;
- (xii) феніл, заміщеним галогеном, гідроксилом, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$ або $-CO_2H$;
- (xiii) $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_1-C_6$ алкіл, де C_1-C_6 алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або
- (xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, $-NR^D R^E$, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$ або $-CO_2H$;

R^5 вибраний із групи, що складається з гідрогену, $-C(=O)OR^F$, $-C(=O)NR^G R^H$, $-S(O_2)NR^G R^H$, $-N(R^I)-C(=O)R^J$ і $-N(R^I)-S(O_2)R^K$; кожен R^{6A} незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 алканолілу, C_1-C_6 алканоліокси, C_1-C_6 алкоксикарбонілу, C_1-C_6 галогеналкілу, C_1-C_6 галогеналкокси і $-NR^A R^B$;

нижній індекс q дорівнює 0, 1 або 2;

кожен R^A та R^B незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C_1-C_6 алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами;

R^C вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C_1-C_{10} алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен R^D , R^E , R^G та R^H незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_3-C_8 циклоалкілу, C_3-C_8 циклоалкіл(C_1-C_6 алкіл)-, арилу та арил(C_1-C_6 алкіл)-; або R^D та R^E або R^G та R^H разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами;

R^F вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_3-C_8 циклоалкілу, арилу, арил(C_1-C_6 алкіл)- і C_1-C_6 алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену,

C_1-C_6 алканоліокси, C_1-C_6 алкокси та C_3-C_8 циклоалкілу; і

кожен R^I , R^J і R^K незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і C_1-C_6 алкілу.

23. ADC за п. 1 або п. 12, де один R^X являє собою R^5 , а решта R^X являють собою R^6 ; де R^5 (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, $-C(=O)OR^F$, $-C(=O)NR^G R^H$, $-S(O_2)NR^G R^H$, $-N(R^I)-C(=O)R^J$ і $-N(R^I)-S(O_2)R^K$; і

кожен R^6 (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L; або (b) незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 алканолілу, C_1-C_6 алканоліокси, C_1-C_6 алкоксикарбонілу, C_1-C_6 галогеналкілу, C_1-C_6 галогеналкокси та $-NR^A R^B$, при цьому не більше одного R^6 являє собою точку ковалентного приєднання до L.

24. ADC за будь-яким із пп. 1-23, де нижній індекс r являє собою ціле число від 1 до 8.

25. ADC за будь-яким із пп. 1-23, де нижній індекс p являє собою ціле число від 4 до 12.

26. ADC за будь-яким із пп. 1-23, де нижній індекс r являє собою ціле число від 8 до 16.

27. ADC за будь-яким із пп. 1-24, де нижній індекс p дорівнює 2, 4, 6 або 8.

28. ADC за будь-яким із пп. 1-27, де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або ϵ -аміногрупи залишку лізину.

29. ADC за будь-яким із пп. 1-27, де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою ϵ -аміногрупи залишку лізину або де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сульфору залишку цистеїну.

30. ADC за будь-яким із пп. 1-2, 12-13 або 23, де R^1 являє собою точку ковалентного приєднання до лінкеру.

31. ADC за будь-яким із пп. 1-2, 12-13 або 23, де R^2 являє собою точку ковалентного приєднання до лінкеру.

32. ADC за будь-яким із пп. 1-2, 12-13 або 23, де R^3 являє собою точку ковалентного приєднання до лінкеру.

33. ADC за будь-яким із пп. 1-2, 12-13 або 23, де R^4 являє собою точку ковалентного приєднання до лінкеру.

34. ADC за будь-яким із пп. 1-2, 12-13 або 23, де C_1-C_6 алкіл R^4 або його замісник являє собою точку ковалентного приєднання до лінкеру.

35. ADC за будь-яким із пп. 1-2, 12-13 або 23, де замісник C_1-C_6 алкілу R^4 являє собою точку ковалентного приєднання до лінкеру.

36. ADC за будь-яким із пп. 1-2, 12-13 або 23, де R^5 являє собою точку ковалентного приєднання до лінкеру.

37. ADC за будь-яким із пп. 1-2, 12-13 або 23, де один R^6 являє собою точку ковалентного приєднання до лінкеру.

38. ADC за будь-яким із пп. 1-2, 12-13 або 23, де один із R^A і R^B являє собою точку ковалентного приєднання до лінкеру.

39. ADC за будь-яким із пп. 1-2, 12-13, 23 або 38, де R^A являє собою точку ковалентного приєднання до лінкеру.

- 2.57

67. ADC за будь-яким із пп. 1-2, 4, 6-13, 15, 17-30, 32-56 або 60-63, де R^1 і R^2 обидва являють собою незаміщений C_1-C_6 алкіл.

68. ADC за будь-яким із пп. 1-2, 4, 6, 12-13, 15, 17 або 32-51, де R^1 і R^2 , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами.

69. ADC за будь-яким із пп. 1-2, 4, 6, 12-13, 15, 17, 32-51 або 68, де R^1 і R^2 разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють незаміщений 3-6-членний гетероцикл.

70. ADC за будь-яким із пп. 1-6, 8-17, 19-31 або 33-69, де R^3 вибраний із групи, що складається з гідрогену, $-NR^A R^B$, $-C(=O)NR^A R^B$, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_1-C_6 алканолу, C_1-C_6 алкоксикарбонілу, C_1-C_6 алканоліокси, C_3-C_6 циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C_1-C_6 алкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_1-C_6 алканол, C_1-C_6 алкоксикарбоніл, C_1-C_6 алканоліокси, C_3-C_6 циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений одним замісником, вибраним із групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C_3-C_8 циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 алкілію та $-NR^A R^B$.

71. ADC за будь-яким із пп. 1-6, 8-17, 19-31 або 33-70, де R^3 вибраний із групи, що складається з гідрогену, $-NR^A R^B$, $-C(=O)NR^A R^B$, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_1-C_6 алканолу, C_1-C_6 алкоксикарбонілу, C_1-C_6 алканоліокси, C_3-C_6 циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу і 3-12-членного гетероциклу; де C_1-C_6 алкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_1-C_6 алканол, C_1-C_6 алкоксикарбоніл, C_1-C_6 алканоліокси, C_3-C_6 циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл є незаміщеними.

72. ADC за будь-яким із пп. 1-6, 8-17, 19-31 або 33-71, де R^3 вибраний із групи, що складається з гідрогену, $-NR^A R^B$, $-C(=O)NR^A R^B$, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_1-C_6 алканолу, C_1-C_6 алкоксикарбонілу і C_1-C_6 алканоліокси; де C_1-C_6 алкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_1-C_6 алканол, C_1-C_6 алкоксикарбоніл і C_1-C_6 алканоліокси є незаміщеними.

73. ADC за будь-яким із пп. 1-6, 8-17, 19-31 або 33-72, де R^3 вибраний із групи, яка складається з гідрогену, незаміщеного C_1-C_6 алкілу, незаміщеного C_2-C_6 алкенілу і незаміщеного C_2-C_6 алкінілу.

74. ADC за будь-яким із пп. 1-6, 8-17, 19-31 або 33-73, де R^3 являє собою незаміщений C_1-C_6 алкіл.

75. ADC за будь-яким із пп. 1-6, 8-17, 19-31 або 33-74, де R^3 являє собою н-бутил.

76. ADC за будь-яким із пп. 1-6, 8-17, 19-31 або 33-70, де R^3 являє собою C_1-C_6 алкіл, заміщений C_1-C_6 алкокси.

77. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32 або 36-76, де R^4 являє собою C_1-C_6 алкіл, необов'язково заміщений:

- (i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;
- (ii) $-OR^C$;
- (iii) $-SR^C$;
- (iv) $-NH-S(O_2)R^C$;
- (v) $-OC(=O)R^C$;
- (vi) $-CO_2H$;
- (vii) C_1-C_6 алкоксикарбонілом;

(viii) $-C(=O)NR^D R^E$;

(ix) $-NR^D R^E$;

(x) $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$;

(xi) $-(\text{феніл})C_1-C_6$ алкілом, де C_1-C_6 алкіл заміщений 5-10-членним гетероариллом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщеним галогеном, гідроксиллом, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$ або $-CO_2H$;

(xiii) $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_1-C_6$ алкіл, де C_1-C_6 алкіл, заміщений 5-10-членним гетероариллом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероариллом, необов'язково заміщеним галогеном, $-NR^D R^E$, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$, $-SR^C$, (C_1-C_6) алкоксикарбонілом або $-CO_2H$.

78. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32 або 36-77, де R^4 являє собою C^1-C^6 алкіл, заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) $-OR^C$;

(iii) $-SR^C$;

(iv) $-NH-S(O_2)R^C$;

(v) $-OC(=O)R^C$;

(vi) $-CO_2H$;

(vii) C_1-C_6 алкоксикарбонілом;

(viii) $-C(=O)NR^D R^E$;

(ix) $-NR^D R^E$;

(x) $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$;

(xi) $-(\text{феніл})C_1-C_6$ алкілом, де C_1-C_6 алкіл заміщений 5-10-членним гетероариллом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщеним галогеном, гідроксиллом, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$ або $-CO_2H$;

(xiii) $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_1-C_6$ алкіл, де C_1-C_6 алкіл, заміщений 5-10-членним гетероариллом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероариллом, необов'язково заміщеним галогеном, $-NR^D R^E$, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$, $-SR^C$, (C_1-C_6) алкоксикарбонілом або $-CO_2H$.

79. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32 або 36-78, де R^4 являє собою C_1-C_6 алкіл, заміщений:

(ix) $-NR^D R^E$;

(x) $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$;

(xi) $-(\text{феніл})C_1-C_6$ алкілом, де C_1-C_6 алкіл заміщений 5-10-членним гетероариллом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщеним галогеном, гідроксиллом, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$ або $-CO_2H$;

(xiii) $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_1-C_6$ алкіл, де C_1-C_6 алкіл, заміщений 5-10-членним гетероариллом, $-NR^D R^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероариллом, необов'язково заміщеним галогеном, $-NR^D R^E$, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^D R^E$, $-SR^C$, (C_1-C_6) алкоксикарбонілом або $-CO_2H$.

80. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5-14, 16-30 або 34-79, де R^4 являє собою C_1-C_6 алкіл, заміщений $-OR^C$.

81. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5-14, 16-30 або 34-79, де R^4 являє собою C_1-C_6 алкіл, заміщений $-NR^D R^E$.

82. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32 або 36-79, де R^4 являє собою C_1-C_6 алкіл, заміщений $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$.

83. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32 або 36-79, де R^4 являє собою C_1-C_6 алкіл, заміщений $-(\text{феніл})C_1-C_6$ алкілом, де C_1-C_6 алкіл $-(\text{феніл})C_1-C_6$ алкілу заміщений 5-10-членним гетероариллом, $-NR^D R^E$,

$-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

84. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79, де R^4 являє собою $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкіл, заміщений $-(\text{феніл})\text{C}_1\text{-C}_3$ алкілом, де $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкіл $-(\text{феніл})\text{C}_1\text{-C}_3$ алкілу заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

85. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79, 83 або 84, де R^4 являє собою $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкіл, заміщений $-(\text{феніл})\text{C}_1\text{-C}_3$ алкілом, де $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкіл $-(\text{феніл})\text{C}_1\text{-C}_3$ алкілу заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

86. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79 або 83-85, де R^4 являє собою $-\text{CH}_2\text{-(феніл)-(C}_1\text{-C}_2\text{ алкіл)}$, де $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

87. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79 або 83-86, де R^4 являє собою $-\text{CH}_2\text{-(феніл)-(C}_1\text{-C}_2\text{ алкіл)}$, де $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкіл заміщений $-\text{NR}^{\text{DRE}}$ або $-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$.

88. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79 або 83-87, де R^4 являє собою $-\text{CH}_2\text{-(феніл)-(C}_1\text{-C}_2\text{ алкіл)}$, де $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкіл заміщений $-\text{NR}^{\text{DRE}}$.

89. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79 або 83-87, де R^4 являє собою $-\text{CH}_2\text{-(феніл)-(C}_1\text{-C}_2\text{ алкіл)}$, де $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкіл заміщений $-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$.

90. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32 або 36-79, де R^4 являє собою $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкіл, заміщений фенілом, заміщенням галогеном, гідроксилом, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, $-\text{C(=O)NR}^{\text{DRE}}$ або $-\text{CO}_2\text{H}$.

91. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79 або 90, де R^4 являє собою $-\text{CH}_2\text{-феніл}$, де феніл заміщений галогеном, гідроксилом, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, $-\text{C(=O)NR}^{\text{DRE}}$ або $-\text{CO}_2\text{H}$.

92. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32 або 36-79, де R^4 являє собою $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкіл, заміщений $-(5\text{-}10\text{-членний гетероарил})\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілом, де його $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

93. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79 або 92, де R^4 являє собою $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкіл, заміщений $-(5\text{-}10\text{-членний гетероарил})\text{C}_1\text{-C}_3$ алкілом, де $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкіл $-(5\text{-}10\text{-членний гетероарил})\text{C}_1\text{-C}_3$ алкілу заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

94. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79, 92 або 93, де R^4 являє собою $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкіл, заміщений $-(5\text{-}6\text{-членний гетероарил})\text{C}_1\text{-C}_3$ алкілом, де $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкіл $-(5\text{-}6\text{-членний гетероарил})\text{C}_1\text{-C}_3$ алкілу заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

95. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79 або 92-94, де R^4 являє собою $-\text{CH}_2\text{-(5-6-членний гетероарил)-(C}_1\text{-C}_2\text{ алкіл)}$, де $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

96. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79 або 92-95, де R^4 являє собою $-\text{CH}_2\text{-(5-6-член-$

ний гетероарил)-(C₁-C₂ алкіл), де C₁-C₂ алкіл заміщений $-\text{NR}^{\text{DRE}}$ або $-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$.

97. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79 або 92-96, де R^4 являє собою $-\text{CH}_2\text{-(5-6-членний гетероарил)-(C}_1\text{-C}_2\text{ алкіл)}$, де C₁-C₂ алкіл заміщений $-\text{NR}^{\text{DRE}}$.

98. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79 або 92-96, де R^4 являє собою $-\text{CH}_2\text{-(5-6-членний гетероарил)-(C}_1\text{-C}_2\text{ алкіл)}$, де C₁-C₂ алкіл заміщений $-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$.

99. ADC за будь-яким із пп. 94-98, де 5-6-членний гетероарил являє собою піридиніл, піримідиніл або піразиніл.

100. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32 або 36-79, де R^4 являє собою $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщенням галогеном, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, $-\text{C(=O)NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{SR}^{\text{C}}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{алкоксикарбонілом}$ або $-\text{CO}_2\text{H}$.

101. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79 або 100, де R^4 являє собою $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщенням галогеном, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, $-\text{C(=O)NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{SR}^{\text{C}}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{алкоксикарбонілом}$ або $-\text{CO}_2\text{H}$.

102. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79, 100 або 101, де R^4 являє собою $-\text{CH}_2\text{-(5-10-членний гетероарил)}$, де 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений галогеном, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, $-\text{C(=O)NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{SR}^{\text{C}}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{алкоксикарбонілом}$ або $-\text{CO}_2\text{H}$.

103. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32, 36-79 або 100-102, де R^4 являє собою $-\text{CH}_2\text{-(5-6-членний гетероарил)}$, де 5-6-членний гетероарил необов'язково заміщений галогеном, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, $-\text{C(=O)NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{SR}^{\text{C}}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{алкоксикарбонілом}$ або $-\text{CO}_2\text{H}$.

104. ADC за п. 103, де 5-6-членний гетероарил являє собою піридиніл, піримідиніл або піразиніл.

105. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32 або 36-76, де R^4 являє собою $-\text{OR}^{\text{C}}$.

106. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-14, 16, 18-32 або 36-79, де R^4 являє собою незаміщений $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкіл.

107. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-11 або 23-76, де R^4 є $-\text{S(=O)}_2\text{R}^{\text{C}}$, $-\text{C(=O)NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{C(=O)OR}^{\text{C}}$, $-\text{C(=O)SR}^{\text{C}}$, $-\text{C(=S)R}^{\text{C}}$ або $-\text{PO}_3\text{R}^{\text{C}}$.

108. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-11, 23-76 або 107, де R^4 являє собою $-\text{C(=O)NR}^{\text{DRE}}$ або $-\text{C(=O)OR}^{\text{C}}$.

109. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-11, 23-32 або 36-108, де жоден із R^1 та R^4 не заміщений солібілізуючою групою (Sb) вибраною з групи, що складається з фосфорилу, сульфурилу, нітро, $\text{C}_5\text{-C}_9$ моносахариду, $\text{C}_{10}\text{-C}_{18}$ дисахариду та $\text{C}_{15}\text{-C}_{27}$ трисахариду.

110. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-11, 23-32 або 36-108, де жоден із R_1 та R_4 заміщений солібілізуючою групою (Sb) вибраною з групи, що складається з фосфорилу, сульфурилу, нітро, $\text{C}_5\text{-C}_9$ моносахариду, $\text{C}_{10}\text{-C}_{18}$ дисахариду та $\text{C}_{15}\text{-C}_{27}$ трисахариду.

111. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-11, 23-32, 36-108 або 110, де R^1 заміщений солібілізуючою групою (Sb), вибраною з групи, що складається з фосфорилу, сульфурилу, нітро, $\text{C}_5\text{-C}_9$ моносахариду, $\text{C}_{10}\text{-C}_{18}$ дисахариду та $\text{C}_{15}\text{-C}_{27}$ трисахариду.

112. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-11, 23-32, 36-108, 110 або 111, де солібілізуюча група (Sb) являє собою $\text{C}_5\text{-C}_9$ моносахарид.

113. ADC за будь-яким із пп. 1-3, 5, 7-11, 23-32, 36-108 або 110-112, де солубілізуєча група (Sb) являє собою C₅-C₆ моносахарид.

114. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17 або 52-78, де R^{4A} являє собою точку ковалентного приєднання до L.

115. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17 або 52-78, де R^{4A} являє собою C₁-C₆ алкіл, заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) -OR^C;

(iii) -SR^C;

(iv) -NH-S(O₂)R^C;

(v) -OC(=O)R^C;

(vi) -CO₂H;

(vii) C₁-C₆ алкоксикарбонілом;

(viii) -C(=O)NR^{DR^E};

(ix) -NR^{DR^E};

(x) -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺;

(xi) -(феніл)C₁-C₆ алкілом, де C₁-C₆ алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^{DR^E}, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксиллом, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^{DR^E} або -CO₂H;

(xiii) -(5-10-членний гетероарил)C₁-C₆ алкіл, де C₁-C₆ алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^{DR^E}, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, -NR^{DR^E}, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^{DR^E}, -SR^C, (C₁-C₆)алкоксикарбонілом або -CO₂H.

116. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76 або 115, де R^{4A} являє собою C₁-C₆ алкіл, заміщений:

(vi) -CO₂H;

(vii) C₁-C₆ алкоксикарбонілом;

(viii) -C(=O)NR^{DR^E};

(ix) -NR^{DR^E};

(x) -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺;

(xi) -(феніл)C₁-C₆ алкілом, де C₁-C₆ алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^{DR^E}, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксиллом, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^{DR^E} або -CO₂H;

(xiii) -(5-10-членний гетероарил)C₁-C₆ алкіл, де C₁-C₆ алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^{DR^E}, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, -NR^{DR^E}, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^{DR^E}, -SR^C, (C₁-C₆)алкоксикарбонілом або -CO₂H.

117. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17 або 52-76, 115 або 116, де R^{4A} являє собою C₁-C₆ алкіл, заміщений:

(ix) -NR^{DR^E};

(x) -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺;

(xi) -(феніл)C₁-C₆ алкілом, де C₁-C₆ алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^{DR^E}, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксиллом, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^{DR^E} або -CO₂H;

(xiii) -(5-10-членний гетероарил)C₁-C₆ алкіл, де C₁-C₆ алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^{DR^E}, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, -NR^{DR^E}, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^{DR^E}, -SR^C, (C₁-C₆)алкоксикарбонілом або -CO₂H.

118. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76 або 115-117, де R^{4A} являє собою C₁-C₆ алкіл, заміщений -NR^{DR^E}.

119. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76 або 115-117, де R^{4A} являє собою C₁-C₆ алкіл, заміщений -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺.

120. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76 або 115-117, де R^{4A} являє собою C₁-C₆ алкіл, заміщений -(феніл)C₁-C₆ алкілом, де C₁-C₆ алкіл -(феніл)C₁-C₆ алкілу заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^{DR^E}, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

121. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 115-117 або 120, де R^{4A} являє собою C₁-C₃ алкіл, заміщений -(феніл)C₁-C₃ алкілом, де C₁-C₃ алкіл -(феніл)C₁-C₃ алкілу заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^{DR^E}, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

122. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 115-117, 120 або 121, де R^{4A} являє собою C₁-C₃ алкіл, заміщений -(феніл)C₁-C₂ алкілом, де C₁-C₃ алкіл -(феніл)C₁-C₃ алкілу заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^{DR^E}, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

123. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 115-117 або 120-122, де R^{4A} являє собою -CH₂-(феніл)-(C₁-C₂ алкіл), де C₁-C₂ алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^{DR^E} або -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺.

124. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 115-117 або 120-123, де R^{4A} являє собою -CH₂-(феніл)-(C₁-C₂ алкіл), де C₁-C₂ алкіл заміщений -NR^{DR^E} або -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺.

125. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 115-117 або 120-124, де R^{4A} являє собою -CH₂-(феніл)-(C₁-C₂ алкіл), де C₁-C₂ алкіл заміщений -NR^{DR^E}.

126. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 115-117 або 120-124, де R^{4A} являє собою -CH₂-(феніл)-(C₁-C₂ алкіл), де C₁-C₂ алкіл заміщений -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺.

127. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76 або 115-117, де R^{4A} являє собою C₁-C₆ алкіл, заміщений фенілом, заміщеним галогеном, гідроксиллом, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^{DR^E} або -CO₂H.

128. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76 або 115-117, де R^{4A} являє собою -CH₂-феніл, де феніл заміщений галогеном, гідроксиллом, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^{DR^E} або -CO₂H.

129. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76 або 115-117, де R^{4A} являє собою C₁-C₆ алкіл, заміщений -(5-10-членний гетероарил)C₁-C₆ алкілом, де його C₁-C₆ алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^{DR^E}, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

130. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 115-117 або 129, де R^{4A} являє собою C₁-C₃ алкіл, заміщений -(5-10-членний гетероарил)C₁-C₃ алкілом, де C₁-C₃ алкіл -(5-10-членний гетероарил)C₁-C₃ алкілу заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^{DR^E}, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^{DR^E}]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

131. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 115-117, 129 або 130, де R^{4A} являє собою C₁-C₃ алкіл, заміщений -(5-6-членний гетероарил)C₁-C₃ алкілом, де C₁-C₃ алкіл -(5-6-членний гетероарил)C₁-C₃ алкілу заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^{DR^E},

$-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

132. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 115-117 або 129-131, де R^{4A} являє собою $-\text{CH}_2\text{-(5-6-членний гетероарил)-(C}_1\text{-C}_2\text{ алкіл)}$, де $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

133. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 115-117 або 129-132, де R^{4A} являє собою $-\text{CH}_2\text{-(5-6-членний гетероарил)-(C}_1\text{-C}_2\text{ алкіл)}$, де $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкіл заміщений $-\text{NR}^{\text{DRE}}$ або $-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$.

134. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 115-117 або 129-132, де R^{4A} являє собою $-\text{CH}_2\text{-(5-6-членний гетероарил)-(C}_1\text{-C}_2\text{ алкіл)}$, де $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкіл заміщений $-\text{NR}^{\text{DRE}}$.

135. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 115-117 або 129-132, де R^{4A} являє собою $-\text{CH}_2\text{-(5-6-членний гетероарил)-(C}_1\text{-C}_2\text{ алкіл)}$, де $\text{C}_1\text{-C}_2$ алкіл заміщений $-\text{[N(C}_1\text{-C}_6\text{ алкіл)R}^{\text{DRE}}\text{]}^+$.

136. ADC за будь-яким із пп. 131-135, де 5-6-членний гетероарил являє собою піридиніл, піримідиніл або піразиніл.

137. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 116 або 117, де R^{4A} являє собою $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, $-\text{C(=O)NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{SR}^{\text{C}}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{алкоксикарбонілом}$ або $-\text{CO}_2\text{H}$.

138. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 116, 117 або 137, де R^{4A} являє собою $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, $-\text{C(=O)NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{SR}^{\text{C}}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{алкоксикарбонілом}$ або $-\text{CO}_2\text{H}$.

139. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 116, 117, 137 або 138, де R^{4A} являє собою $-\text{CH}_2\text{-(5-10-членний гетероарил)}$, де 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений галогеном, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, $-\text{C(=O)NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{SR}^{\text{C}}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{алкоксикарбонілом}$ або $-\text{CO}_2\text{H}$.

140. ADC за будь-яким із пп. 4, 6, 15, 17, 52-76, 116, 117 або 137-139, де R^{4A} являє собою $-\text{CH}_2\text{-(5-6-членний гетероарил)}$, де 5-6-членний гетероарил необов'язково заміщений галогеном, $-\text{NR}^{\text{DRE}}$, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, $-\text{C(=O)NR}^{\text{DRE}}$, $-\text{SR}^{\text{C}}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{алкоксикарбонілом}$ або $-\text{CO}_2\text{H}$.

141. ADC за п. 140, де 5-6-членний гетероарил являє собою піридиніл, піримідиніл або піразиніл.

142. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46 або 48-141, де R^{5} вибраний із групи, що складається з $-\text{C(=O)OR}^{\text{F}}$, $-\text{C(=O)NR}^{\text{GRH}}$, $-\text{S(O}_2\text{)NR}^{\text{GRH}}$, $-\text{N(R}^{\text{I}}\text{)-C(=O)R}^{\text{J}}$ і $-\text{N(R}^{\text{I}}\text{)-S(O}_2\text{)R}^{\text{K}}$.

143. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46 або 48-141, де R^{5} являє собою $-\text{C(=O)OR}^{\text{F}}$.

144. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46 або 48-143, де R^{F} вибраний із групи, що складається з трифторметилу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкенілу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкінілу, $\text{C}_3\text{-C}_8$ циклоалкілу, арилу, арил($\text{C}_1\text{-C}_6$ алкіл)- і $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алканойлокси, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси та $\text{C}_3\text{-C}_8$ циклоалкілу.

145. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46 або 48-144, де R^{F} обраний із групи, що складається з трифторметилу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкенілу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкінілу, $\text{C}_3\text{-C}_8$ циклоалкілу, арилу, арил($\text{C}_1\text{-C}_6$ алкіл)- та незаміщеного $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілу.

146. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46 або 48-145, де R^{F} вибраний із групи, яка складається з $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкенілу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкінілу і незаміщеного $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілу.

147. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46 або 48-146, де R^{F} являє собою $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкіл.

148. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46 або 48-147, де R^{F} являє собою метил.

149. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46 або 48-134, де R^{F} являє собою гідроген.

150. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46 або 48-141, де R^{5} являє собою $-\text{C(=O)NR}^{\text{GRH}}$.

151. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46 або 48-141, де R^{5} являє собою $-\text{S(O}_2\text{)NR}^{\text{GRH}}$.

152. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46, 48-141, 150 або 151, де кожен R^{G} та R^{H} незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкенілу, $\text{C}_3\text{-C}_8$ циклоалкілу, $\text{C}_3\text{-C}_8$ циклоалкіл($\text{C}_1\text{-C}_6$ алкіл)-, арилу та арил($\text{C}_1\text{-C}_6$ алкіл)-.

153. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46, 48-141 або 150-152, де кожен R^{G} та R^{H} незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілу.

154. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46, 48-141, 150 або 151, де R^{G} і R^{H} , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілами.

155. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46 або 48-142, де R^{5} являє собою $-\text{N(R}^{\text{I}}\text{)-C(=O)R}^{\text{J}}$.

156. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46, 48-141 або 155, де R^{I} та R^{J} незалежно вибрані з групи, що складається з гідрогену та $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілу.

157. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46 або 48-141, де R^{5} являє собою $-\text{N(R}^{\text{I}}\text{)-S(O}_2\text{)R}^{\text{K}}$.

158. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 13-18, 20-35, 37-46 або 48-141, де R^{5} являє собою гідроген.

159. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 23-35, 37-46 або 48-141, де R^{5} має:

i. рка не більше ніж близько 7,0,

ii. дипольний момент щонайменше близько 2,0 дебай або

iii. i. та ii.

160. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 23-35, 37-46, 48-141 або 159, де R^{5} має рка не більше ніж близько 5,0.

161. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 23-35, 37-46, 48-141, 159 або 160, де R^{5} вибраний із групи, що складається з $-\text{C(=O)OH}$, $-\text{NO}_2$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$ і $-\text{S(O}_3\text{)H}$.

162. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 23-35, 37-46, 48-141 або 159-161, де R^{5} являє собою $-\text{C(=O)OH}$.

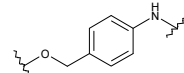
163. ADC за будь-яким із пп. 2-7, 9-11, 23-35, 37-46, 48-141 або 157, де R^{I} та R^{K} незалежно вибрані з групи, що складається з гідрогену та $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілу.

164. ADC за будь-яким із пп. 2-8, 10-11, 13-19, 21-36 або 38-163, де кожен R^{6} незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкенілу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкінілу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алканойлу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алканойлокси, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкоксикарбонілу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галогеналкілу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галогеналкокси і $-\text{NR}^{\text{AR5}}$.

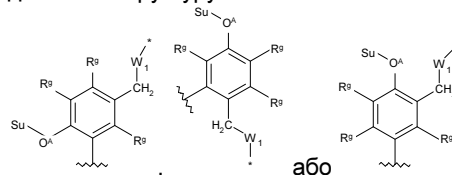
165. ADC за будь-яким із пп. 2-8, 10-11, 13-19, 21-36 або 38-163, де кожен R^{6} незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро та ціано.

166. ADC за будь-яким із пп. 2-8, 10-11, 13-19, 21-36 або 38-163, де нижній індекс m дорівнює 0.
 167. ADC за будь-яким із пп. 2-8, 10-11, 13-19, 21-36 або 38-163, де нижній індекс m дорівнює 1.
 168. ADC за будь-яким із пп. 2-8, 10-11, 13-19, 21-22, 24-36 або 38-163, де нижній індекс m дорівнює 2.
 169. ADC за будь-яким із пп. 2-8, 10-11, 13-19, 21-22, 24-36 або 38-163, де нижній індекс m дорівнює 3.
 170. ADC за будь-яким із пп. 9-11, 20-22, 24-36 або 38-159, де кожен R^{6A} незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 алканолу, C_1-C_6 алканолілокси, C_1-C_6 алкоксикарбонілу, C_1-C_6 галогеналкілу, C_1-C_6 галогеналкокси і $-NR^A R^B$.
 171. ADC за будь-яким із пп. 9-11, 20-22, 24-36, 38-159 або 170, де кожен R^{6A} незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро та ціано.
 172. ADC за будь-яким із пп. 9-11, 20-22, 24-36, 38-159 або 171, де нижній індекс q дорівнює 0.
 173. ADC за будь-яким із пп. 9-11, 20-22, 24-36, 38-159 або 171, де нижній індекс q дорівнює 1.
 174. ADC за будь-яким із пп. 9-11, 20-22, 24-36, 38-159 або 171, де нижній індекс q дорівнює 2.
 175. ADC за будь-яким із пп. 1-37 або 41-174, де кожен R^A і R^B незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C_1-C_6 алкілу.
 176. ADC за будь-яким із пп. 1-37 або 41-175, де кожен R^A і R^B являє собою гідроген.
 177. ADC за будь-яким із пп. 1-37 або 41-175, де кожен R^A і R^B являє собою незалежно вибраний C_1-C_6 алкіл.
 178. ADC за будь-яким із пп. 1-37 або 41-175, де один із R^A і R^B являє собою гідроген, а інший із R^A і R^B являє собою C_1-C_6 алкіл.
 179. ADC за будь-яким із пп. 1-32, 36, 37 або 41-178, де R^C вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C_1-C_{10} алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами.
 180. ADC за будь-яким із пп. 1-32, 36, 37 або 41-179, де R^C вибраний з групи, яка складається з гідрогену, фенілу та C_1-C_{10} алкілу.
 181. ADC за будь-яким із пп. 1-32, 36, 37 або 41-180, де R^C вибраний з групи, яка складається з гідрогену та C_1-C_{10} алкілу.
 182. ADC за будь-яким із пп. 1-32, 36, 37 або 41-181, де R^C являє собою гідроген.
 183. ADC за будь-яким із пп. 1-32, 36, 37 або 41-181, де R^C являє собою C_1-C_{10} алкіл.
 184. ADC за будь-яким із пп. 1-41 або 45-183, де кожен R^D і R^E незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_3-C_8 циклоалкілу, C_3-C_8 циклоалкіл(C_1-C_6 алкіл)-, арилу та арил(C_1-C_6 алкіл)-.
 185. ADC за будь-яким із пп. 1-41 або 45-184, де кожен R^D і R^E незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C_1-C_6 алкілу.
 186. ADC за будь-яким із пп. 1-41 або 45-183, де R^D і R^E , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами.
 187. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-186, де нижній індекс x дорівнює 1.

188. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-187, де X являє собою C_1-C_6 алкілен.
 189. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-188, де X являє собою C_1-C_3 алкілен.
 190. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-187, де X являє собою 3-6-членний гетероалкілен.
 191. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-187 або 190, де X являє собою 3-4-членний гетероалкілен.
 192. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-186, де нижній індекс x дорівнює 0.
 193. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-192, де нижній індекс y дорівнює 1.
 194. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-193, де Y являє собою самознищений фрагмент.
 195. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-191 або



194, де Y являє собою
 196. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-191 або 194, де Y являє собою нерозщеплюваний фрагмент.
 197. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-196, де Y являє собою циклогексанкарбоксілну, ундеканоліну, капроліну, гексаноліну, бутаноліну або пропіонілу групу.
 198. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-191 або 194, де Y являє собою ПЕГ4 - ПЕГ12.
 199. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-198, де нижній індекс u дорівнює 0.
 200. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-199, де нижній індекс w дорівнює 1.
 201. Сполука за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-200, де W становить 6-12 амінокислот.
 202. Сполука за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-201, де W становить 6-6 амінокислот.
 203. Сполука за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-202, де кожна амінокислота W незалежно вибрана з групи, що складається з аланіну, гліцину, лізину, серину, аспарагінової кислоти, метилового естеру аспартату, N,N -диметиллізину, фенілаланіну, цитруліну, валіну-аланіну, валіну-цитруліну, фенілаланіну-лізину та метилового естеру гомосерину.
 204. Сполука за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-200, де W має структуру:



де Su являє собою цукровий фрагмент;
 $-O^A-$ представляє атом оксигену або глікозидний зв'язок;
 кожен R^9 незалежно являє собою гідроген, галоген, C_1-C_6 алкокси, $-N(C_1-C_6 \text{ алкіл})_2$, $-NHC(=O)(C_1-C_6 \text{ алкіл})$, $-CN$, $-CF_3$, ацил, карбоксамідо, C_1-C_6 алкіл або $-NO_2$;
 W^1 відсутній, являє собою $*-C(=O)-O-$ або $*-O-C(=O)-$;
 \sim представляє ковалентне приєднання до A або M ; і
 $*$ представляє ковалентне приєднання до X , Y або D .
 205. Сполука за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-200 або 204, де W^1 відсутній.
 206. Сполука за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-200 або 204, де W^1 являє собою $*-C(=O)-O-$.
 207. Сполука за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-200 або 204, де W^1 являє собою $*-O-C(=O)-$.

208. Сполука за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-200 або 204-207, де один R^9 являє собою галоген, C_1 - C_6 алкокси, $-N(C_1-C_6 \text{ алкіл})_2$, $-NHC(=O)(C_1-C_6 \text{ алкіл})$, $-CN$, $-CF_3$, ацил, карбоксамід, C_1 - C_6 алкіл або $-NO_2$, а решта R^9 являють собою водень.

209. Сполука за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-200 або 204-207, де кожен R^9 являє собою водень.

210. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-209, де нижній індекс w дорівнює 0.

211. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-210, де нижній індекс a дорівнює 1.

212. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-211, де A являє собою C_{2-20} алкілен, необов'язково заміщений 1-4 R^{a1} .

213. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-211, де A являє собою C_{4-10} алкілен, необов'язково заміщений 1-4 R^{a1} .

214. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-212, де A являє собою C_{2-20} алкілен, заміщений одним R^{a1} .

215. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-213, де A являє собою C_{4-10} алкілен, заміщений одним R^{a1} .

216. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-212, де A являє собою C_{2-20} алкілен.

217. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-211, де A являє собою C_{4-10} алкілен.

218. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22 або 24-211, де A являє собою 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-4 R^{b1} .

219. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-211 або 218, де A являє собою 4-12-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-4 R^{b1} .

220. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-211, 218 або 219, де A являє собою 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений одним R^{b1} .

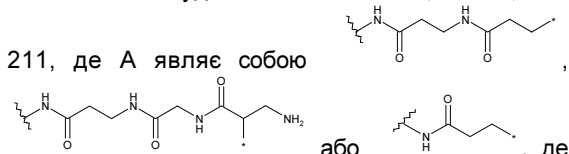
221. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-211 або 218-220, де A являє собою 4-12-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений одним R^{b1} .

222. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-211 або 218, де A являє собою 2-40-членний гетероалкілен.

223. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-211, 218 або 222, де A являє собою 4-12-членний гетероалкілен.

224. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-

211, де A являє собою



представляє ковалентне приєднання до W , а $*$ представляє ковалентний зв'язок із M .

225. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-210, де нижній індекс a дорівнює 0.

226. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-225, де L заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72.

227. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-224 або 226, де A заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72.

228. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-225, де L не заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72.

229. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-228, де M являє собою сукцинімід.

230. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-228, де M являє собою гідролізований сукцинімід.

231. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-228, де M являє собою амід.

232. ADC за будь-яким із пп. 5-11, 16-22, 24-228, де M являє собою триазол.

233. ADC за будь-яким із пп. 1-232, де антитіло являє собою гуманізоване антитіло.

234. ADC за будь-яким із пп. 1-233, де антитіло являє собою моноклональне антитіло.

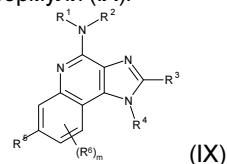
235. ADC за будь-яким із пп. 1-234, де антитіло є фукозилізованим.

236. ADC за будь-яким із пп. 1-235, де антитіло є афукозилізованим.

237. Композиція, що характеризується розподілом ADC за будь-яким із пп. 1-236 або їх фармацевтично прийнятної солі.

238. Фармацевтична композиція за п. 237, яка містить щонайменше один фармацевтично прийнятний носій.

239. Сполука формули (IX):



або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

R^1 вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_1 - C_6 алкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_1 - C_6 алканолу, C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, C_1 - C_6 алкокситіокарбонілу, C_1 - C_6 карбамолу, C_1 - C_6 амідину, C_1 - C_6 сульфону, C_1 - C_6 тіону, C_3 - C_6 циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_1 - C_6 алканол, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алкокситіокарбоніл, C_1 - C_6 карбамол, C_1 - C_6 амідин, C_1 - C_6 сульфон, C_1 - C_6 тіон, C_3 - C_6 циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C_3 - C_8 циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 алкілію та $-NR^A R^B$;

R^2 вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_1 - C_6 алкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_1 - C_6 алканолу, C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, C_3 - C_6 циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_1 - C_6 алканол, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_3 - C_6 циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C_3 - C_8 циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 алкілію та $-NR^A R^B$; або

R^1 і R^2 , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1 - C_6 алкілами;

R^3 вибраний із групи, що складається з гідрогену, $-NR^A R^B$, $-C(=O)NR^A R^B$, C_1 - C_6 алкілу, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_1 - C_6 алканолу, C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, C_1 - C_6 алканоліокси, C_3 - C_6 циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_1 - C_6 алканол, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл, C_1 - C_6 алканоліокси, C_3 - C_6 циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними

ми з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтію та -NR^AR^B; R⁴ являє собою (a) -OR^C; (b) -S(=O)₂R^C; (c) -C(=O)NR^DR^E; (d) -C(=O)OR^C; (e) -C(=O)SR^C; (f) -C(=S)R^C; (g) -PO₃R^C; або (h) C₁-C₆ алкіл, необов'язково заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) -OR^C;

(iii) -SR^C;

(iv) -NH-S(O₂)R^C;

(v) -OC(=O)R^C;

(vi) -CO₂H;

(vii) C₁-C₆ алкоксикарбонілом;

(viii) -C(=O)NR^DR^E;

(ix) -NR^DR^E;

(x) -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺;

(xi) -(феніл)C₁-C₆ алкілом, де C₁-C₆ алкіл заміщений 5-10-членним гетероариллом, -NR^DR^E, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщеним галогеном, гідроксиллом, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^DR^E або -CO₂H;

(xiii) -(5-10-членний гетероарил)C₁-C₆ алкіл, де C₁-C₆ алкіл, заміщений 5-10-членним гетероариллом, -NR^DR^E, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероариллом, необов'язково заміщеним галогеном, -NR^DR^E, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^DR^E або -CO₂H;

R⁵ вибраний із групи, що складається з гідрогену, -C(=O)OR^F, -NO₂, -CN, -CF₃-C(=O)NR^GR^H, -S(O₂)NR^GR^H, -N(R^I)-C(=O)R^J, -N(R^I)-S(O₂)R^K і SO₃R^K;

кожен R⁶ незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алканоліокси, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ галогеналкілу, C₁-C₆ галогеналкокси і -NR^AR^B;

нижній індекс m дорівнює 0, 1, 2 або 3;

кожен R^A та R^B незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C₁-C₆ алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

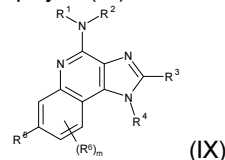
R^C вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C₁-C₁₀ алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен R^D, R^E, R^G та R^H незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₃-C₈ циклоалкілу, C₃-C₈ циклоалкіл(C₁-C₆ алкіл)-, арилу та арил(C₁-C₆ алкіл)-; або R^D та R^E або R^G та R^H разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R^F вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₃-C₈ циклоалкілу, арилу, арил(C₁-C₆ алкіл)- і C₁-C₆ алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C₁-C₆ алканоліокси, C₁-C₆ алкокси та C₃-C₈ циклоалкілу; кожен R^I, R^J і R^K незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і C₁-C₆ алкілу;

де R^F являє собою трифторметил, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₃-C₈ циклоалкіл, арил, арил(C₁-C₆ ал-

кіл)- або C₁-C₆ алкіл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C₁-C₆ алканоліокси, C₁-C₆ алкокси та C₃-C₈ циклоалкілу; R⁴ являє собою -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺; -(феніл)C₁-C₆ алкіл, де C₁-C₆ алкіл заміщений -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺; або -(5-10-членний гетероарил)C₁-C₆ алкіл, де C₁-C₆ алкіл заміщений -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺; i кожен R¹ та R⁴ необов'язково заміщений солюбілізуючою групою (S_b) вибраною з групи, що складається з фосфорилу, сульфурілу, нітро, C₅-C₉ моносахариду, C₁₀-C₁₈ дисахариду та C₁₅-C₂₇ трисахариду.

240. Сполука формули (IX):



(IX)

або його фармацевтично прийнятна сіль;

де:

R¹ вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканол, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтію та -NR^AR^B;

R² вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканол, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтію та -NR^AR^B; або

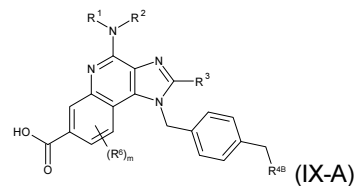
R¹ і R², разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R³ вибраний із групи, що складається з гідрогену, -NR^AR^B, -C(=O)NR^AR^B, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканолу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ алканоліокси, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканол, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₁-C₆ алканоліокси, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтію та -NR^AR^B;

R⁴ являє собою (a) -OR^C або (b) C₁-C₆ алкіл, заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;
(ii) $-OR^C$;
(iii) $-SR^C$;
(iv) $-NH-S(O_2)R^C$;
(v) $-OC(=O)R^C$;
(vi) $-CO_2H$;
(vii) C_1-C_6 алкоксикарбонілом;
(viii) $-C(=O)NR^{D,E}$;
(ix) $-NR^{D,E}$;
(x) $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^{D,E}]^+$;
(xi) $-(\text{феніл})C_1-C_6$ алкілом, де C_1-C_6 алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^{D,E}$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^{D,E}]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;
(xii) феніл, заміщеним галогеном, гідроксилом, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^{D,E}$ або $-CO_2H$;
(xiii) $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_1-C_6$ алкіл, де C_1-C_6 алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^{D,E}$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^{D,E}]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або
(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, $-NR^{D,E}$, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^{D,E}$ або $-CO_2H$;
 R^5 являє собою $-C(=O)OR^F$;
кожен R^6 незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 алканойлу, C_1-C_6 алканойлокси, C_1-C_6 алкоксикарбонілу, C_1-C_6 галогеналкілу, C_1-C_6 галогеналкокси і $-NR^A R^B$;
нижній індекс m дорівнює 0, 1, 2 або 3;
кожен R^A та R^B незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C_1-C_6 алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикліт, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами;
 R^C вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C_1-C_{10} алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами;
кожен R^D , R^E , R^G та R^H незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_3-C_8 циклоалкілу, C_3-C_8 циклоалкіл(C_1-C_6 алкіл)-, арилу та арил(C_1-C_6 алкіл)-; або R^D та R^E або R^G та R^H разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикліт, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами;
 R^F вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_3-C_8 циклоалкілу, арилу, арил(C_1-C_6 алкіл)- і C_1-C_6 алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C_1-C_6 алканойлокси, C_1-C_6 алкокси та C_3-C_8 циклоалкілу;
кожен R^I , R^J і R^K незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і C_1-C_6 алкілу; і
де R^F являє собою трифторметил, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_3-C_8 циклоалкіл, арил, арил(C_1-C_6 алкіл)- або C_1-C_6 алкіл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C_1-C_6 алканойлокси, C_1-C_6 алкокси та C_3-C_8 циклоалкілу; R^4 є $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^{D,E}]^+$; $-(\text{феніл})C_1-C_6$ алкіл, де C_1-C_6 алкіл заміщений $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^{D,E}]^+$; або $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_1-C_6$ алкіл, де C_1-C_6 алкіл заміщений $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^{D,E}]^+$.

241. Сполука за будь-яким із п. 239 або п. 240, де сполука має структуру формули (IX-A):



або її фармацевтично прийнятна сіль, де:

R^1 вибраний з групи, яка складається з гідрогену та C_1-C_6 алкілу;

R^2 вибраний з групи, яка складається з гідрогену та C_1-C_6 алкілу; або

R^1 і R^2 , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами;

R^3 вибраний із групи, що складається з гідрогену та C_1-C_6 алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C_1-C_6 алкокси та C_1-C_6 алкілтію;

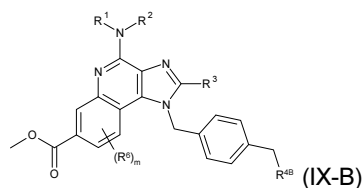
R^{4B} вибраний із групи, що складається з 5-10-членного гетероарилу, $-NR^{D,E}$ і $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^{D,E}]^+$;

R^6 незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 алканойлу, C_1-C_6 алканойлокси, C_1-C_6 алкоксикарбонілу, C_1-C_6 галогеналкілу, C_1-C_6 галогеналкокси;

нижній індекс m дорівнює 0 або 1; і

R^D і R^E незалежно вибрані з групи, що складається з гідрогену, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_3-C_8 циклоалкілу, C_3-C_8 циклоалкіл(C_1-C_6 алкіл)-, арилу та арил(C_1-C_6 алкіл)-; або R^D і R^E разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикліт, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами.

242. Сполука за будь-яким із п. 239 або п. 240, де сполука має структуру формули (IX-B):



або її фармацевтично прийнятна сіль; де:

R^1 вибраний з групи, яка складається з гідрогену та C_1-C_6 алкілу;

R^2 вибраний з групи, яка складається з гідрогену та C_1-C_6 алкілу; або

R^1 і R^2 , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами;

R^3 вибраний із групи, що складається з гідрогену та C_1-C_6 алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C_1-C_6 алкокси та C_1-C_6 алкілтію;

R^{4B} вибраний із групи, що складається з 5-10-членного гетероарилу, $-NR^D R^E$ і $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$; R^6 вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 алканолу, C_1-C_6 алканолі, C_1-C_6 алкоксикарбонілу, C_1-C_6 галогеналкілу, C_1-C_6 галогеналкокси; нижній індекс m дорівнює 0 або 1; і R^D і R^E незалежно вибрані з групи, що складається з гідрогену, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_3-C_8 циклоалкілу, C_3-C_8 циклоалкіл(C_1-C_6 алкіл)-, арилу та арил(C_1-C_6 алкіл)-; або R^D і R^E разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами.

243. Сполука за будь-яким із пп. 239-242, де кожен із R^1 і R^2 являє собою незалежно вибраний C_1-C_6 алкіл.

244. Сполука за будь-яким із пп. 239-243, де R^1 і R^2 обидва являють собою метил.

245. Сполука за будь-яким із пп. 239-242, де один із R^1 і R^2 являє собою гідроген, а інший із R^1 і R^2 являє собою C_1-C_6 алкіл.

246. Сполука за будь-яким із пп. 239-245, де один із R^1 і R^2 являє собою гідроген, а інший із R^1 і R^2 являє собою метил.

247. Сполука за будь-яким із пп. 239-242, де R^1 і R^2 обидва являють собою гідроген.

248. Сполука за будь-яким із пп. 239-242, де R^1 і R^2 , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами.

249. Сполука за будь-яким із пп. 239-248, де R^3 являє собою C_1-C_6 алкіл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C_1-C_6 алкокси і C_1-C_6 алкілтію.

250. Сполука за будь-яким із пп. 239-249, де R^3 являє собою C_1-C_6 алкіл, заміщений одним замісником, вибраним із групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C_1-C_6 алкокси і C_1-C_6 алкілтію.

251. Сполука за будь-яким із пп. 239-250, де R^3 являє собою C_1-C_6 алкіл, заміщений одним замісником, вибраним із групи, що складається з гідроксилу і C_1-C_6 алкокси.

252. Сполука за будь-яким із пп. 239-249, де R^3 являє собою незаміщений C_1-C_6 алкіл.

253. Сполука за будь-яким із пп. 239-249 або 252, де R^3 являє собою n -бутил.

254. Сполука за будь-яким із пп. 239-252, де R^3 являє собою гідроген.

255. Сполука за будь-яким із пп. 239-254, де R^{4B} являє собою $-NR^D R^E$.

256. Сполука за будь-яким із пп. 239-254, де R^{4B} являє собою $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^D R^E]^+$.

257. Сполука за будь-яким із пп. 239-256, де R^D і R^E незалежно вибрані із групи, що складається з гідрогену, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_3-C_8 циклоалкілу, C_3-C_8 циклоалкіл(C_1-C_6 алкіл)-, арилу та арил(C_1-C_6 алкіл)-.

258. Сполука за будь-яким із пп. 239-257, де R^D і R^E незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_1-C_6 алкілу і C_2-C_6 алкенілу.

259. Сполука за будь-яким із пп. 239-258, де кожен із R^D і R^E являє собою незалежно вибраний C_1-C_6 алкіл.

260. Сполука за будь-яким із пп. 239-259, де R^D і R^E обидва являють собою метил.

261. Сполука за будь-яким із пп. 239-258, де один із R^D і R^E являє собою гідроген, а інший із R^D і R^E являє собою C_1-C_6 алкіл.

262. Сполука за будь-яким із пп. 239-258 або 261, де один із R^D і R^E являє собою гідроген, а інший із R^D і R^E являє собою метил.

263. Сполука за будь-яким із пп. 239-258, де R^D і R^E обидва являють гідроген.

264. Сполука за будь-яким із пп. 239-257, де R^D і R^E , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами.

265. Сполука за будь-яким із пп. 239-254, де R^{4B} являє собою 5-10-членний гетероарил.

266. Сполука за будь-яким із пп. 239-265, де нижній індекс m дорівнює 1.

267. Сполука за будь-яким із пп. 239-266, де R^6 вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C_1-C_6 алкілу, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 галогеналкілу і C_1-C_6 галогеналкокси.

268. Сполука за будь-яким із пп. 239-267, де R^6 вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро та ціано.

269. Сполука за будь-яким із пп. 239-265, де нижній індекс m дорівнює 0.

270. Композиція, що містить сполуку за будь-яким із пп. 239-269 або її фармацевтично прийнятну сіль.

271. ADC за будь-яким із пп. 1-236 або його фармацевтично прийнятна сіль; або сполука за будь-яким із пп. 239-269 або її фармацевтично прийнятна сіль для застосування у лікуванні раку у суб'єкта, який потребує цього.

272. Композиція за п. 237, 238 або 270 для застосування у лікуванні раку у суб'єкта, який потребує цього.

273. Спосіб індукції протипухлинної імунної відповіді у суб'єкта, який цього потребує, що включає введення суб'єкту ефективної кількості ADC за будь-яким із пп. 1-236 або його фармацевтично прийнятної солі; або терапевтично ефективної кількості сполуки за будь-яким із пп. 239-269 або її фармацевтично прийнятної солі.

274. Спосіб індукції протипухлинної імунної відповіді у суб'єкта, який потребує цього, що включає введення суб'єкту терапевтично ефективної кількості композиції за пп. 237, 238 або 270.

275. ADC або сполука, або композиція для застосування за п. 271, або спосіб за будь-яким із пп. 273-274, в якому антитіло ADC націлене на поверхневий антиген клітини, і при цьому ADC сконструйований з можливістю інтерналізації в клітині після зв'язування антитіла з поверхневим антигеном.

276. ADC або сполука, або композиція для застосування за п. 271, або спосіб за будь-яким із пп. 273-275, в якому антитіло (Ab) ADC націлене на антиген пухлиноасоційованого макрофагу.

277. ADC або сполука, або композиція для застосування за п. 271, або спосіб за будь-яким із пп. 273-

що складається з гідрогену та C₁-C₆ алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами; при цьому тільки один з R^A та R^B являє собою точку ковалентного приєднання до L¹;

R^C (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L¹; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C₁-C₁₀ алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

кожен R^D, R^E, R^G та R^H (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L¹; або (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₃-C₈ циклоалкілу, C₃-C₈ циклоалкіл(C₁-C₆ алкіл)-, арилу та арил(C₁-C₆ алкіл)-; або R^D та R^E або R^G та R^H разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами; при цьому тільки один із R^D, R^E, R^G та R^H являє собою точку ковалентного приєднання до L¹;

R^F (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L¹; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₃-C₈ циклоалкілу, арилу, арил(C₁-C₆ алкіл)- і C₁-C₆ алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C₁-C₆ алканойлокси, C₁-C₆ алкокси та C₃-C₈ циклоалкілу;

кожен R^I, R^J та R^K (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L¹; або (b) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C₁-C₆ алкілу; при цьому тільки один з R^I, R^J та R^K являє собою точку ковалентного приєднання до L¹;

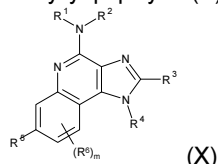
кожен R¹ та R⁴ необов'язково заміщений солубілізуючою групою (S_b) вибраною з групи, що складається з фосфору, сульфурілу, нітро, C₅-C₉ моносахариду, C₁₀-C₁₈ дисахариду та C₁₅-C₂₇ трисахариду; при цьому тільки один із R¹, R², R³, R⁴, R⁵ R^A, R^B, R^C, R^D, R^E, R^F, R^G, R^H, R^I, R^J і R^K являє собою точку ковалентного приєднання до L¹; і

при цьому формула (X) має тільки одну точку ковалентного приєднання до L¹.

283. Сполука, яка має формулу L¹-D, або її фармацевтично прийнятна сіль, де:

L¹ являє собою проміжну лінкерну сполуку; і

D являє собою сполуку формули (X):



або її фармацевтично прийнятної солі;

де:

R¹ (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L¹; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканойлу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканойл, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'яз-

ково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілію та -NR^AR^B;

R² (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L¹; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканойлу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканойл, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілію та -NR^AR^B; або

R¹ і R², разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R³ (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L¹; або (b) вибраний із групи, що складається з гідрогену, -NR^AR^B, -C(=O)NR^AR^B, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканойлу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ алканойлокси, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканойл, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₁-C₆ алканойлокси, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілію та -NR^AR^B;

R⁴ являє собою (a) точку ковалентного приєднання L¹; (b) -OR^C; або (c) C₁-C₆ алкіл, заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) -OR^C;

(iii) -SR^C;

(iv) -NH-S(O₂)R^C;

(v) -OC(=O)R^C;

(vi) -CO₂H;

(vii) C₁-C₆ алкоксикарбонілом;

(viii) -C(=O)NR^DR^E;

(ix) -NR^DR^E;

(x) -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺;

(xi) -(феніл)C₁-C₆ алкілом, де C₁-C₆ алкіл заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^DR^E, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксилом, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^DR^E або -CO₂H;

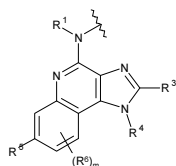
(xiii) -(5-10-членний гетероарил)C₁-C₆ алкіл, де C₁-C₆ алкіл, заміщений 5-10-членним гетероарилом, -NR^DR^E, -[N(C₁-C₆ алкіл)R^DR^E]⁺ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщеним галогеном, -NR^DR^E, C₁-C₆ алкокси, -C(=O)NR^DR^E, -SR^C, (C₁-C₆)алкоксикарбонілом або -CO₂H;

R⁵ (a) являє собою точку ковалентного приєднання до L¹; або (b) вибраний із групи, що складається з

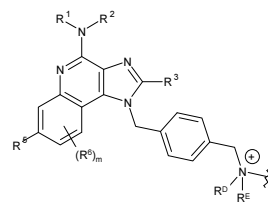
гідрогену, $-C(=O)OR^F$, $-NO_2$, $-CN$, $-CF_3-C(=O)NR^GR^H$, $-S(O_2)NR^GR^H$, $-N(R^I)-C(=O)R^J$, $-N(R^I)-S(O_2)R^K$ і SO_3R^K ; кожен R^6 (а) являє собою точку ковалентного приєднання до L^1 ; або (б) незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 алканолу, C_1-C_6 алканоліокси, C_1-C_6 алкоксикарбонілу, C_1-C_6 галогеналкілу, C_1-C_6 галогеналкокси та $-NR^AR^B$; при цьому не більше одного R^6 являє собою точку ковалентного приєднання до L^1 .
при цьому коли R^4 являє собою (с), C_1-C_6 алкіл або його замісник можуть бути додатково заміщені точкою ковалентного приєднання до L^1 ;
нижній індекс m дорівнює 0, 1, 2 або 3;
кожен R^A та R^B (а) являє собою точку ковалентного приєднання до L^1 , (б) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C_1-C_6 алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами; при цьому тільки один з R^A та R^B являє собою точку ковалентного приєднання до L^1 ;
 R^C (а) являє собою точку ковалентного приєднання до L^1 ; або (б) вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C_1-C_{10} алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами;
кожен R^D , R^E , R^G та R^H (а) являє собою точку ковалентного приєднання до L^1 ; або (б) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C_1-C_6 алкілу, C_2-C_6 алкенілу, C_3-C_8 циклоалкілу, C_3-C_8 циклоалкіл(C_1-C_6 алкіл)-, арилу та арил(C_1-C_6 алкіл)-; або R^D та R^E або R^G та R^H разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероциклі, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_1-C_6 алкілами; при цьому тільки один із R^D , R^E , R^G та R^H являє собою точку ковалентного приєднання до L^1 ;
 R^F (а) являє собою точку ковалентного приєднання до L^1 ; або (б) вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C_2-C_6 алкенілу, C_2-C_6 алкінілу, C_3-C_8 циклоалкілу, арилу, арил(C_1-C_6 алкіл)- і C_1-C_6 алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C_1-C_6 алканоліокси, C_1-C_6 алкокси та C_3-C_8 циклоалкілу;
кожен R^I , R^J та R^K (а) являє собою точку ковалентного приєднання до L^1 ; або (б) незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C_1-C_6 алкілу; при цьому тільки один з R^I , R^J та R^K являє собою точку ковалентного приєднання до L^1 ;
при цьому тільки один із R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^A , R^B , R^C , R^D , R^E , R^G , R^H , R^I , R^J і R^K являє собою точку ковалентного приєднання до L^1 ; і
при цьому формула (X) має тільки одну точку ковалентного приєднання до L^1 .

284. Сполука за п. 282 або п. 283, що має структуру:



або її фармацевтично прийнятна сіль; де: ~~~~ представляє ковалентне приєднання до L^1 .

285. Сполука за п. 284, що має структуру:



або її фармацевтично прийнятна сіль; де: ~~~~ представляє ковалентне приєднання до L^1 .

286. Сполука за будь-яким із пп. 282-285, де R^5 являє собою $-C(=O)OR^F$.

287. Сполука за будь-яким із пп. 282-286, де R^F являє собою C_1-C_6 алкіл.

288. Сполука за будь-яким із пп. 282-287, де R^F являє собою метил.

289. Сполука за будь-яким із пп. 282-286, де R^F являє собою гідроген.

290. Сполука за будь-яким із пп. 282-289, де нижній індекс m дорівнює 0.

291. Сполука за будь-яким із пп. 282-290, де R^3 являє собою C_1-C_6 алкіл.

292. Сполука за будь-яким із пп. 282-291, де R^3 являє собою н-бутил.

293. Сполука за будь-яким із пп. 282-292, де R^1 являє собою гідроген або C_1-C_6 алкіл.

294. Сполука за будь-яким із пп. 282-293, де R^1 являє собою гідроген або метил.

295. Сполука за будь-яким із пп. 282-294, де R^1 являє собою гідроген.

296. Сполука за будь-яким із пп. 282, 283 або 285-295, де R^2 являє собою гідроген або C_1-C_6 алкіл.

297. Сполука за будь-яким із пп. 282, 283 або 285-296, де R^2 являє собою гідроген або метил.

298. Сполука за будь-яким із пп. 282, 283 або 285-297, де R^2 являє собою гідроген.

299. Сполука за будь-яким із пп. 282, 283 або 285-298, де R^4 являє собою C_1-C_6 алкіл, заміщений:

(i) 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(ii) $-OR^C$;

(iii) $-SR^C$;

(iv) $-NH-S(O_2)R^C$;

(v) $-OC(=O)R^C$;

(vi) $-CO_2H$;

(vii) C_1-C_6 алкоксикарбонілом;

(viii) $-C(=O)NR^DR^E$;

(ix) $-NR^DR^E$;

(x) $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^DR^E]^+$;

(xi) $-(\text{феніл})C_1-C_6$ алкілом, де C_1-C_6 алкіл заміщений 5-10-членним гетероариллом, $-NR^DR^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^DR^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;

(xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксиллом, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^DR^E$ або $-CO_2H$;

(xiii) $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_1-C_6$ алкіл, де C_1-C_6 алкіл, заміщений 5-10-членним гетероариллом, $-NR^DR^E$, $-[N(C_1-C_6 \text{ алкіл})R^DR^E]^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або

(xiv) 5-10-членним гетероариллом, необов'язково заміщеним галогеном, $-NR^DR^E$, C_1-C_6 алкокси, $-C(=O)NR^DR^E$, $-SR^C$, (C_1-C_6) алкоксикарбонілом або $-CO_2H$.

300. Сполука за будь-яким із пп. 282-284 або 286-299, де R^4 являє собою C_1-C_6 алкіл, заміщений:

(ix) $-NR^DR^E$;

(x) $-\{N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^{DR^E}\}^+$;
 (xi) $-(\text{феніл})C_{1-6} \text{ алкілом}$, де $C_{1-6} \text{ алкіл}$ заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^{DR^E}$, $-\{N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^{DR^E}\}^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами;
 (xii) феніл, заміщений галогеном, гідроксилом, C_{1-6} алкокси, $-C(=O)NR^{DR^E}$ або $-CO_2H$;
 (xiii) $-(5-10\text{-членний гетероарил})C_{1-6} \text{ алкіл}$, де $C_{1-6} \text{ алкіл}$, заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^{DR^E}$, $-\{N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^{DR^E}\}^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами; або
 (xiv) 5-10-членним гетероарилом, необов'язково заміщений галогеном, $-NR^{DR^E}$, C_{1-6} алкокси, $-C(=O)NR^{DR^E}$, $-SR^C$, $(C_{1-6})\text{алкоксикарбонілом}$ або $-CO_2H$.

301. Сполука за будь-яким із пп. 282-284 або 286-300, де R^4 являє собою C_{1-6} алкіл, заміщений:

(ix) $-NR^{DR^E}$;

(x) $-\{N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^{DR^E}\}^+$; або

(xi) $-(\text{феніл})C_{1-6} \text{ алкілом}$, де $C_{1-6} \text{ алкіл}$ заміщений 5-10-членним гетероарилом, $-NR^{DR^E}$, $-\{N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^{DR^E}\}^+$ або 1-3 незалежно вибраними галогенами.

302. Сполука за будь-яким із пп. 282-284 або 286-301, де R^4 являє собою C_{1-6} алкіл, заміщений: $-NR^{DR^E}$.

303. Сполука за будь-яким із пп. 282-284 або 286-301, де R^4 являє собою C_{1-6} алкіл, заміщений $-\{N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^{DR^E}\}^+$.

304. Сполука за будь-яким із пп. 282-284 або 286-301, де R^4 являє собою C_{1-6} алкіл, заміщений: $-(\text{феніл})C_{1-6} \text{ алкілом}$, де $C_{1-6} \text{ алкіл}$ заміщений $-NR^{DR^E}$ або $-\{N(C_{1-6} \text{ алкіл})R^{DR^E}\}^+$.

305. Сполука за будь-яким із пп. 282-284 або 286-298, де R^4 являє собою точку ковалентного приєднання до L^1 .

306. Сполука за будь-яким із пп. 282-305, де кожен із R^D і R^E незалежно являють собою C_{1-6} алкіл.

307. Сполука за будь-яким із пп. 282-306, де R^D і R^E обидва являють метил. Сполука за будь-яким із пп. 282-308, де R^D і R^E , разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C_{1-6} алкілами.

308. Сполука за будь-яким із пп. 282-305 або 307, де R^D і R^E разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють незаміщений 3-6-членний гетероцикл.

309. Сполука за будь-яким із пп. 282-308, де L^1 має формулу $M^1-(A)_a-(W)_w-(Y)_y-(X)_x$;
 нижній індекс а дорівнює 0 або 1;
 нижній індекс у дорівнює 0 або 1;
 нижній індекс w дорівнює 0 або 1;
 нижній індекс x дорівнює 0 або 1;
 де сума нижнього індексу а, нижнього індексу у, нижнього індексу w і нижнього індексу x більша або дорівнює 1;

M^1 являє собою малеїмідо, ази́до, C_{1-6} алкініл, циклоалкініл, необов'язково заміщений 1 або 2 фторами (наприклад, циклооктиніл або DIFO), сульфідрил, сукцинімідолові естери (наприклад, N-гідроксисукцинімідолові (NHS) або сульфо-NHS естери), 4-нітрофенілові естери, пентафторфенілові естери, тетрафторфенілові етери, ангідриди, кислі хлориди, сульфонілхлориди, ізоціанати, ізотіоціанати, альфа-галогенкетони, альфа-О-сульфонат (наприклад, метил або тозил) кетони, алкілгідазини, гідазиди і гідроксиламіни;

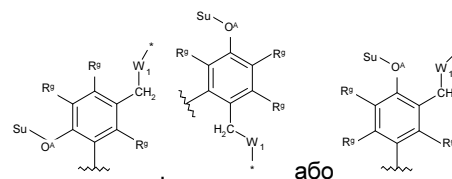
А являє собою C_{2-20} алкілен необов'язково заміщений 1-3 R^{a1} ; або 2-40-членний гетероалкілен, необов'язково заміщений 1-3 R^{b1} ;

кожен R^{a1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} галогеналкокси, галогену, $-OH$, $=O$, $-NR^{d1}R^{e1}$, $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$ і $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$;

кожен R^{b1} незалежно вибраний із групи, яка складається з: C_{1-6} алкілу, C_{1-6} галогеналкілу, C_{1-6} алкокси, C_{1-6} галогеналкокси, галогену, $-OH$, $-NR^{d1}R^{e1}$, $-(C_{1-6} \text{ алкілен})-NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)NR^{d1}R^{e1}$, $-C(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$ і $-C(=O)O(C_{1-6} \text{ алкіл})$;

кожен R^{d1} і R^{e1} незалежно являє собою гідроген або C_{1-3} алкіл;

W складається з 1-12 амінокислот або має структуру:



де Su являє собою цукровий фрагмент;

$-O^A$ представляє атом оксигену або глікозидний зв'язок;

кожен R^a незалежно являє собою гідроген, галоген, C_{1-6} алкокси, $-N(C_{1-6} \text{ алкіл})_2$, $-NHC(=O)(C_{1-6} \text{ алкіл})$, $-CN$, $-CF_3$, ацил, карбоксамідо, C_{1-6} алкіл або $-NO_2$;
 W^1 відсутній, являє собою $*C(=O)-O-$ або $*O-C(=O)-$;

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до А або М;

\* представляє ковалентне приєднання до X, Y або D;  
 Y являє собою самознищений фрагмент, несамознищений фрагмент, що вивільняється, або нерозщеплюваний фрагмент;

X являє собою  $C_{1-6}$  алкілен або 3-6-членний гетероалкілен;

L необов'язково заміщений ПЕГ-ланкою від ПЕГ1 до ПЕГ72.

310. Кон'югат антитіло - лікарський препарат (ADC) що має структуру:

$Ab-(L-D)_p$

або її фармацевтично прийнятна сіль;

де:

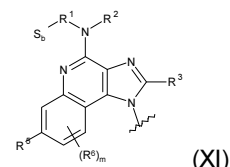
Ab являє собою антитіло;

де кожен D кон'югований з лінкером (L);

де кожен L ковалентно приєднаний до Ab за допомогою атома сірки залишку цистеїну або  $\epsilon$ -аміногрупи залишку лізину;

нижній індекс p являє собою ціле число від 1 до 16;

кожен D має структуру формули (XI):



або її фармацевтично прийнятої солі;

де:

~~~~~ представляє ковалентне приєднання до L;

R^1 являє собою гідролізовану групу, вибрану з групи, що складається з C_{1-6} алкоксикарбонілу, C_{1-6} алкокситіокарбонілу, C_{1-6} карбамоїлу, C_{1-6} амід-

ну, C₁-C₆ сульфону і C₁-C₆ тіону; де кожен C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₁-C₆ алкокситіокарбоніл, C₁-C₆ карбамойл, C₁-C₆ амідин, C₁-C₆ сульфон і C₁-C₆ тіон необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтіо та -NR^AR^B;

R² вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканойлу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу та 5-10-членного гетероарилу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканойл, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл і 5-10-членний гетероарил необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтіо та -NR^AR^B; або

R¹ і R², разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R³ вибраний із групи, що складається з гідрогену, -NR^AR^B, -C(=O)NR^AR^B, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алканойлу, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ алканойлокси, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу; де кожен C₁-C₆ алкіл, C₂-C₆ алкеніл, C₂-C₆ алкініл, C₁-C₆ алканойл, C₁-C₆ алкоксикарбоніл, C₁-C₆ алканойлокси, C₃-C₆ циклоалкіл, феніл, 5-10-членний гетероарил і 3-12-членний гетероцикл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксо, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтіо та -NR^AR^B;

R⁵ вибраний із групи, що складається з гідрогену, -C(=O)OR^F, -NO₂, -CN, -CF₃-C(=O)NR^GR^H, -S(O₂)NR^GR^H, -N(R^I)-C(=O)R^J, -N(R^I)-S(O₂)R^K і SO₃R^K;

кожен R⁶ незалежно вибраний із групи, що складається з галогену, гідроксилу, нітро, ціано, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алканойлу, C₁-C₆ алканойлокси, C₁-C₆ алкоксикарбонілу, C₁-C₆ галогеналкілу, C₁-C₆ галогеналкокси і -NR^AR^B;

нижній індекс m дорівнює 0, 1, 2 або 3;

кожен R^A та R^B незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену та C₁-C₆ алкілу; або R^A та R^B разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R^C вибраний із групи, що складається з гідрогену, фенілу та C₁-C₁₀ алкілу, необов'язково заміщеного фенілом або 1-3 незалежно вибраними галогенами; кожен R^D, R^E, R^G та R^H незалежно вибраний із групи, що складається з гідрогену, C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₃-C₈ циклоалкілу, C₃-C₈ циклоалкіл(C₁-C₆ алкіл)-, арилу та арил(C₁-C₆ алкіл)-; або R^D та R^E або R^G та R^H разом з атомом нітрогену, до якого вони приєднані, утворюють 3-6-членний гетероцикл, необов'язково заміщений 1-3 незалежно вибраними C₁-C₆ алкілами;

R^F вибраний із групи, що складається з гідрогену, трифторметилу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₃-C₈ циклоалкілу, арилу, арил(C₁-C₆ алкілу)- і C₁-C₆ алкілу, необов'язково заміщеного 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з галогену, C₁-C₆ алканойлокси, C₁-C₆ алкокси та C₃-C₈ циклоалкілу;

кожен R^I, R^J і R^K незалежно вибраний з групи, що складається з гідрогену і C₁-C₆ алкілу; і

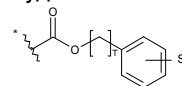
S_b являє собою солубілізуючу групу, вибрану з групи, що складається з фосфорилу, сульфурілу, нітро, C₅-C₉ моносахариду, C₁₀-C₁₈ дисахариду та C₁₅-C₂₇ трисахариду.

311. ADC за п. 310, де R¹ являє собою гідролізовану групу, вибрану з групи, що складається з C₁-C₆ алкоксикарбонілу та C₁-C₆ карбамойлу; де кожен C₁-C₆ алкоксикарбоніл і C₁-C₆ карбамойл необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, галогену, сульфгідрилу, ціано, оксиранілу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтіо та -NR^AR^B.

312. ADC за п. 310 або п. 311, де R¹ являє собою C₁-C₆ алкоксикарбоніл, необов'язково заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з групи, що складається з гідроксилу, C₃-C₈ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу, C₁-C₆ алкокси та -NR^AR^B.

313. ADC за будь-яким із пп. 310-312, де S_b являє собою солубілізуючу групу, вибрану з групи, що складається з C₅-C₉ моносахариду і C₁₀-C₁₈ дисахариду.

314. ADC за будь-яким із пп. 310-313, де R¹-S_b яв-



ляє собою , де нижній індекс T дорівнює 1-6.

315. ADC за будь-яким із пп. 310-314, де R² являє собою гідроген або C₁-C₆ алкіл.

316. ADC за будь-яким із пп. 310-315, де R³ вибраний із групи, що складається з C₁-C₆ алкілу, C₂-C₆ алкенілу, C₂-C₆ алкінілу, C₃-C₆ циклоалкілу, фенілу, 5-10-членного гетероарилу та 3-12-членного гетероциклу.

317. ADC за будь-яким із пп. 310-316, де R³ являє собою C₁-C₆ алкіл або C₃-C₆ циклоалкіл.

318. ADC за будь-яким із пп. 310-317, де R⁵ має pH не більше ніж близько 7,0, дипольний момент щонайменше близько 2,0 дебай або обидва.

319. ADC за будь-яким із пп. 310-318, де R⁵ вибраний із групи, що складається з -C(=O)OH, -NO₂, -CN, -CF₃ і -S(O₃)H.

320. ADC за будь-яким із пп. 310-319, де R⁵ являє собою -C(=O)OR^K.

321. ADC за будь-яким із пп. 310-320, де нижній індекс m дорівнює 0.

322. ADC за будь-яким із пп. 310-320, де лінкер (L) містить розщеплювану групу.

323. ADC за п. 322, де розщеплювана група містить глікозидний зв'язок, пептидний зв'язок, карбамат або четвертинний амін.

(21) а 2023 04484
(22) 10.03.2022

(51) МПК (2024.01)
A61P 11/00
A61P 13/12 (2006.01)
A61P 35/00
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 491/18 (2006.01)
C07D 495/04 (2006.01)

(31) 63/159,063

(32) 10.03.2021

(33) US

(85) 28.09.2023

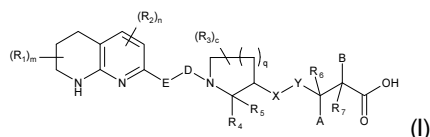
(86) РСТ/US2022/019759, 10.03.2022

(71) ДАЙС МОЛЕК'ЮЛС СВ, ІНК. (US)

(72) Шарма Лаліт Кумар (US), Фатері Пол Росс (US), Якобсен Джон Р. (US)

(54) ІНГІБІТОРИ ІНТЕГРИНУ АЛЬФА V БЕТА 6 ТА АЛЬФА V БЕТА 1 ТА ЇХ ЗАСТОСУВАННЯ

(57) 1. Сполука Формули (I):



або її фармацевтично прийнятні солі, гідрати або сольвати, де:

кожний R₁ незалежно являє собою водень, алкіл, заміщений алкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, алкініл, заміщений алкініл, арил, заміщений арил, арилалкіл, заміщений арилалкіл, арилалкеніл, заміщений арилалкеніл, арилалкініл, заміщений арилалкініл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, циклоалкеніл, заміщений циклоалкеніл, циклогетероалкіл, заміщений циклогетероалкіл, циклогетероалкеніл або заміщений циклогетероалкеніл, гетероалкіл, заміщений гетероалкіл, гетероалкеніл, заміщений гетероалкеніл, гетероалкініл, заміщений гетероалкініл, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероарилалкіл, заміщений гетероарилалкіл, гетероарилалкеніл, заміщений гетероарилалкеніл, гетероарилалкініл, заміщений гетероарилалкініл, галоген, -C(O)NR₈R₉, -C(O)OR₁₀, -NR₁₁C(O)OR₁₂, -NR₁₃C(O)OR₁₄, -OC(O)OR₁₅, -CN, -CF₃, -NR₁₆SO₂R₁₇ або -OR₁₈;

m становить 0, 1, 2 або 3;

кожний R₂ незалежно являє собою водень, алкіл, заміщений алкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, алкініл, заміщений алкініл, арил, заміщений арил, арилалкіл, заміщений арилалкіл, арилалкеніл, заміщений арилалкеніл, арилалкініл, заміщений арилалкініл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, циклоалкеніл, заміщений циклоалкеніл, циклогетероалкіл, заміщений циклогетероалкіл, циклогетероалкеніл, заміщений циклогетероалкеніл, гетероалкіл, заміщений гетероалкіл, гетероалкеніл, заміщений гетероалкеніл, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероарилалкіл, заміщений гетероарилалкіл, гетероарилалкеніл, заміщений гетероарилалкеніл, гетероарилалкініл, заміщений гетероарилалкініл, галоген, -C(O)NR₁₉R₂₀, -C(O)OR₂₁, -NR₂₂C(O)OR₂₃, -NR₂₄C(O)OR₂₅, -OC(O)OR₂₆, -CN, -CF₃, -NR₂₇SO₂R₂₈ або -OR₂₉;

n становить 0, 1 або 2;

кожний R₃ незалежно являє собою водень, алкіл, заміщений алкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, алкініл, заміщений алкініл, арил, заміщений арил, арилалкіл, заміщений арилалкіл, арилалкеніл, заміщений арилалкеніл, арилалкініл, заміщений арилалкініл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, циклоалкеніл, заміщений циклоалкеніл, циклогетероалкіл, заміщений циклогетероалкіл, циклогетероалкеніл, заміщений циклогетероалкеніл, гетероалкіл, заміщений гетероалкіл, гетероалкеніл, заміщений гетероалкеніл, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероарилалкіл, заміщений гетероарилалкіл, гетероарилалкеніл, заміщений гетероарилалкеніл, гетероарилалкініл, заміщений гетероарилалкініл, галоген, -C(O)NR₃₀R₃₁, -C(O)OR₃₂, -NR₃₃C(O)OR₃₄, -NR₃₅C(O)OR₃₆, -OC(O)OR₃₇, -CN, -CF₃, -NR₃₈SO₂R₃₉ або -OR₄₀;

алкініл, заміщений арилалкініл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, циклоалкеніл, заміщений циклоалкеніл, циклогетероалкіл, заміщений циклогетероалкіл, циклогетероалкеніл, заміщений циклогетероалкеніл, гетероалкіл, заміщений гетероалкіл, гетероалкеніл, заміщений гетероалкеніл, гетероалкініл, заміщений гетероалкініл, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероарилалкіл, заміщений гетероарилалкіл, гетероарилалкеніл, заміщений гетероарилалкеніл, гетероарилалкініл, заміщений гетероарилалкініл, галоген, -C(O)NR₃₀R₃₁, -C(O)OR₃₂, -NR₃₃C(O)OR₃₄, -NR₃₅C(O)OR₃₆, -OC(O)OR₃₇, -CN, -CF₃, -NR₃₈SO₂R₃₉ або -OR₄₀;

q становить 0, 1, 2 або 3;

o становить 0, 1 або 2, коли q становить 0;

o становить 0, 1, 2 або 3, коли q становить 1;

o становить 0, 1, 2, 3 або 4, коли q становить 2;

o становить 0, 1, 2, 3, 4 або 5, коли q становить 3;

R₄ являє собою водень, алкіл, заміщений алкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, алкініл, заміщений алкініл, арил, заміщений арил, арилалкіл, заміщений арилалкіл, арилалкеніл, заміщений арилалкеніл, арилалкініл, заміщений арилалкініл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, циклоалкеніл, заміщений циклоалкеніл, циклогетероалкіл, заміщений циклогетероалкіл, циклогетероалкеніл, заміщений циклогетероалкеніл, гетероалкіл, заміщений гетероалкіл, гетероалкеніл, заміщений гетероалкеніл, гетероалкініл, заміщений гетероалкініл, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероарилалкіл, заміщений гетероарилалкіл, гетероарилалкеніл, заміщений гетероарилалкеніл, гетероарилалкініл, заміщений гетероарилалкініл, -F, -C(O)NR₄₁R₄₂, -C(O)R₄₃, -C(O)OR₄₄, -CN, -CF₃, або R₄ та R₅ разом з атомом, до якого вони приєднані, утворюють C₄-C₈-циклоалکیلне кільце;

E являє собою -CH₂- або -CH₂Z-;

Z являє собою -NR₄₆-, -S-, -SO₂- або -O-;

D являє собою -(CH₂)₂-, -(CH₂)₃-, -CH=CHCH₂-, -C(O)-, -C≡CCH₂-, феніл, циклогексил або циклопентил, коли E являє собою -CH₂-; D являє собою -(CH₂)₂-, -(CH₂)₃-, -C(O)-, феніл, циклогексил або циклопентил, коли Z являє собою NR₄₅ або -O-; D являє собою -(CH₂)₂-, -(CH₂)₃-, феніл, циклогексил або циклопентил, коли Z являє собою -SO₂- або -S-;

X-Y являє собою -C(O)NR₄₆-, -NR₄₇C(O)-, -C(O)O-, -CH₂CH₂-, -CH=CH-, -C≡C-, -NR₄₈CH₂-, -CH₂NR₄₉-, -OCH₂-, -CH₂O-, -SO₂NR₅₀-, -NR₅₁SO₂- або циклопропіл;

A являє собою водень, -OR₅₂, алкіл, заміщений алкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, алкініл, заміщений алкініл, арил, заміщений арил, арилалкіл, заміщений арилалкіл, арилалкеніл, заміщений арилалкеніл, арилалкініл, заміщений арилалкініл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, циклоалкеніл, заміщений циклоалкеніл, циклогетероалкіл, заміщений циклогетероалкіл, циклогетероалкеніл, заміщений циклогетероалкеніл, гетероалкіл, заміщений гетероалкіл, гетероалкеніл, заміщений гетероалкеніл, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероарилалкіл, заміщений гетероарилалкіл, гетероарилалкеніл, заміщений гетероарилалкеніл, гетероарилалкініл, заміщений гетероарилалкініл, галоген;

B являє собою водень, арил, заміщений арил, арилалкіл, заміщений арилалкіл, арилалкеніл, заміщений арилалкеніл, арилалкініл, заміщений арилалкініл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, циклоалкеніл, заміщений циклоалкеніл, циклогетероалкіл, заміщений циклогетероалкіл, циклогетероалкеніл, заміщений циклогетероалкеніл, гетероалкіл, заміщений гетероалкіл, гетероалкеніл, заміщений гетероалкеніл, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероарилалкіл, заміщений гетероарилалкіл, гетероарилалкеніл, заміщений гетероарилалкеніл, гетероарилалкініл, заміщений гетероарилалкініл, галоген;

ніл, заміщений гетероалкеніл, гетероалкініл, заміщений гетероалкініл, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероарилалкіл, заміщений гетероарилалкіл, гетероарилалкеніл, заміщений гетероарилалкеніл, гетероарилалкініл, заміщений гетероарилалкініл, галоген, $-\text{NR}_{53}\text{R}_{54}$, $-\text{O}-\text{R}_{55}$, $-\text{S}-\text{R}_{56}$ або $-\text{SO}_2-\text{R}_{57}$;

R_8-R_{53} та $\text{R}_{58}-\text{R}_{64}$ незалежно являють собою водень, алкіл, заміщений алкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, алкініл, заміщений алкініл, арил, заміщений арил, арилалкіл, заміщений арилалкіл, арилалкеніл, заміщений арилалкеніл, арилалкініл, заміщений арилалкініл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, циклоалкеніл, заміщений циклоалкеніл, циклогетероалкіл, заміщений циклогетероалкіл, циклогетероалкеніл, заміщений циклогетероалкеніл, гетероалкіл, заміщений гетероалкіл, гетероалкеніл, заміщений гетероалкеніл, гетероалкініл, заміщений гетероалкініл, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероарилалкіл, заміщений гетероарилалкіл, гетероарилалкеніл, заміщений гетероарилалкеніл, гетероарилалкініл або заміщений гетероарилалкініл;

R_{54} являє собою алкіл, заміщений алкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, алкініл, заміщений алкініл, арил, заміщений арил, арилалкіл, заміщений арилалкіл, арилалкеніл, заміщений арилалкеніл, арилалкініл, заміщений арилалкініл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, циклоалкеніл, заміщений циклоалкеніл, циклогетероалкіл, заміщений циклогетероалкіл, циклогетероалкеніл, заміщений циклогетероалкеніл, гетероалкіл, заміщений гетероалкіл, гетероалкеніл, заміщений гетероалкеніл, гетероалкініл, заміщений гетероалкініл, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероарилалкіл, заміщений гетероарилалкіл, гетероарилалкеніл, заміщений гетероарилалкеніл, заміщений гетероарилалкініл, $-\text{C}(\text{O})\text{R}_{58}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_{59}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_{60}\text{R}_{61}$ або $-\text{SO}_2\text{R}_{62}$;

$\text{R}_{55}-\text{R}_{57}$ являють собою алкіл, заміщений алкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, алкініл, заміщений алкініл, арил, заміщений арил, арилалкіл, заміщений арилалкіл, арилалкеніл, заміщений арилалкеніл, арилалкініл, заміщений арилалкініл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, циклоалкеніл, заміщений циклоалкеніл, циклогетероалкіл, заміщений циклогетероалкіл, циклогетероалкеніл, заміщений циклогетероалкеніл, гетероалкіл, заміщений гетероалкіл, гетероалкеніл, заміщений гетероалкеніл, гетероалкініл, заміщений гетероалкініл, гетероарил, заміщений гетероарил, гетероарилалкіл, заміщений гетероарилалкіл, гетероарилалкеніл, заміщений гетероарилалкеніл, заміщений гетероарилалкініл, $-\text{C}(\text{O})\text{R}_{58}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_{59}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_{60}\text{R}_{61}$ або $-\text{SO}_2\text{R}_{62}$;

R_5 являє собою водень або $-\text{F}$;

R_6 являє собою водень, $-\text{F}$ або $-\text{OR}_{63}$; та

R_7 являє собою водень, $-\text{F}$ або $-\text{OR}_{64}$;

за умови, що R_5 являє собою водень, коли R_4 є $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_{41}\text{R}_{42}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}_{43}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_{44}$ або $-\text{CN}$;

за умови, що A не є водень, галоген або $-\text{OR}_{52}$, коли B являє собою водень або галоген;

за умови, що B не є водень або галоген, коли A являє собою водень, галоген або $-\text{OR}_{52}$;

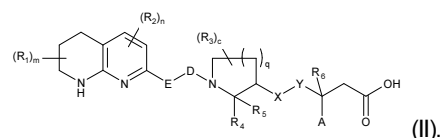
за умови, що R^7 є водень, коли B являє собою галоген, $-\text{NR}_{53}\text{R}_{54}$, $-\text{O}-\text{R}_{55}$, $-\text{S}-\text{R}_{56}$ або $-\text{SO}_2\text{R}_{57}$;

за умови, що R_6 є $-\text{CR}_{63}$, тільки коли $\text{X}-\text{Y}$ являють собою $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{C}\equiv\text{C}-$ або циклопропіл;

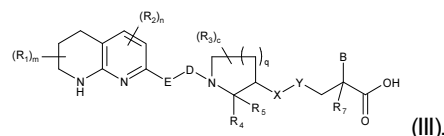
за умови, що A не є $-\text{OR}_{52}$, коли R_6 являє собою $-\text{OR}_{63}$; та

за умови, що A не є $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$ або $-\text{I}$, коли R_6 являє собою $-\text{F}$.

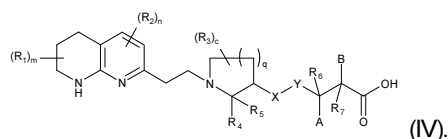
2. Сполука за п. 1 Формули (II):



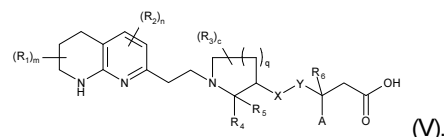
3. Сполука за п. 1 Формули (III):



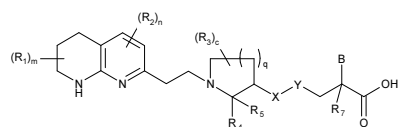
4. Сполука за п. 1 Формули (IV):



5. Сполука за п. 1 Формули (V):



6. Сполука за п. 1 Формули (VI):



7. Сполука за будь-яким із пп. 1-6, де кожний R_1 незалежно являє собою алкіл, заміщений алкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, феніл, заміщений феніл, циклоалкіл, циклогетероалкіл, гетероалкіл, $-\text{F}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_8\text{R}_9$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_{10}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{OR}_{15}$, $-\text{CF}_3$ або $-\text{OR}_{18}$.

8. Сполука за будь-яким із пп. 1-6, де кожний R_1 незалежно являє собою (C_1-C_4) -алкіл, (C_2-C_4) -алкеніл, феніл, заміщений феніл, (C_5-C_7) -циклоалкіл, (C_5-C_7) -циклогетероалкіл, $-\text{F}$ або $-\text{CF}_3$.

9. Сполука за будь-яким із пп. 1-6, де m становить 0 або 1.

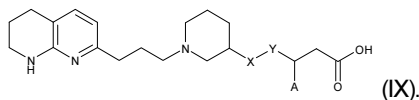
10. Сполука за будь-яким із пп. 1-6, де кожний R_2 незалежно являє собою алкіл, заміщений алкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, феніл, заміщений феніл, циклоалкіл, заміщений циклоалкіл, циклоалкеніл, заміщений циклоалкеніл, гетероалкіл, циклогетероалкіл, циклогетероалкеніл, галоген, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_{19}\text{R}_{20}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_{21}$, $-\text{NR}_{22}\text{C}(\text{O})\text{OR}_{23}$, $-\text{NR}_{24}\text{C}(\text{O})\text{OR}_{25}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{OR}_{26}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $-\text{NR}_{27}\text{SO}_2\text{R}_{28}$ або $-\text{OR}_{29}$.

11. Сполука за будь-яким з пп. 1-6, де кожний R_2 незалежно являє собою (C_1-C_4) -алкіл, (C_2-C_4) -алкеніл, феніл, заміщений феніл, (C_5-C_7) -циклоалкіл, (C_5-C_7) -циклогетероалкіл, галоген, $\text{C}(\text{O})\text{NR}_{19}\text{R}_{20}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_{21}$, $-\text{NR}_{22}\text{C}(\text{O})\text{OR}_{23}$, $-\text{NR}_{24}\text{C}(\text{O})\text{OR}_{25}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{OR}_{26}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $-\text{NR}_{27}\text{SO}_2\text{R}_{28}$ або $-\text{OR}_{29}$.

12. Сполука за будь-яким з пп. 1-6, де n становить 0 або 1.

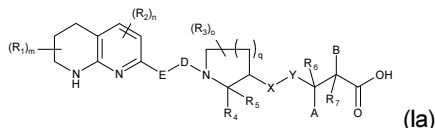
13. Сполука за будь-яким з пп. 1-6, де кожний R_3 незалежно являє собою алкіл, заміщений алкіл, алкеніл, заміщений алкеніл, феніл, заміщений феніл, циклоалкіл, гетероалкіл, циклогетероалкіл, $-\text{F}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_{30}\text{R}_{31}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_{32}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{OR}_{37}$, $-\text{CF}_3$ або $-\text{OR}_{40}$.

39. Сполука за п. 1 Формули (IX):



40. Сполука за п. 1, де А являє собою феніл або заміщений феніл.

41. Сполука Формули (Ia):



або її фармацевтично прийнятні солі, де: q становить 1, 2 або 3;

кожний з R^1 та R^3 незалежно вибраний у кожному випадку з галогену, C_{1-4} -алкілу, C_{1-4} -галогеналкілу, $-OR^{11}$, $-SR^{11}$, $-N(R^{11})_2$, $-C(O)N(R^{11})_2$, $-C(O)OR^{11}$, $=O$, $=S$ та $-CN$;

m вибраний з 0, 1, 2, 3, 4, 5 та 6;

o вибраний з 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 та 8;

R^2 незалежно вибраний у кожному випадку з галогену, C_{1-4} -алкілу, C_{1-4} -галогеналкілу, $-OR^{12}$, $-SR^{12}$, $-N(R^{12})_2$, $-CN$ та $-NO_2$;

n становить 0, 1 або 2;

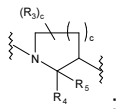
кожний з R^4 та R^5 незалежно вибраний з водню, галогену, C_{1-4} -алкілу, C_{1-4} -галогеналкілу, $-OR^{13}$, $-SR^{13}$, $-N(R^{13})_2$ та $-CN$; або R^4 та R^5 взяті разом для утворення замісника з подвійним зв'язком, вибраного із $=O$, $=S$ та $=N(R^{13})$;

D вибраний зі зв'язку, $-C(O)-$, $-C\equiv CCH_2-$ та $-CH=CHCH_2-$;

E вибраний з C_{1-4} -алкілену та $-(CH_2)_Z-$;

де Z вибраний з $-NH-$, $-S-$, $-SO_2-$ та $-O-$;

X-Y вибраний із: $^{\lambda}C(O)N(R^{14})$, $^{\lambda}N(R^{14})C(O)$, $^{\lambda}N(R^{14})C(O)C(R^{15})_2$, $^{\lambda}C(O)O-$, $^{\lambda}C(R^{15})_2C(R^{15})_2$, $^{\lambda}CH=CH-$, $^{\lambda}C\equiv C-$, $^{\lambda}N(R^{14})C(R^{15})_2$, $^{\lambda}C(R^{15})_2N(R^{14})$, $^{\lambda}O-$, $^{\lambda}OC(R^{15})_2$, $^{\lambda}C(R^{15})_2O-$, $^{\lambda}SO_2N(R^{14})$ та $^{\lambda}N(R^{14})SO_2$;



де $^{\lambda}$ означає приєднання X-Y до

кожний з R^6 та R^7 незалежно вибраний у кожному випадку з:

водню, галогену, C_{1-4} -алкілу, C_{1-4} -галогеналкілу, $-OR^{16}$ та $-CN$;

A вибраний з (i) та (ii):

(i) водню, галогену та $-CN$, або A та R^6 разом утворюють C_{3-6} -карбоцикл або 3-6-членний гетероцикл;

(ii) $-OR^{17}$, $-SR^{17}$, $-N(R^{17})_2$, $-N(R^{17})C(O)R^{17}$, $-N(R^{17})C(O)OR^{17}$, $-N(R^{17})C(O)N(R^{17})_2$, $-N(R^{17})C(S)N(R^{17})_2$, $-N(R^{17})S(O)_2(R^{17})$, $-C(O)R^{17}$, $-C(O)OR^{17}$, $-OC(O)R^{17}$, $-OC(O)N(R^{17})_2$, $-C(O)N(R^{17})_2$, $-S(O)R^{17}$, $-S(O)_2R^{17}$ та $-S(O)_2N(R^{17})_2$;

C_{1-6} -алкілу, факультативно заміщеного одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з:

галогену, $-OR^{17}$, $-SR^{17}$, $-N(R^{17})_2$, $-C(O)R^{17}$, $-C(O)OR^{17}$, $-OC(O)R^{17}$, $-OC(O)N(R^{17})_2$, $-C(O)N(R^{17})_2$, $-N(R^{17})C(O)R^{17}$, $-N(R^{17})C(O)OR^{17}$, $-N(R^{17})C(O)N(R^{17})_2$, $-N(R^{17})C(S)N(R^{17})_2$, $-N(R^{17})S(O)_2(R^{17})$, $-S(O)R^{17}$, $-S(O)_2R^{17}$, $-S(O)_2N(R^{17})_2$, $-NO_2$, $=O$, $=S$, $=N(R^{17})$, $-N_3$, $-CN$, C_{3-10} -карбоциклу та 3-10-членного гетероциклу, де факультативно кожний C_{3-10} -карбоцикл та 3-10-членний

гетероцикл заміщені одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, C_{1-6} -алкілу, C_{1-6} -галогеналкілу, $-OR^{17}$, $-SR^{17}$, $-N(R^{17})_2$, $-C(O)R^{17}$, $-C(O)OR^{17}$, $-OC(O)R^{17}$, $-OC(O)N(R^{17})_2$, $-C(O)N(R^{17})_2$, $-N(R^{17})C(O)R^{17}$,

$-N(R^{17})C(O)OR^{17}$, $-N(R^{17})C(O)N(R^{17})_2$, $-N(R^{17})C(S)N(R^{17})_2$, $-N(R^{17})S(O)_2(R^{17})$, $-S(O)R^{17}$, $-S(O)_2R^{17}$, $-S(O)_2N(R^{17})_2$, $-NO_2$, $=O$, $=S$, $=N(R^{17})$, $-N_3$ та $-CN$; та

C_{3-12} -карбоциклу та 3-12-членного гетероциклу, будь-який з яких факультативно заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з:

галогену, $-OR^{17}$, $-SR^{17}$, $-N(R^{17})_2$, $-C(O)R^{17}$, $-C(O)OR^{17}$, $-OC(O)R^{17}$, $-OC(O)N(R^{17})_2$, $-C(O)N(R^{17})_2$, $-N(R^{17})C(O)R^{17}$, $-N(R^{17})C(O)OR^{17}$, $-N(R^{17})C(O)N(R^{17})_2$, $-N(R^{17})C(S)N(R^{17})_2$, $-N(R^{17})S(O)_2(R^{17})$, $-S(O)R^{17}$, $-S(O)_2R^{17}$, $-S(O)_2N(R^{17})_2$, $-NO_2$, $=O$, $=S$, $=N(R^{17})$, $-N_3$ та $-CN$;

C_{1-6} -алкілу, факультативно заміщеного одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, $-OR^{17}$, $-SR^{17}$, $-N(R^{17})_2$, $-C(O)R^{17}$, $-C(O)OR^{17}$, $-OC(O)R^{17}$, $-OC(O)N(R^{17})_2$, $-C(O)N(R^{17})_2$, $-N(R^{17})C(O)R^{17}$, $-N(R^{17})C(O)OR^{17}$, $-N(R^{17})C(O)N(R^{17})_2$,

$-N(R^{17})C(S)N(R^{17})_2$, $-N(R^{17})S(O)_2(R^{17})$, $-S(O)R^{17}$, $-S(O)_2R^{17}$, $-S(O)_2N(R^{17})_2$, $-NO_2$, $=O$, $=S$, $=N(R^{17})$, $-N_3$ та $-CN$; та

C_{3-10} -карбоциклу та 3-10-членного гетероциклу, будь-який з яких факультативно заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, C_{1-4} -алкілу, C_{1-4} -галогеналкілу та $=O$; B вибраний з (I), коли A вибраний з (ii), або B вибраний з (II), а A вибраний з (i):

(I) водню, галогену та $-CN$, або B та R^7 разом утворюють C_{3-6} -карбоцикл або 3-6-членний гетероцикл;

(II) $-OR^{18}$, $-SR^{18}$, $-N(R^{18})_2$, $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{18}$, $-OC(O)R^{18}$, $-OC(O)N(R^{18})_2$, $-C(O)N(R^{18})_2$, $-N(R^{18})C(O)R^{18}$, $-N(R^{18})C(O)OR^{18}$, $-N(R^{18})C(O)N(R^{18})_2$, $-N(R^{18})C(S)N(R^{18})_2$, $-N(R^{18})S(O)_2(R^{18})$, $-S(O)R^{18}$, $-S(O)_2R^{18}$ та $-S(O)_2N(R^{18})_2$;

C_{1-6} -алкілу, факультативно заміщеного одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з:

галогену, $-OR^{18}$, $-SR^{18}$, $-N(R^{18})_2$, $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{18}$, $-OC(O)R^{18}$, $-OC(O)N(R^{18})_2$, $-C(O)N(R^{18})_2$, $-N(R^{18})C(O)R^{18}$, $-N(R^{18})C(O)OR^{18}$, $-N(R^{18})C(O)N(R^{18})_2$, $-N(R^{18})C(S)N(R^{18})_2$, $-N(R^{18})S(O)_2(R^{18})$, $-S(O)R^{18}$, $-S(O)_2R^{18}$, $-S(O)_2N(R^{18})_2$, $-NO_2$, $=O$, $=S$, $=N(R^{18})$, $-N_3$, $-CN$, C_{3-10} -карбоциклу та 3-10-членного гетероциклу,

де факультативно C_{3-10} -карбоцикл та 3-10-членний гетероцикл заміщені одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, C_{1-6} -алкілу, C_{1-6} -галогеналкілу, $-OR^{18}$, $-SR^{18}$, $-N(R^{18})_2$, $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{18}$, $-OC(O)R^{18}$, $-OC(O)N(R^{18})_2$, $-C(O)N(R^{18})_2$, $-N(R^{18})C(O)R^{18}$, $-N(R^{18})C(O)OR^{18}$, $-N(R^{18})C(O)N(R^{18})_2$, $-N(R^{18})C(S)N(R^{18})_2$, $-N(R^{18})S(O)_2(R^{18})$, $-S(O)R^{18}$, $-S(O)_2R^{18}$, $-S(O)_2N(R^{18})_2$, $-NO_2$, $=O$, $=S$, $=N(R^{18})$, $-N_3$ та $-CN$; та

C_{3-12} -карбоциклу та 3-12-членного гетероциклу, будь-який з яких факультативно заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з:

галогену, $-OR^{18}$, $-SR^{18}$, $-N(R^{18})_2$, $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{18}$, $-OC(O)R^{18}$, $-OC(O)N(R^{18})_2$, $-C(O)N(R^{18})_2$, $-N(R^{18})C(O)R^{18}$, $-N(R^{18})C(O)OR^{18}$, $-N(R^{18})C(O)N(R^{18})_2$, $-N(R^{18})C(S)N(R^{18})_2$, $-N(R^{18})S(O)_2(R^{18})$, $-S(O)R^{18}$, $-S(O)_2R^{18}$, $-S(O)_2N(R^{18})_2$, $-NO_2$, $=O$, $=S$, $=N(R^{18})$, $-N_3$ та $-CN$;

C_{1-6} -алкілу, факультативно заміщеного одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з:

галогену, $-OR^{18}$, $-SR^{18}$, $-N(R^{18})_2$, $-C(O)R^{18}$, $-C(O)OR^{18}$, $-OC(O)R^{18}$, $-OC(O)N(R^{18})_2$, $-C(O)N(R^{18})_2$, $-N(R^{18})C(O)R^{18}$, $-N(R^{18})C(O)OR^{18}$, $-N(R^{18})C(O)N(R^{18})_2$, $-N(R^{18})C(S)N(R^{18})_2$, $-N(R^{18})S(O)_2(R^{18})$, $-S(O)R^{18}$, $-S(O)_2R^{18}$, $-S(O)_2N(R^{18})_2$, $-NO_2$, $=O$, $=S$, $=N(R^{18})$, $-N_3$, $-CN$, C_{3-6} -карбоциклу та 3-6-членного гетероциклу,

де факультативно кожний C_{3-6} -карбоцикл та 3-6-членний гетероцикл заміщені одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, C_{1-4} -алкілу, C_{1-4} -галогеналкілу та $=O$; та

С₃₋₁₀-карбоциклу та 3-10-членного гетероциклу, будь-який з яких факультативно заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, С₁₋₄-алкілу, С₁₋₄-галогеналкілу та =O; кожний з R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴ та R¹⁶ незалежно вибраний у кожному випадку з С₁₋₄-алкілу та С₁₋₄-галогеналкілу; R¹⁵ незалежно вибраний у кожному випадку з водню, галогену, С₁₋₄-алкілу та С₁₋₄-галогеналкілу; R¹⁷ незалежно вибраний у кожному випадку із: водню; С₁₋₆-алкілу, факультативно заміщеного одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з: галогену, -OR²¹, -SR²¹, -N(R²¹)₂, -C(O)R²¹, -C(O)OR²¹, -OC(O)R²¹, -OC(O)N(R²¹)₂, -C(O)N(R²¹)₂, -N(R²¹)C(O)R²¹, -N(R²¹)C(O)OR²¹, -N(R²¹)C(S)N(R²¹)₂, -N(R²¹)S(O)₂(R²¹), -S(O)R²¹, -S(O)₂R²¹, -S(O)₂N(R²¹)₂, -NO₂, =O, =S, =N(R²¹), -N₃ та -CN; та

С₃₋₆-карбоциклу та 3-6-членного гетероциклу, будь-який з яких факультативно заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з: галогену, С₁₋₄-алкілу, С₁₋₄-галогеналкілу, -OR²¹, -SR²¹, -N(R²¹)₂, -C(O)R²¹, -C(O)OR²¹, -OC(O)R²¹, -OC(O)N(R²¹)₂, -C(O)N(R²¹)₂, -N(R²¹)C(O)R²¹, -N(R²¹)C(O)OR²¹, -N(R²¹)C(S)N(R²¹)₂, -N(R²¹)S(O)₂(R²¹), -S(O)R²¹, -S(O)₂R²¹, -S(O)₂N(R²¹)₂, -NO₂, =O, =S, =N(R²¹), -N₃ та -CN; R¹⁸ незалежно вибраний у кожному випадку із: водню;

С₁₋₆-алкілу, факультативно заміщеного одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з: галогену, -OR²², -SR²², -N(R²²)₂, -C(O)R²², -C(O)OR²², -OC(O)R²², -OC(O)N(R²²)₂, -C(O)N(R²²)₂, -N(R²²)C(O)R²², -N(R²²)C(O)OR²², -N(R²²)C(S)N(R²²)₂, -N(R²²)S(O)₂(R²²), -S(O)R²², -S(O)₂R²², -S(O)₂N(R²²)₂, -NO₂, =O, =S, =N(R²²), -N₃, -CN, С₃₋₁₀-карбоциклу та 3-10-членного гетероциклу,

де факультативно кожний С₃₋₁₀-карбоцикл та 3-10-членний гетероцикл заміщені одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, С₁₋₆-алкілу, С₁₋₆-галогеналкілу, -OR²², -SR²² та -N(R²²)₂; та

С₃₋₁₀-карбоциклу та 3-10-членного гетероциклу, будь-який з яких факультативно заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з:

галогену, С₁₋₆-алкілу, С₁₋₆-галогеналкілу, -OR²², -SR²², -N(R²²)₂, -C(O)R²², -C(O)OR²², -OC(O)R²², -OC(O)N(R²²)₂, -C(O)N(R²²)₂, -N(R²²)C(O)R²², -N(R²²)C(O)OR²², -N(R²²)C(S)N(R²²)₂, -N(R²²)S(O)₂(R²²), -S(O)R²², -S(O)₂R²², -S(O)₂N(R²²)₂, -NO₂, =O, =S, =N(R²²), -N₃, -CN, С₃₋₆-карбоциклу та 3-6-членного гетероциклу;

де факультативно кожний С₃₋₆-карбоцикл та 3-6-членний гетероцикл заміщені одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, С₁₋₄-алкілу, С₁₋₄-галогеналкілу; кожний з R²¹ та R²² незалежно вибраний у кожному випадку з:

водню;

С₁₋₄-алкілу, факультативно заміщеного одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, гідроксилу, С₃₋₆-карбоциклу та 3-6-членного гетероциклу, де факультативно кожний С₃₋₆-карбоцикл та 3-6-членний гетероцикл заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з С₁₋₄-алкілу, -N(R²³)₂ та -C(O)N(R²³)₂; та

С₃₋₆-карбоциклу та 3-12-членного гетероциклу, будь-який з яких факультативно заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, С₁₋₄-алкілу, С₁₋₄-галогеналкілу, С₁₋₄-алкокси та =O; та R²³ незалежно вибраний у кожному випадку з водню та С₁₋₄-алкілу.

42. Сполука або сіль за п. 41, де R³ вибраний у кожному випадку з галогену, С₁₋₄-алкілу та -C(O)N(R¹¹)₂; та o становить 0, 1 або 2.

43. Сполука або сіль за п. 41 або п. 42, де q становить 1 або 2.

44. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 41-43, де m становить 0 та n становить 0.

45. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 41-44, де кожний R⁴ та R⁵ являють собою водень.

46. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 41-45, де D являє собою зв'язок або -C(O)-.

47. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 41-46, де E вибраний з С₁₋₄-алкілену.

48. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 41-47, де X-Y вибраний з ^λ-C(O)N(R¹⁴)-, ^λ-N(R¹⁴)C(O)-, ^λ-N(R¹⁴)C(O)CH₂-, ^λ-CH₂CH₂-, ^λ-N(R¹⁴)CH₂-, ^λ-CH₂N(R¹⁴)-, ^λ-O-, ^λ-OCH₂- та ^λ-CH₂O-; й R¹⁴ вибраний у кожному випадку із водню та С₁₋₄-алкілу.

49. Сполука або сіль за п. 48, де X-Y вибраний з ^λ-C(O)N(R¹⁴)-, ^λ-N(R¹⁴)C(O)- та ^λ-OCH₂-; й R¹⁴ являє собою водень.

50. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 41-49, де кожний R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵ та R¹⁶ вибрані у кожному випадку з водню.

51. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 41-50, де R⁶ вибраний з водню та -OH, або А та R⁶ разом утворюють С₃₋₆-карбоцикл; й R⁷ вибраний з водню та галогену.

52. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 41-51, де кожний R⁶ та R⁷ вибраний з водню.

53. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 41-52, де А вибраний з водню, галогену та -CN, або А та R⁶ разом утворюють С₃₋₆-карбоцикл.

54. Сполука або сіль за п. 53, де А являє собою водень.

55. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 41-52, де В вибраний з водню, галогену та -CN.

56. Сполука або сіль за п. 55, де В вибраний з водню та галогену.

57. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 41-50 та пп. 55-56, де А вибраний з С₃₋₁₂-карбоциклу та 3-12-членного гетероциклу, будь-який з яких факультативно заміщений одним або декількома замісниками.

58. Сполука або сіль за п. 57, де С₃₋₁₂-карбоцикл та 3-12-членний гетероцикл А вибрані з фенілу; піридину; індану; хроману; бензодіоксолу; 2,3-дигідробензофурану; хіноліну; 1,2,3,4-тетрагідронафталіну; нафталіну; хіноксаліну;

2',3'-дигідроспіро[циклопропан-1,1'-індену]; та піразолу; будь-який з них факультативно заміщений одним або декількома замісниками.

59. Сполука або сіль за п. 57 або п. 58, де один або декілька факультативних замісників для А вибрані з: галогену, -OR¹⁷, N(R¹⁷)₂, -C(O)R¹⁷, -N(R¹⁷)C(O)R¹⁷, -N(R¹⁷)S(O)₂(R¹⁷), =O, =S та -CN;

С₁₋₆-алкілу, факультативно заміщеного одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з: галогену, -OR¹⁷, -N(R¹⁷)₂, -N(R¹⁷)C(O)R¹⁷, -N(R¹⁷)S(O)₂(R¹⁷), -S(O)R¹⁷, =O та -CN; та

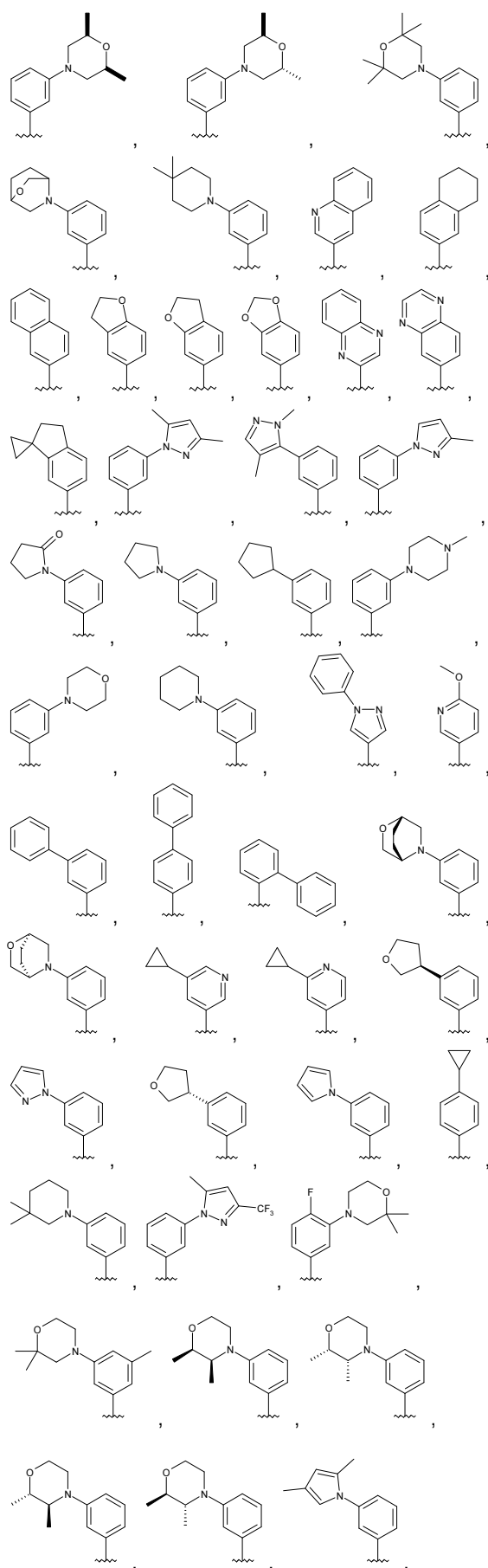
С₃₋₁₀-карбоциклу та 3-10-членного гетероциклу, будь-який з яких факультативно заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, С₁₋₄-алкілу, С₁₋₄-галогеналкілу та =O.

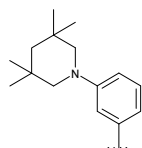
60. Сполука або сіль за п. 59, де один або декілька факультативних замісників для А вибрані з: галогену, -OR¹⁷, С₁₋₆-алкілу, С₁₋₆-галогеналкілу, С₃₋₁₀-карбоциклу та 3-10-членного гетероциклу, де факультативно кожний С₃₋₁₀-карбоцикл та 3-10-членний гетероцикл заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з С₁₋₄-алкілу, С₁₋₄-галогеналкілу та =O.

61. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 41-52 та пп. 55-60, де R¹⁷ незалежно вибраний у кожному випадку з во-

Figure 1 displays 16 chemical structures of various cyclic amine derivatives, labeled 1 through 16. The structures are arranged in a grid-like fashion, showing different ring sizes and functional groups. The structures include:

- 1: A 3-membered ring with an oxygen atom and a wavy line.
- 2: A 4-membered ring with an oxygen atom and a wavy line.
- 3: A 5-membered ring with an oxygen atom and a wavy line.
- 4: A 6-membered ring with an oxygen atom and a wavy line.
- 5: A 7-membered ring with an oxygen atom and a wavy line.
- 6: A 3-membered ring with a nitrogen atom and a wavy line.
- 7: A 4-membered ring with a nitrogen atom and a wavy line.
- 8: A 5-membered ring with a nitrogen atom and a wavy line.
- 9: A 6-membered ring with a nitrogen atom and a wavy line.
- 10: A 7-membered ring with a nitrogen atom and a wavy line.
- 11: A 3-membered ring with a nitrogen atom and a wavy line.
- 12: A 4-membered ring with a nitrogen atom and a wavy line.
- 13: A 5-membered ring with a nitrogen atom and a wavy line.
- 14: A 6-membered ring with a nitrogen atom and a wavy line.
- 15: A 7-membered ring with a nitrogen atom and a wavy line.
- 16: A 3-membered ring with a nitrogen atom and a wavy line.

[illegible]



та

64. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 41-54, де В вибраний з:

$-\text{OR}^{18}$, $-\text{SR}^{18}$, $-\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{18}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{18}$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{S})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{S}(\text{O})_2(\text{R}^{18})$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{18}$ та $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{18})_2$;

C_{3-12} -карбоциклу та 3-12-членного гетероциклу, будь-який з яких факультативно заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з:

галогену, $-\text{OR}^{18}$, $-\text{SR}^{18}$, $-\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{18}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{18}$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{S})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{S}(\text{O})_2(\text{R}^{18})$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{18}$, $-\text{NO}_2$, $=\text{O}$, $=\text{S}$, $=\text{N}(\text{R}^{18})$, $-\text{N}_3$ та $-\text{CN}$;

C_{1-6} -алкілу, факультативно заміщеного одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з:

галогену, $-\text{OR}^{18}$, $-\text{SR}^{18}$, $-\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{18}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{18}$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{S})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{S}(\text{O})_2(\text{R}^{18})$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{18}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{NO}_2$, $=\text{O}$, $=\text{S}$, N_3 , $-\text{CN}$, C_{3-6} -карбоциклу та 3-6-членного гетероциклу,

де факультативно кожний C_{3-6} -карбоцикл та 3-6-членний гетероцикл заміщені одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, C_{1-4} -алкілу, C_{1-4} -галогеналкілу та $=\text{O}$; та

C_{3-10} -карбоциклу та 3-10-членного гетероциклу, будь-який з яких факультативно заміщений одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, C_{1-4} -алкілу, C_{1-4} -галогеналкілу та $=\text{O}$.

65. Сполука або сіль за п. 64, де В вибраний з $-\text{OR}^{18}$, $-\text{SR}^{18}$, $-\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{18}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{18}$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{S})\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{S}(\text{O})_2(\text{R}^{18})$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{18}$ та $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{18})_2$.

66. Сполука або сіль за п. 65, де В вибраний з $-\text{N}(\text{R}^{18})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{O})\text{R}^{18}$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{18}$, $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{18})_2$ та $-\text{N}(\text{R}^{18})\text{S}(\text{O})_2(\text{R}^{18})$.

67. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 64-66, де R^{18} незалежно вибраний у кожному випадку з піролідину, C_{3-10} -карбоциклу та 3-10-членного гетероциклу, де факультативно кожний C_{1-6} -алкіл, C_{3-10} -карбоцикл та 3-10-членний гетероцикл заміщені одним або декількома замісниками.

68. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 64-67, де кожний C_{3-10} -карбоцикл та 3-10-членний гетероцикл з R^{18} незалежно вибраний у кожному випадку з піролідину, піперидину, фенілу, індоліну, біцикло[2.2.2]октану, циклогексану, тетрагідропірану, піридину, оксадіазолу, піримідину, хіназоліну, нафталіну, хіноліну, тісно[3,2-d]піримідину, тісно[2,3-d]піримідину, бензотіазолу, індану, тісно[2,3-d]піримідиноксиду та циклопропілу, будь-який з яких факультативно заміщений одним або декількома замісниками.

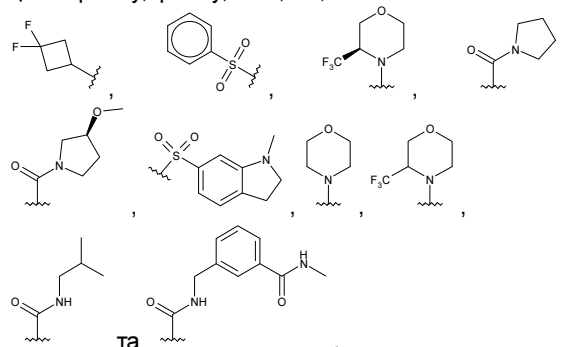
69. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 64-68, де кожний C_{3-10} -карбоцикл та 3-10-членний гетероцикл з R^{18} факультативно заміщені у кожному випадку одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, C_{1-6} -алкілу, C_{1-6} -галогеналкілу, $-\text{OR}^{22}$, $-\text{N}(\text{R}^{22})_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{22}$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{22})_2$, $-\text{N}(\text{R}^{22})\text{C}(\text{O})\text{R}^{22}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{22}$, $=\text{O}$, $-\text{CN}$, C_{3-6} -кар-

боциклу та 3-6-членного гетероциклу; де факультативно кожний C_{3-6} -карбоцикл та 3-6-членний гетероцикл заміщені одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, C_{1-4} -алкілу та C_{1-4} -галогеналкілу.

70. Сполука або сіль за п. 69, де кожний C_{3-10} -карбоцикл та 3-10-членний гетероцикл з R^{18} факультативно заміщені у кожному випадку одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену, C_{1-6} -алкілу, C_{1-6} -галогеналкілу, $-\text{N}(\text{R}^{22})_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{22}$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{22})_2$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{22}$, $=\text{O}$, C_{3-6} -карбоциклу та 3-6-членного гетероциклу, де факультативно кожний C_{3-6} -карбоцикл та 3-6-членний гетероцикл заміщені одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену та C_{1-4} -галогеналкілу.

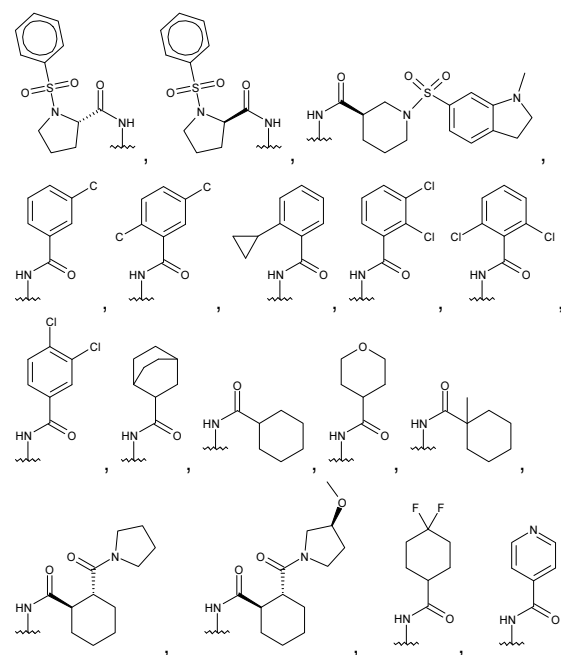
71. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 64-70, де R^{22} незалежно вибраний у кожному випадку з водню, C_{1-4} -алкілу, C_{3-6} -карбоциклу та 3-6-членного гетероциклу, де факультативно кожний C_{3-6} -карбоцикл та 3-6-членний гетероцикл заміщені одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з C_{1-4} -алкілу та C_{1-4} -алкокси.

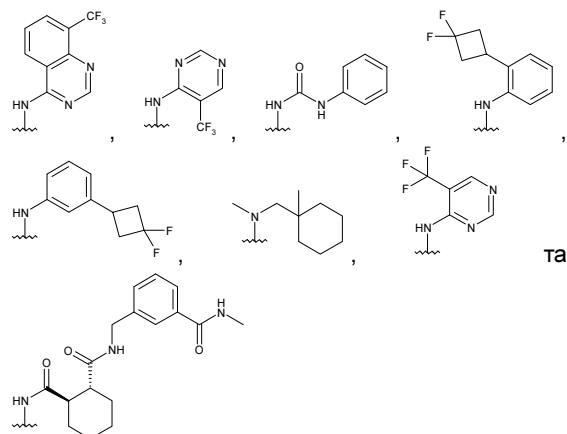
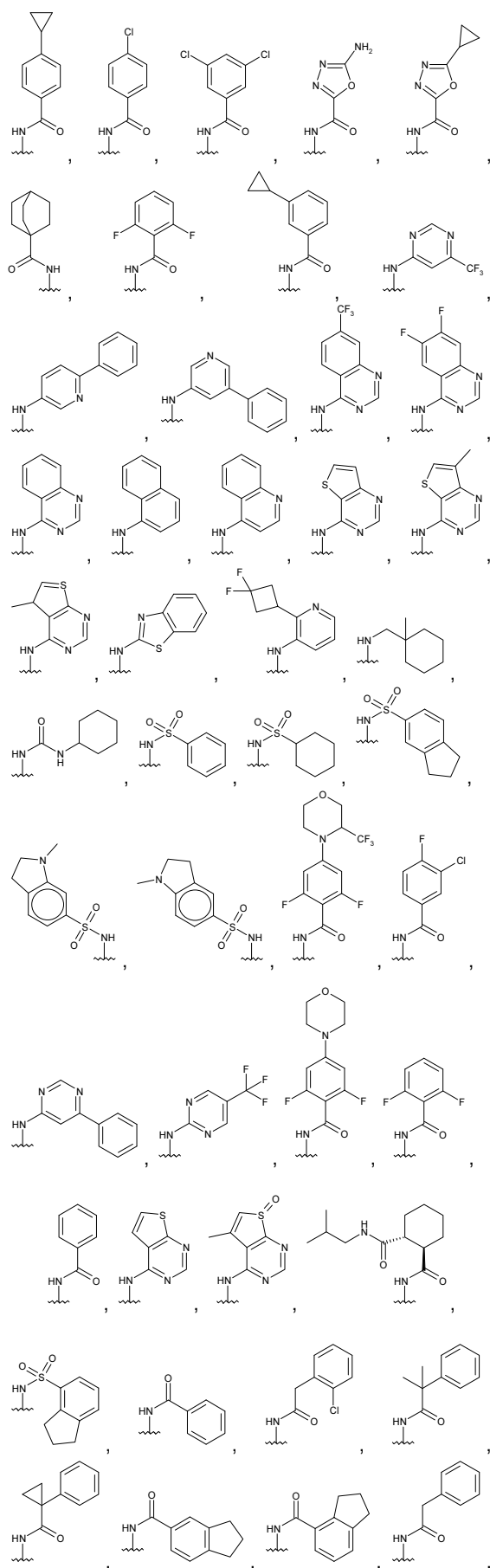
72. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 64-71, де кожний C_{3-10} -карбоцикл та 3-10-членний гетероцикл з R^{18} факультативно заміщені у кожному випадку одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з: галогену, метилу, трифторметилу, циклопропілу, фенілу, $-\text{NH}_2$, $=\text{O}$,



та

73. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 41-54, де В вибраний з:





та

74. Сполука або сіль за п. 64, де В вибраний з C₃₋₁₂-карбоциклу та 3-12-членного гетероциклу, будь-який з яких факультативно заміщений одним або декількома замісниками.

75. Сполука або сіль за п. 74, де C₃₋₁₂-карбоцикл та 3-12-членний гетероцикл з В вибрані із фенілу; піридинілу, нафтілу; 1,2,3,4-тетрагідронафталіну; індану; 7-азаіндо-лу; індазолу; та хроману; будь-який з яких факультати-вно заміщений одним або декількома замісниками.

76. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 74-75, де кож-ний C₃₋₁₂-карбоцикл та 3-12-членний гетероцикл з В фа-культативно заміщені одним або декількома замісника-ми, незалежно вибраними з:

галогену, -OR¹⁸, -N(R¹⁸)₂, -C(O)R¹⁸, =O та -CN;

C₁₋₆-алкілу, факультативно заміщеного одним або декі-лькама замісниками, незалежно вибраними з галогену, -OR¹⁸, -SR¹⁸, -N(R¹⁸)₂, -C(O)R¹⁸, =O, -CN, C₃₋₆-карбоциклу та 3-6-членного гетероциклу, де факультативно кожний C₃₋₆-карбоцикл та 3-6-членний гетероцикл заміщені од-ним або декількома замісниками, незалежно вибрани-ми з галогену, C₁₋₄-алкілу, C₁₋₄-галогеналкілу та =O; та C₃₋₁₀-карбоциклу та 3-10-членного гетероциклу, будь-який з яких факультативно заміщений одним або декі-лькама замісниками, незалежно вибраними з галогену, C₁₋₄-алкілу, C₁₋₄-галогеналкілу та =O.

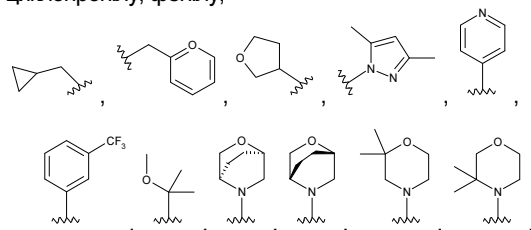
77. Сполука або сіль за п. 76, де кожний C₃₋₁₂-карбоцикл та 3-12-членний гетероцикл з В факультативно заміще-ні одним або декількома замісниками, незалежно виб-раними з:

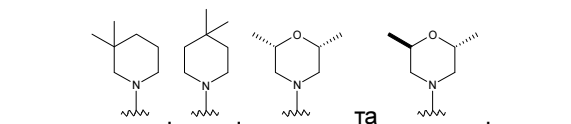
галогену та -OR¹⁸,

C₁₋₆-алкілу, факультативно заміщеного одним або декі-лькама замісниками, незалежно вибраними з галогену, OR¹⁸ та C₃₋₆-карбоциклу; та

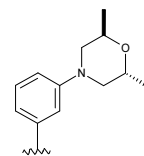
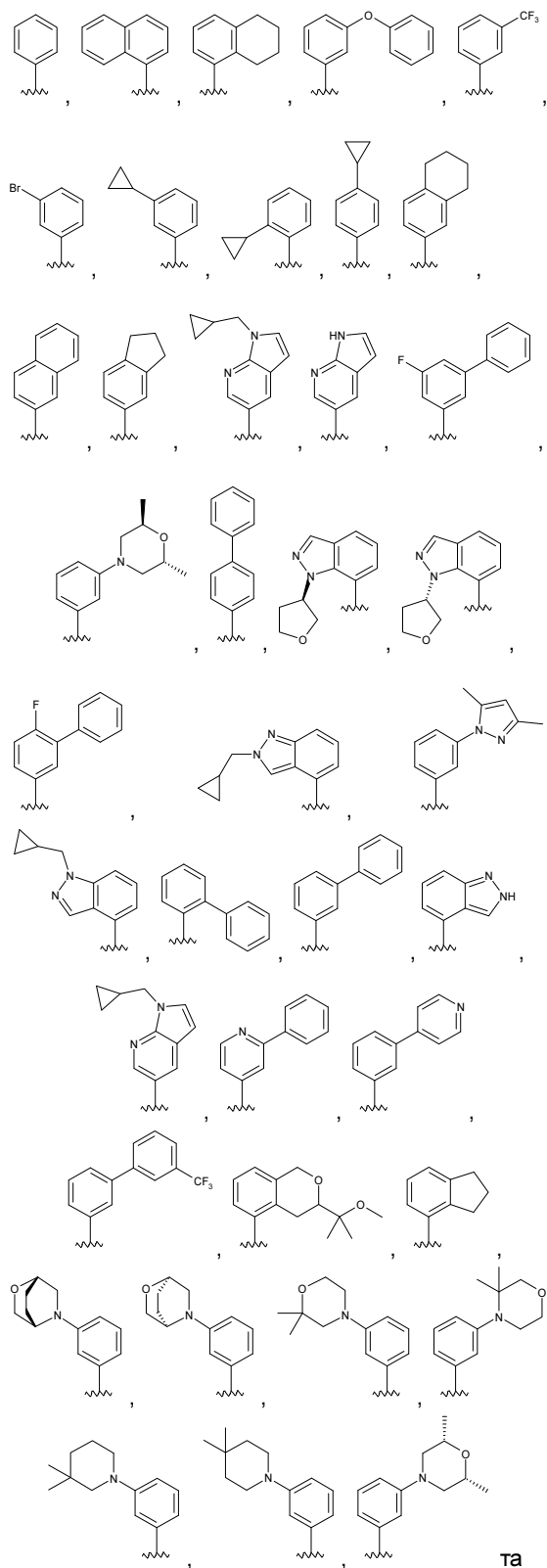
C₃₋₁₀-карбоциклу та 3-10-членного гетероциклу, де кож-ний C₃₋₁₀-карбоцикл та 3-10-членний гетероцикл факул-ьтативно заміщені одним або декількома замісниками, незалежно вибраними з галогену та C₁₋₄-алкілу.

78. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 74-77, де кож-ний C₃₋₁₂-карбоцикл та 3-12-членний гетероцикл з В фа-культативно заміщені одним або декількома замісника-ми, незалежно вибраними з галогену, трифторметилу, циклопропілу, фенілу,

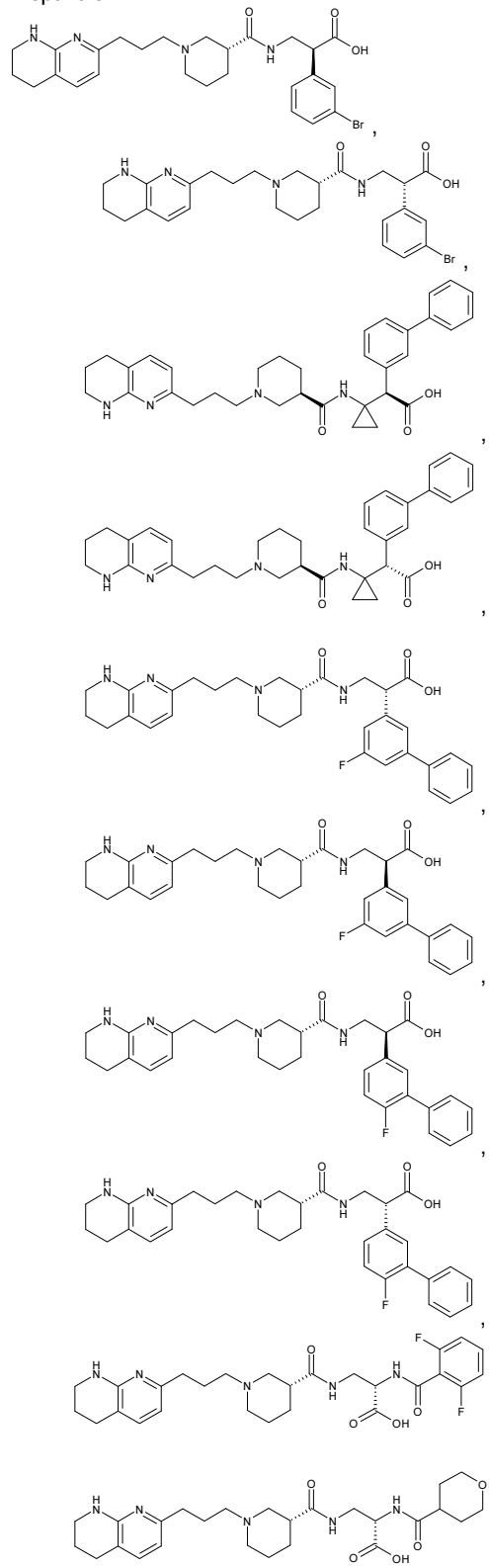


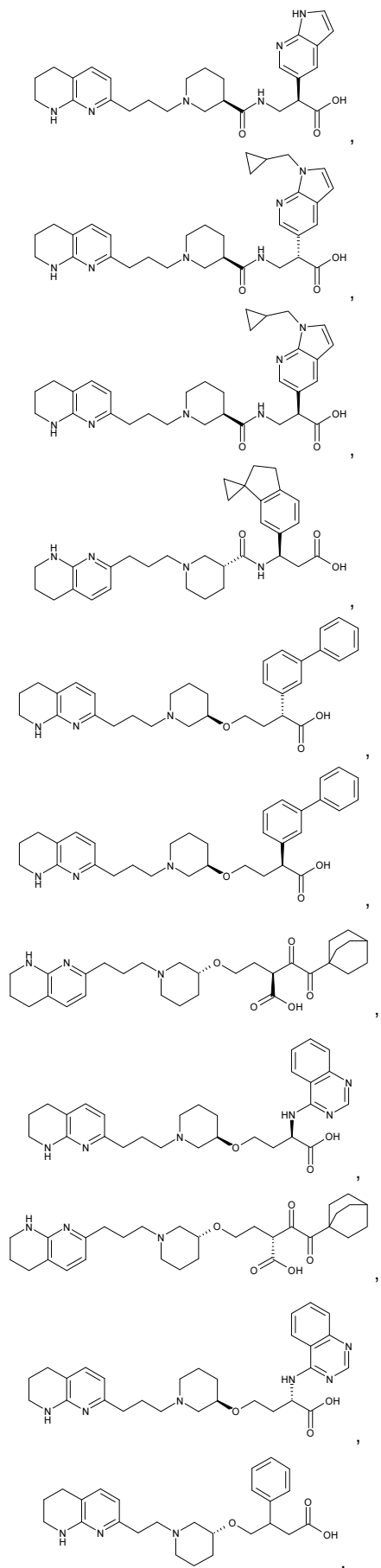
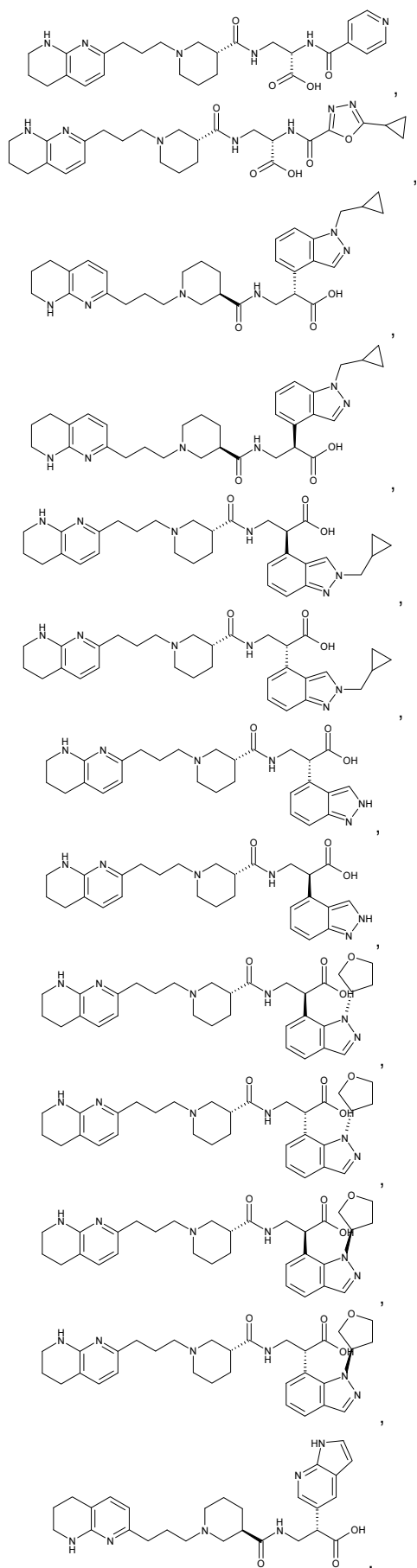


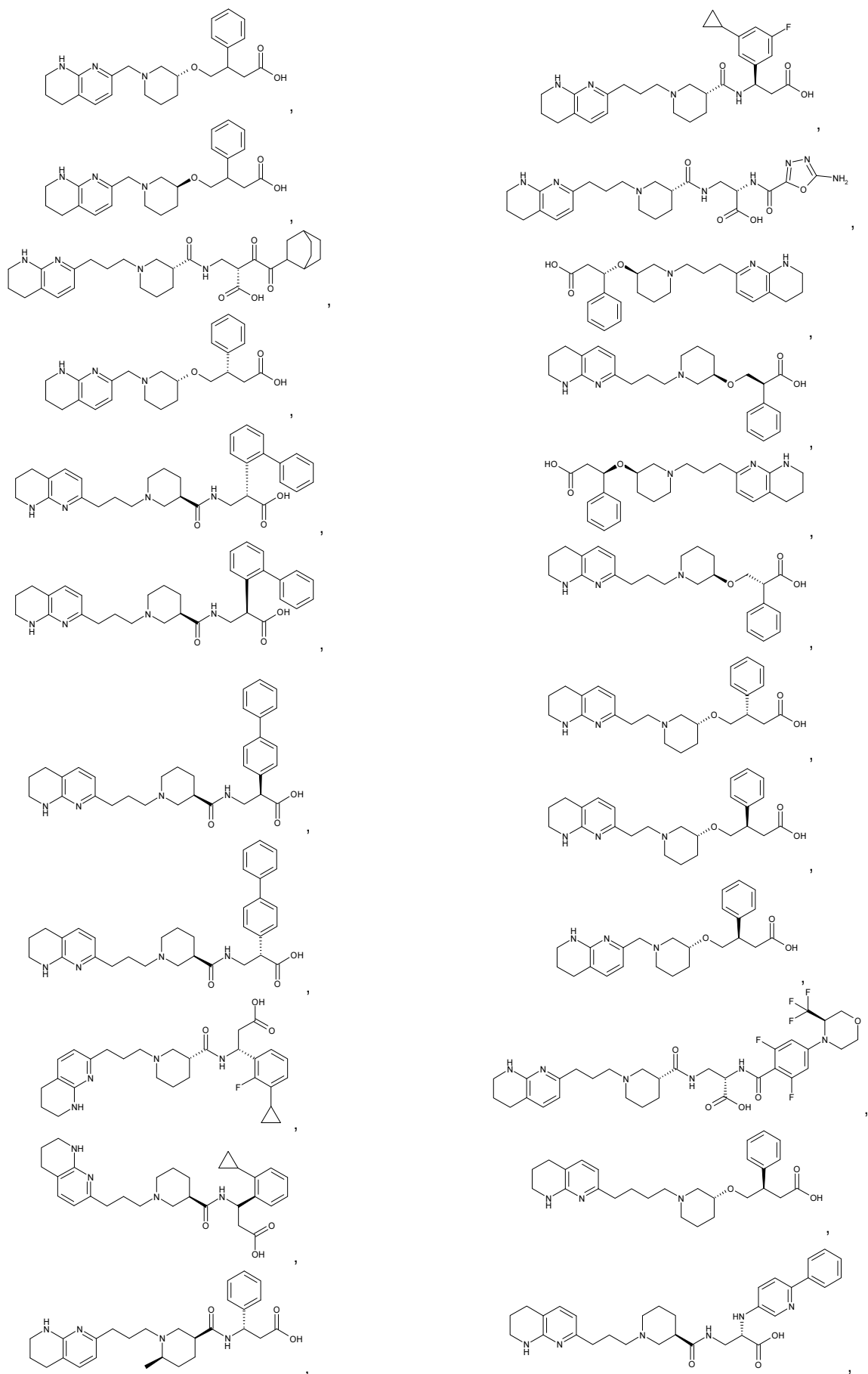
79. Сполука або сіль за будь-яким з пп. 51-54, де В вибраний з:

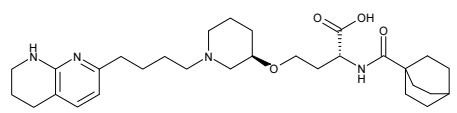
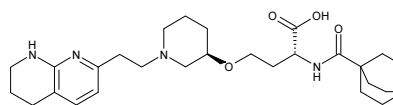
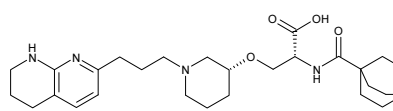
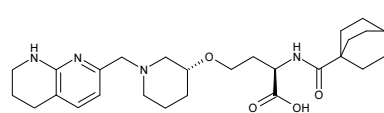
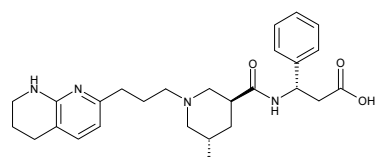
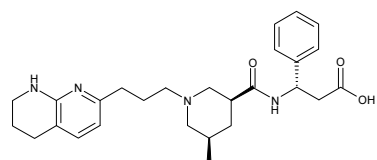
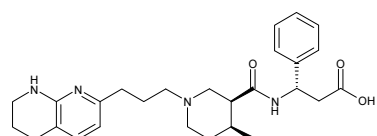
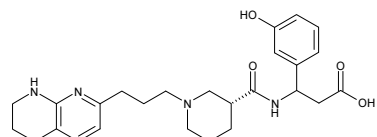
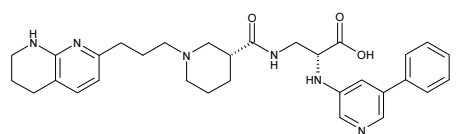
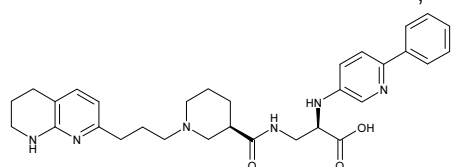
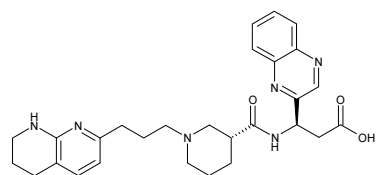
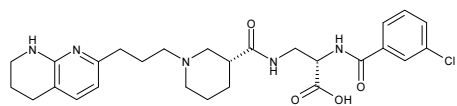
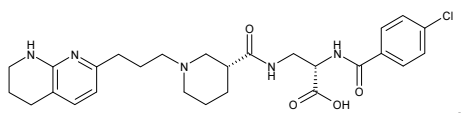
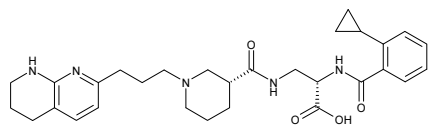
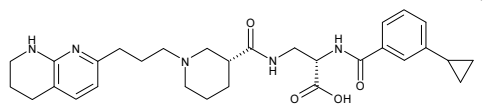
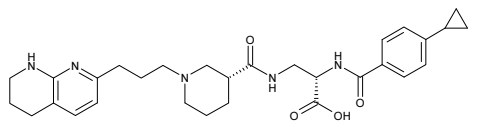
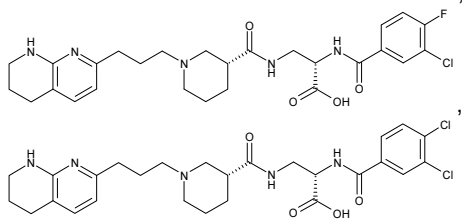
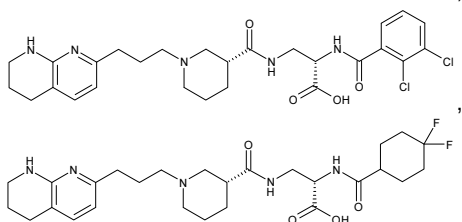
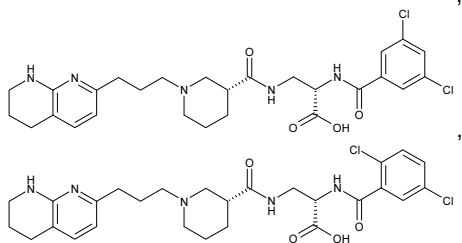
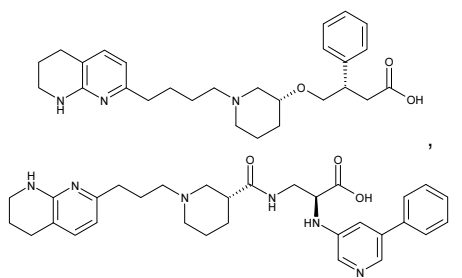
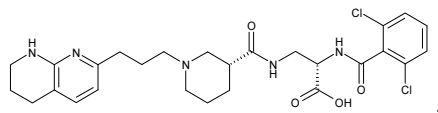
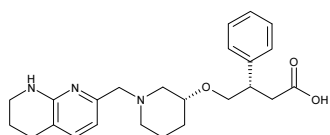


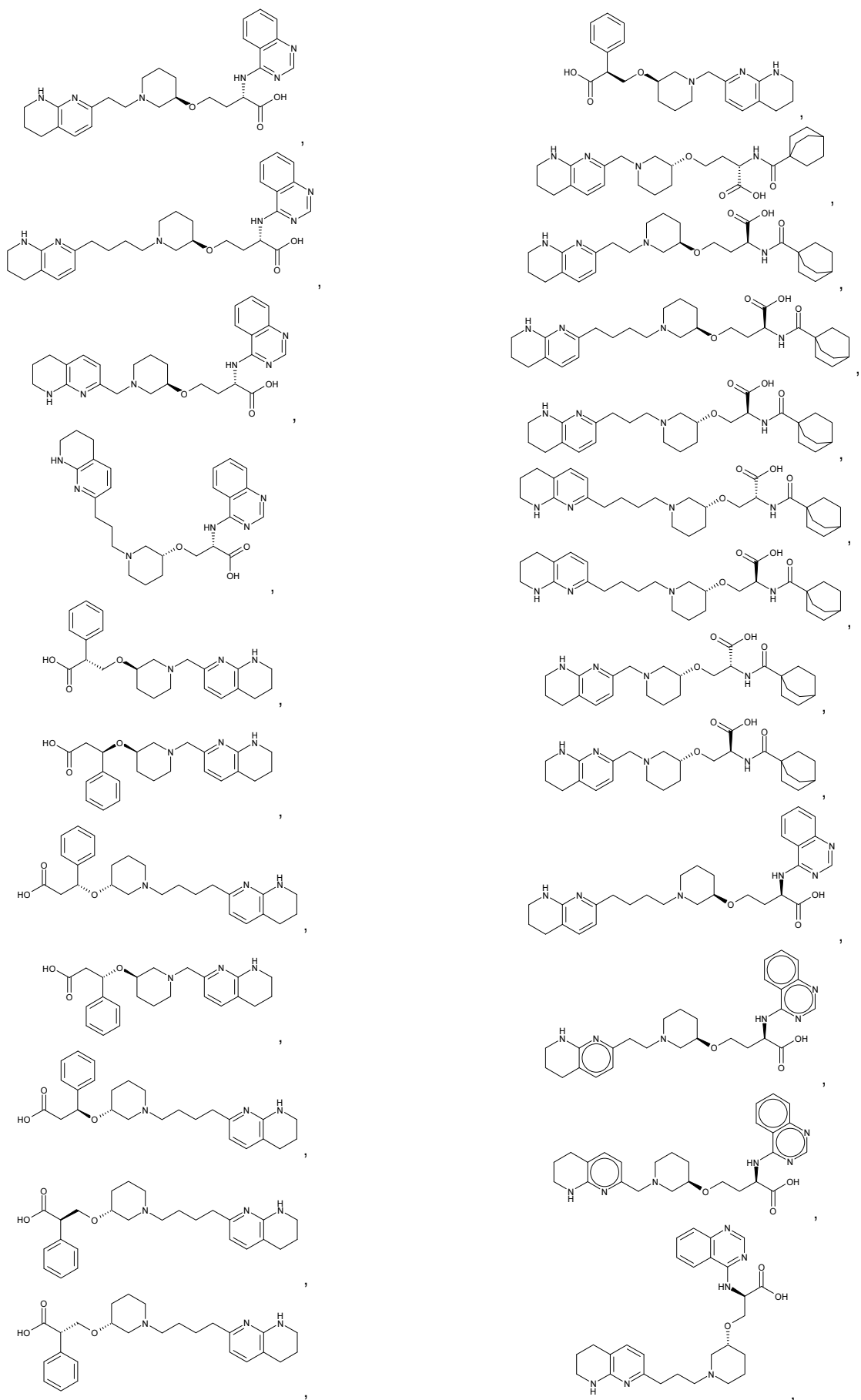
80. Сполука або сіль за п. 41, де сполука Формули (Ia) вибрана з:

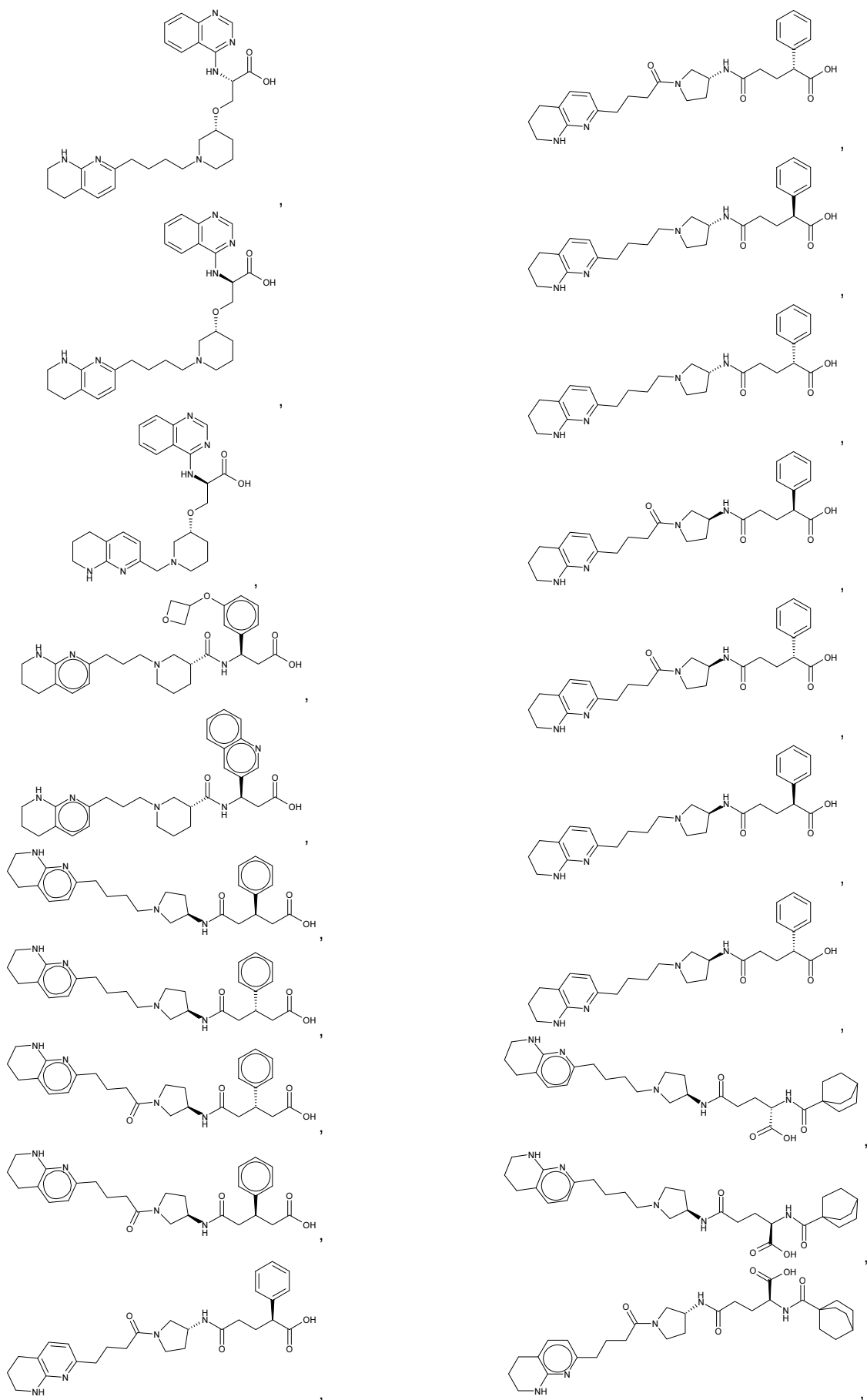


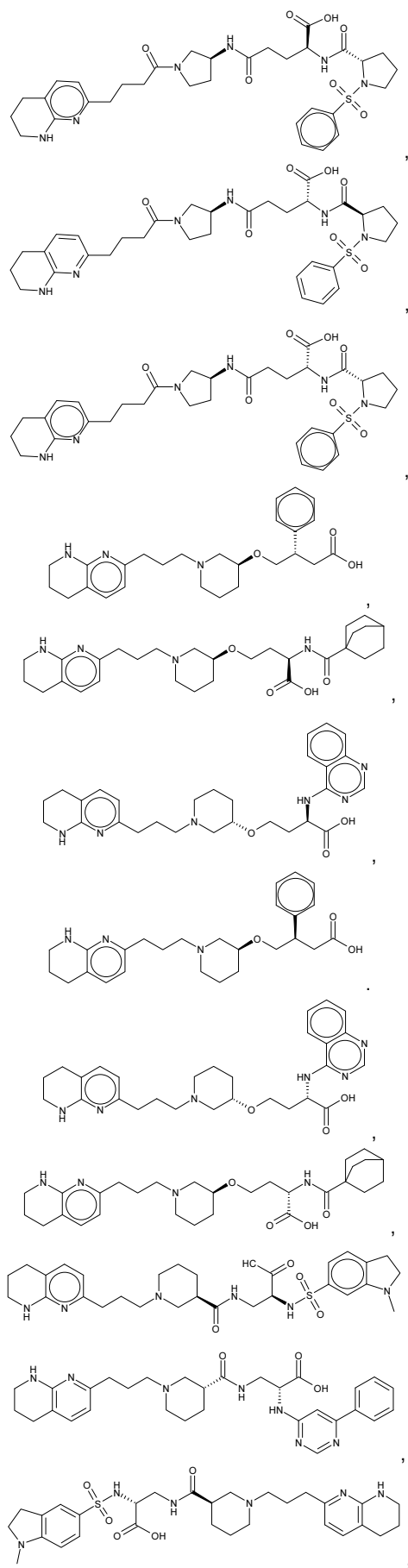
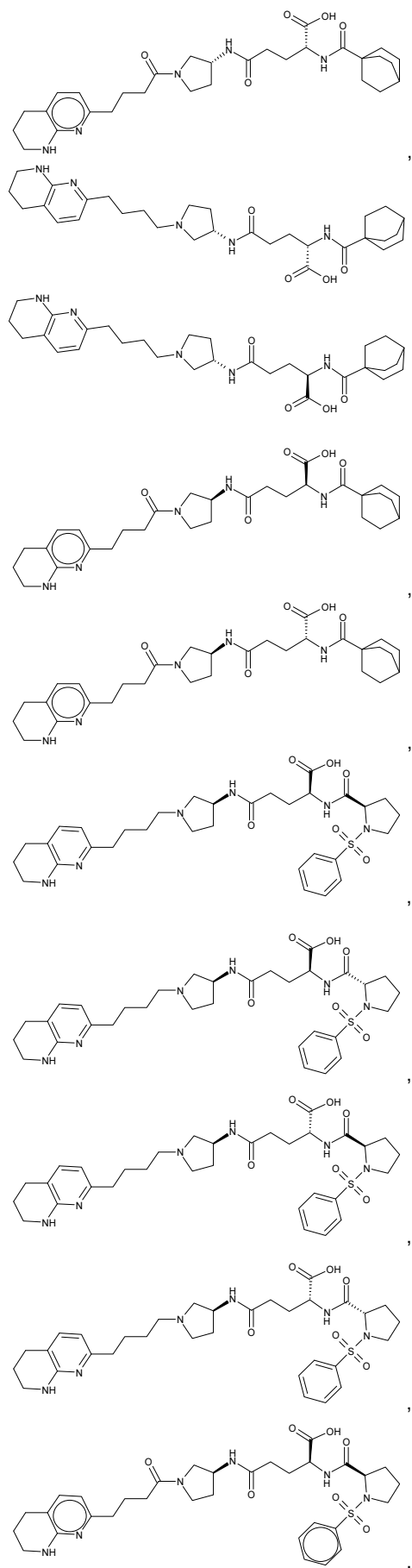


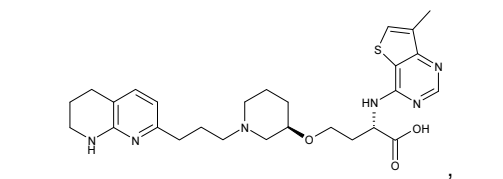
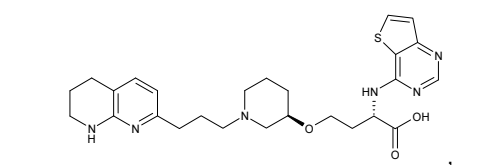
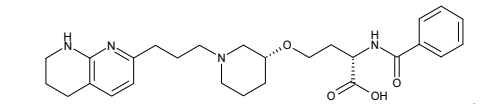
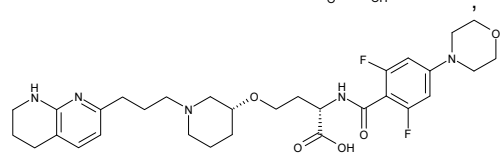
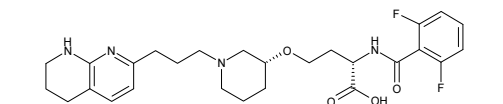
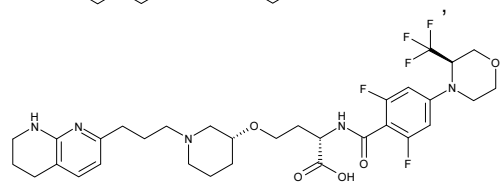
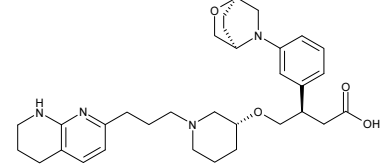
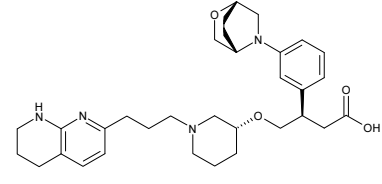
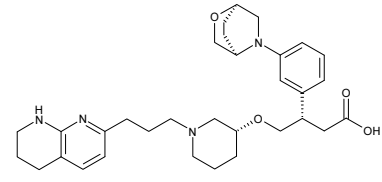
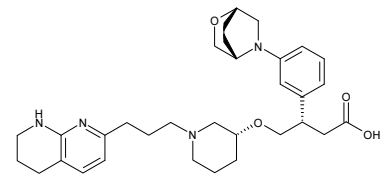
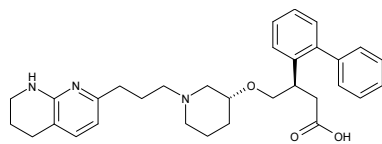
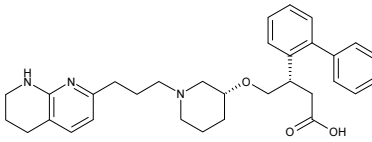
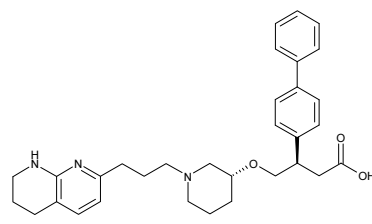
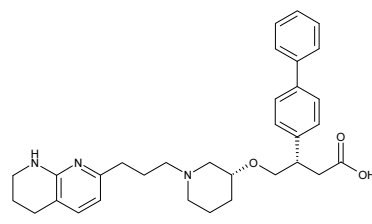
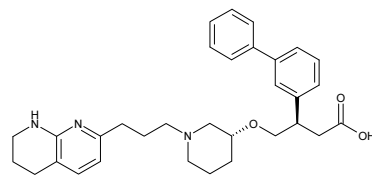
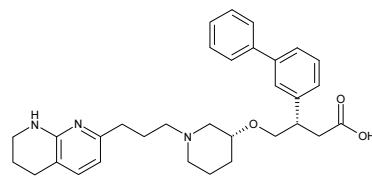
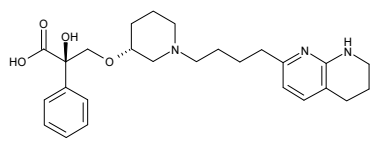
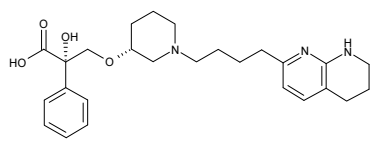
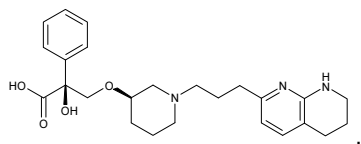
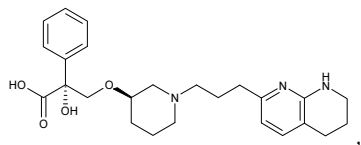
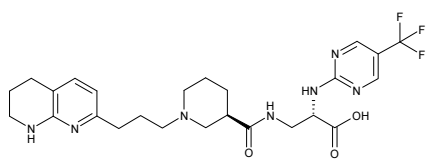


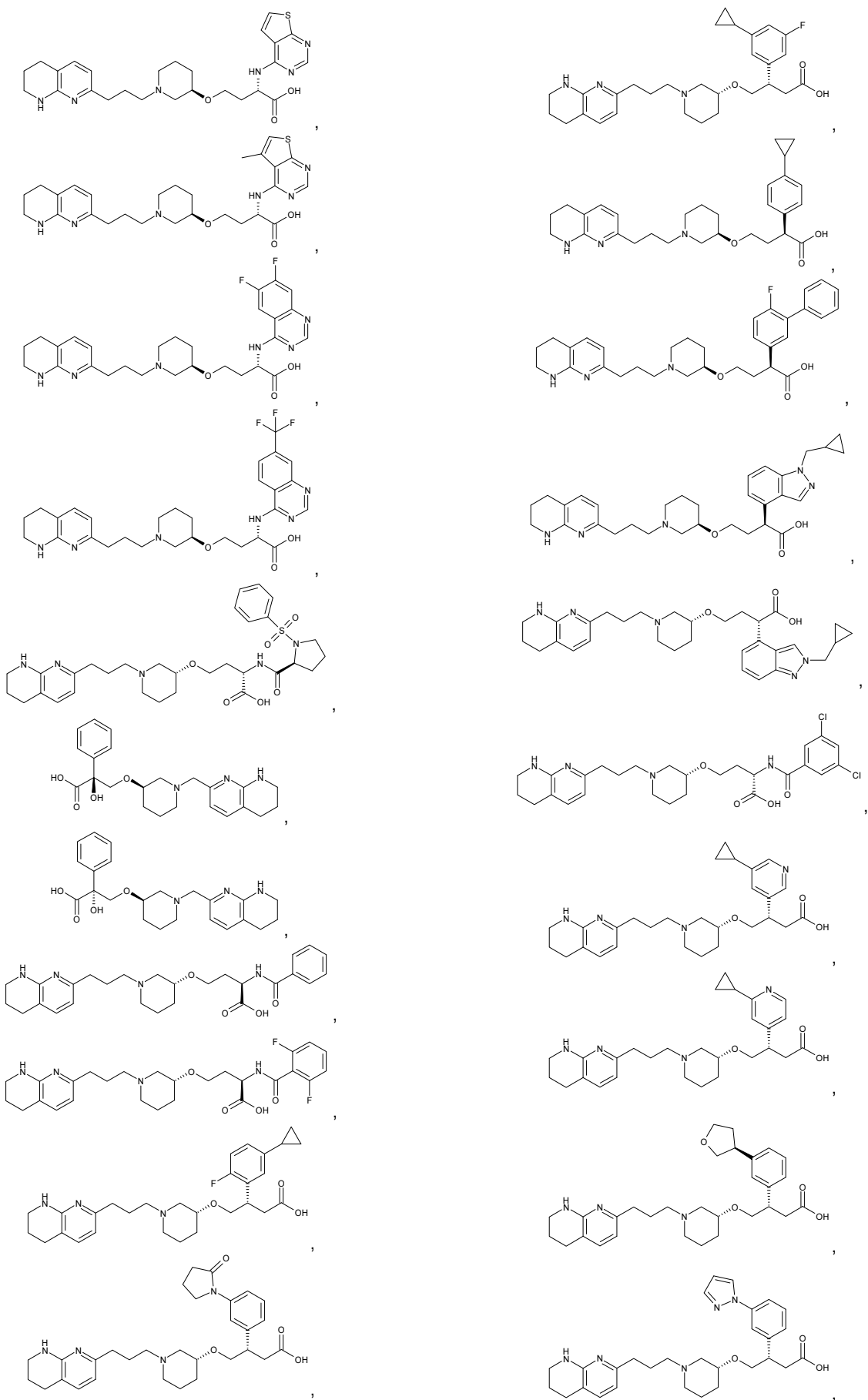


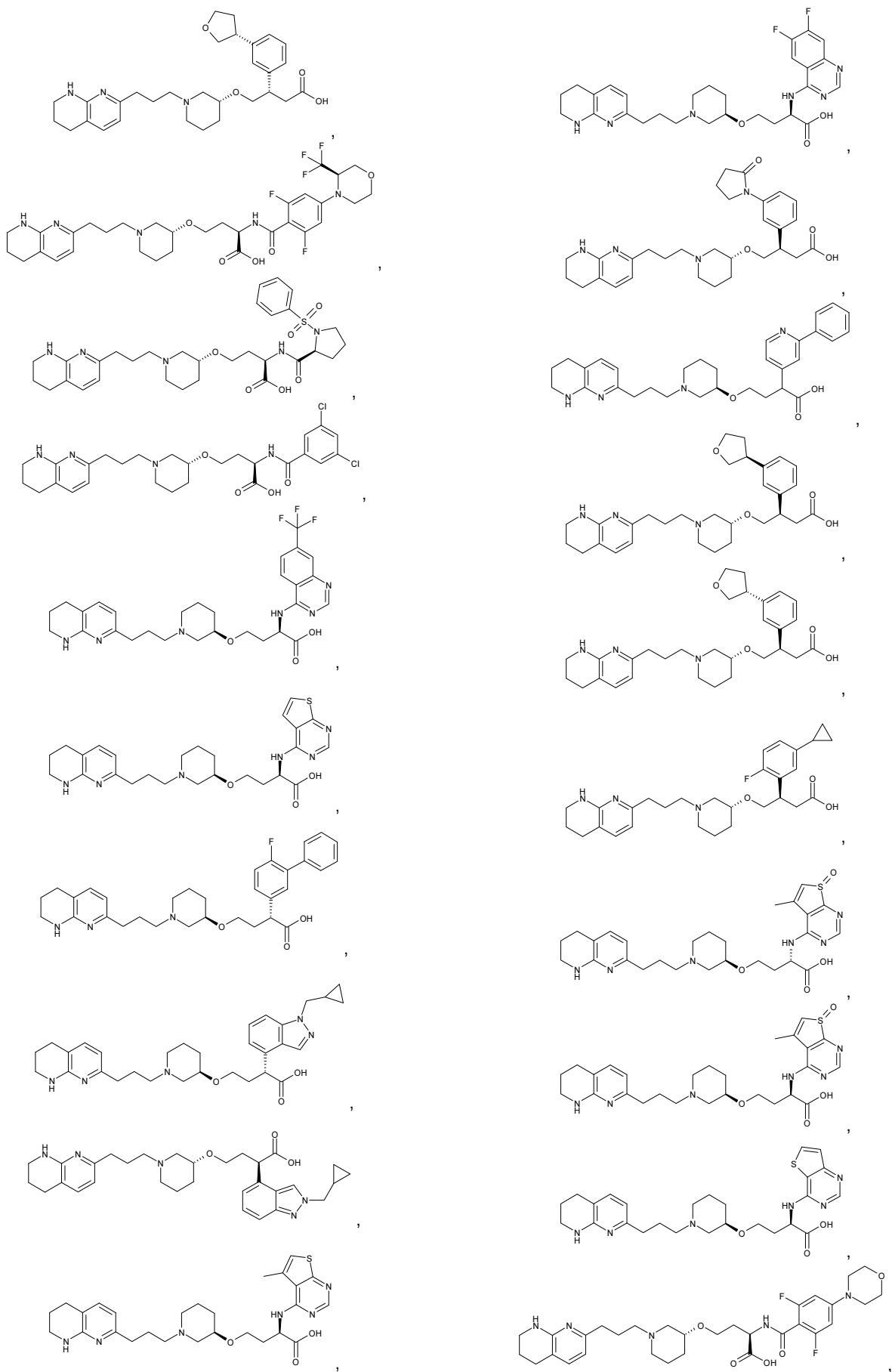


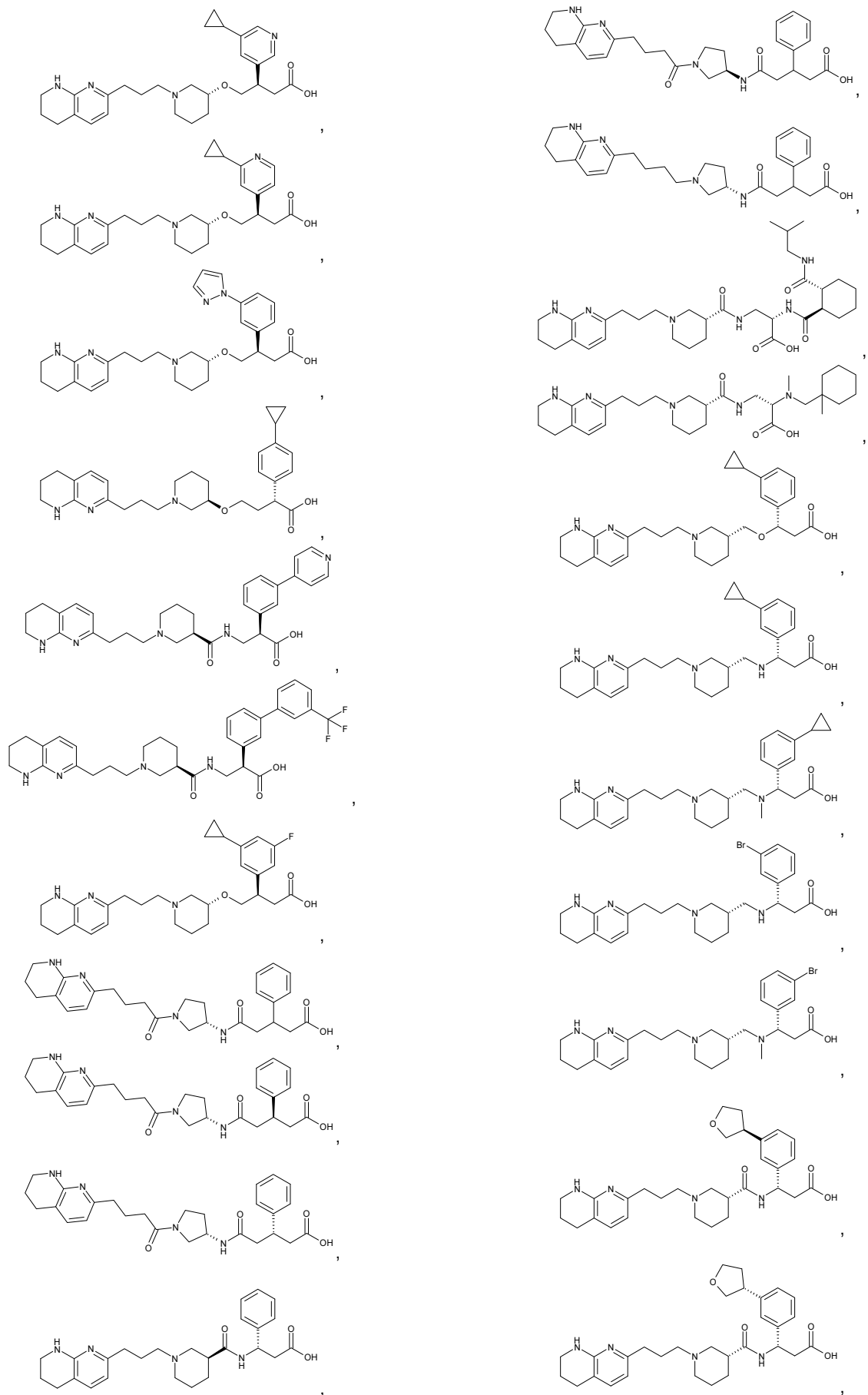


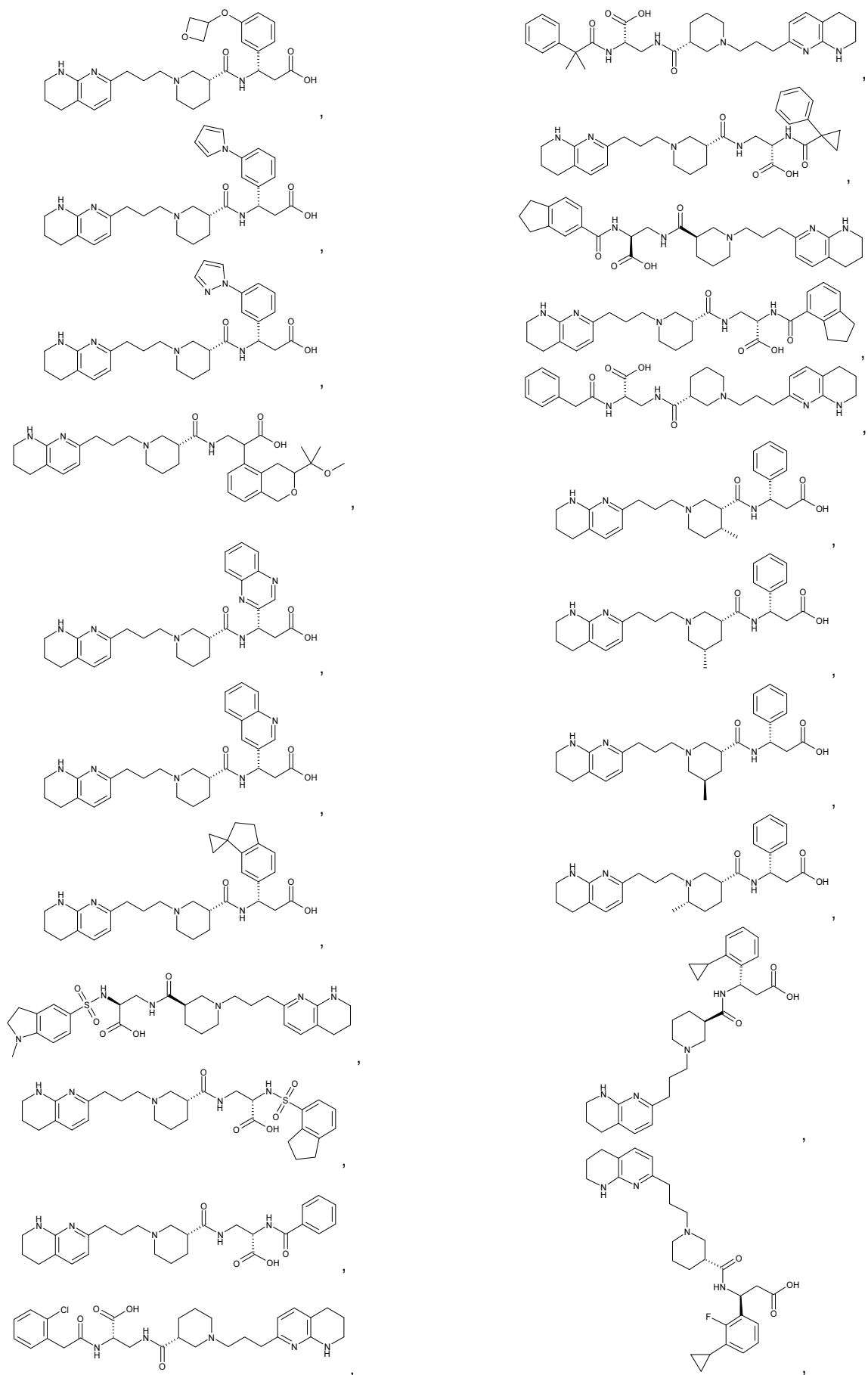


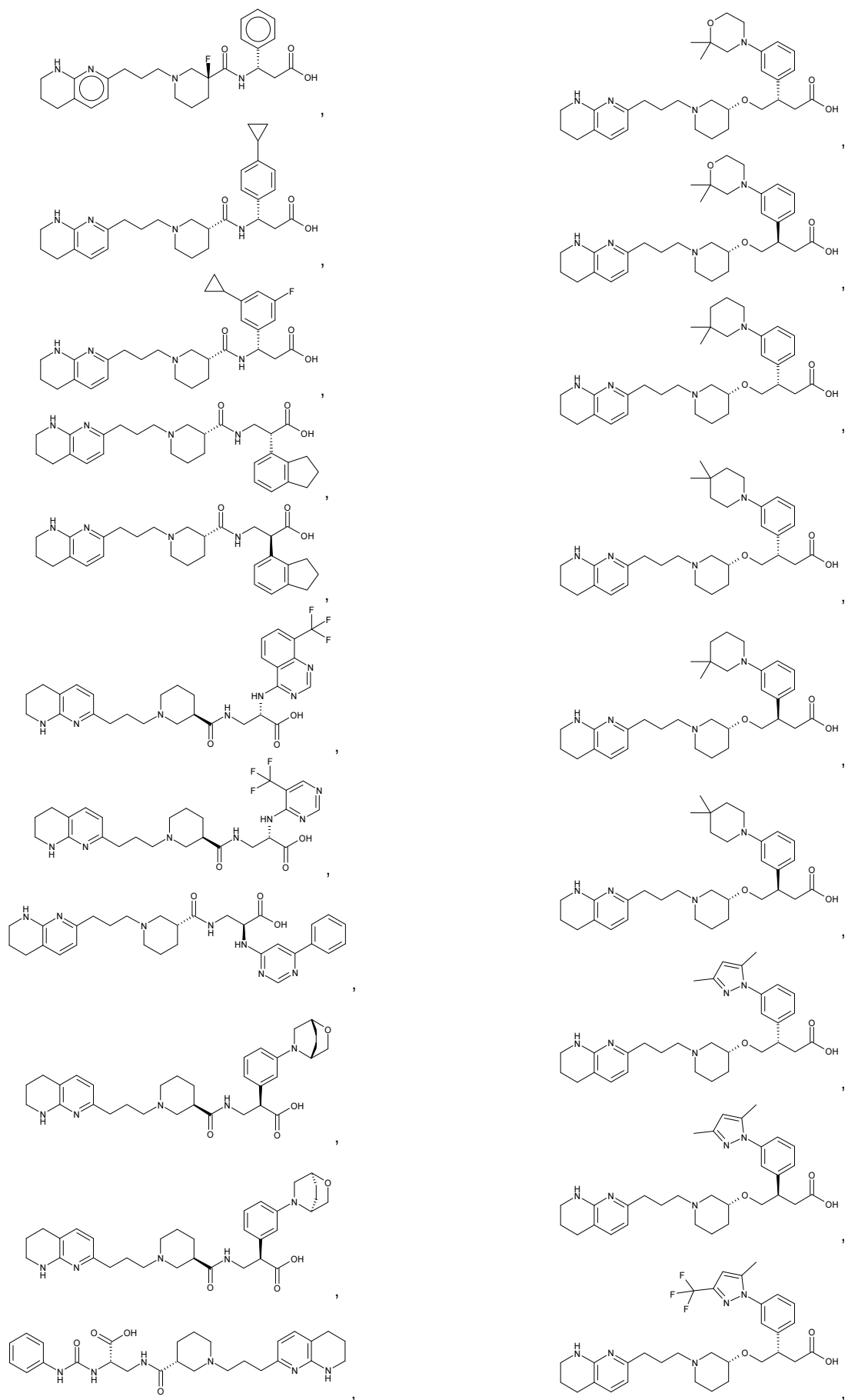


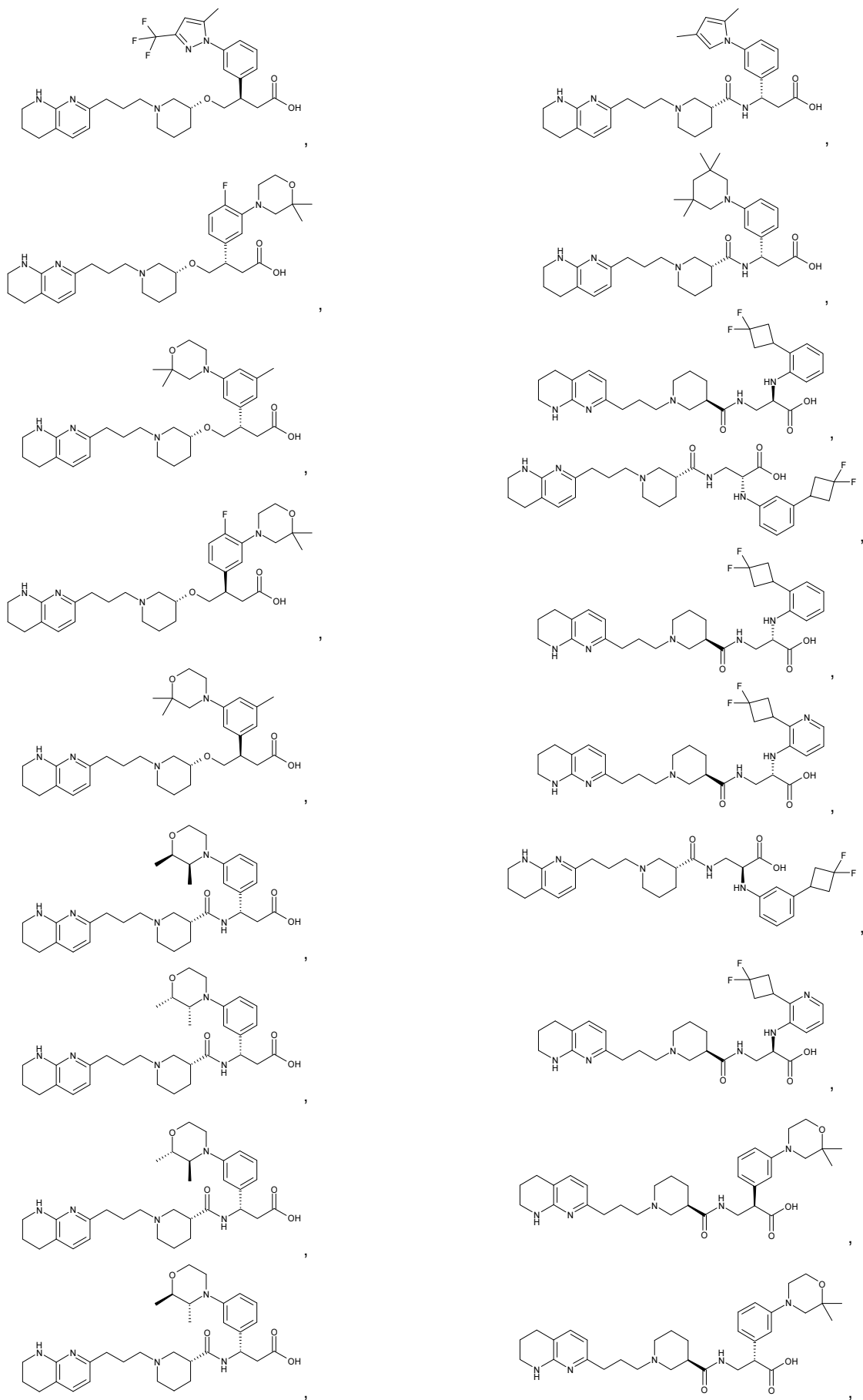


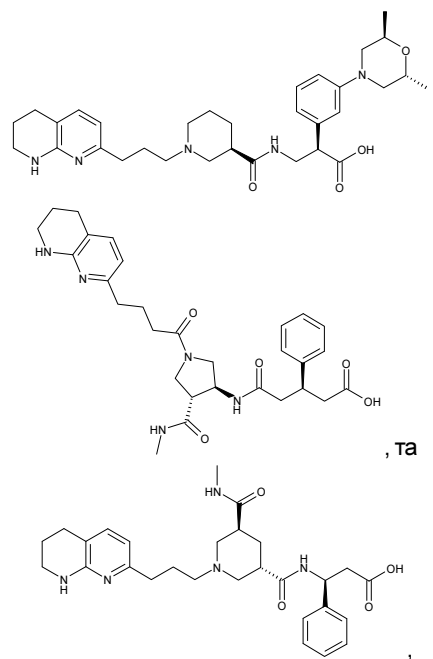
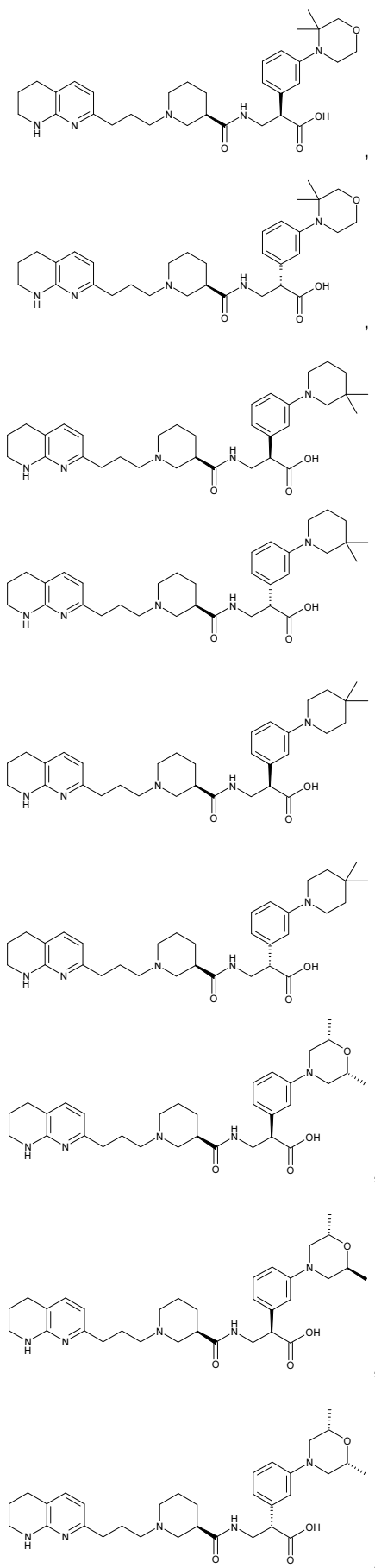












або їх фармацевтично прийнятні солі.

81. Фармацевтична композиція, що містить фармацевтично прийнятні допоміжні речовини і сполуку або сіль за будь-яким з пп. 1-80.

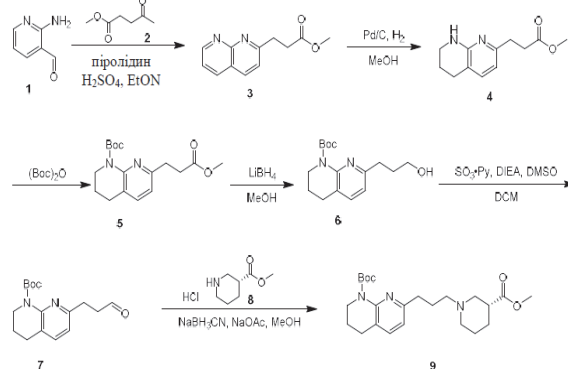
82. Спосіб модуляції інтегрину альфа V у суб'єкта, що цього потребує, який включає введення згаданому суб'єкту сполуки або солі за будь-яким з пп. 1-80 або фармацевтичної композиції за п. 81.

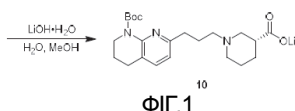
83. Спосіб за п. 82, де інтегрин альфа V являє собою інтегрин альфа V бета 1.

84. Спосіб за п. 82, де інтегрин альфа V являє собою інтегрин альфа V бета 6.

85. Спосіб лікування захворювання або стану, який включає введення суб'єкту, що цього потребує, сполуки або солі за будь-яким з пп. 1-80 або фармацевтичної композиції за п. 81.

86. Спосіб за п. 85, де захворювання або стан вибрані з-посеред: ідіоматичний легеневий фіброз, асоційоване із системним червоним вовчаком інтерстиціальне захворювання легень, ревматоїдний артрит, діабетична нефропатія, фокальний сегментарний гломерулосклероз, хронічна хвороба нирок, неалкогольний стеатогепатит, первинний біліарний холангіт, первинний склерозуючий холангіт, солідні пухлини, гематологічні пухлини, трансплантація органів, синдром Альпорта, інтерстиціальне захворювання легень, індукований радіацією фіброз, індукований блеоміцином фіброз, індукований азбестом фіброз, індукований грипом фіброз, індукований коагуляцією фіброз, індукований судинним ураженням фіброз, аортальний стеноз та серцевий фіброз.





(21) а 2023 04574
(22) 15.03.2022

(51) МПК (2024.01)
А61Р 29/00
А61Р 31/18 (2006.01)
А61К 31/7072 (2006.01)

(31) 63/161,050
(32) 15.03.2021
(33) US

(85) 13.10.2023

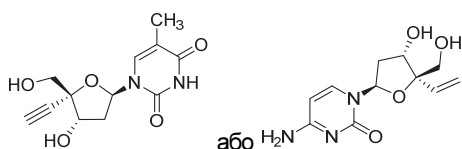
(86) РСТ/US2022/020362, 15.03.2022

(71) ТРАНСПОЗОН ТЕРАПЬЮТИКС, ІНК. (US)

(72) Вебер Екард (US), Кордінглі Майкл Г. (CA)

(54) ІНГІБІТОРИ LINE-1 ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ЗАХВОРЮВАНЬ ЦНС ТА СИСТЕМНИХ ЗАХВОРЮВАНЬ

(57) 1. Інгібітор LINE-1 або його фармацевтична композиція для застосування у лікуванні або запобіганні захворювання у суб'єкта, який потребує цього, що включає введення зазначеному суб'єкту терапевтично ефективної кількості інгібітора LINE-1 або його фармацевтичної композиції, де зазначене захворювання являє собою атаксію-телеангіектазію, вікову макулярну дегенерацію, системний червоний вовчак, ІФН-асоційоване аутоімунне захворювання, анемію Фанконі, ідіопатичний фіброз легень або серцево-судинне захворювання, і зазначений інгібітор LINE-1 являє собою ценсавудин,



2. Інгібітор LINE-1 або його фармацевтична композиція для застосування за п. 1, у якому зазначене захворювання являє собою атаксію-телеангіектазію.

3. Інгібітор LINE-1 або його фармацевтична композиція для застосування за п. 1, у якому зазначене захворювання являє собою вікову макулярну дегенерацію.

4. Інгібітор LINE-1 або його фармацевтична композиція для застосування за п. 1, у якому зазначене захворювання являє собою системний червоний вовчак.

5. Інгібітор LINE-1 або його фармацевтична композиція для застосування за п. 1, у якому зазначене захворювання являє собою ІФН-асоційоване аутоімунне захворювання.

6. Інгібітор LINE-1 або його фармацевтична композиція для застосування за п. 5, у якому зазначене захворювання являє собою псоріаз.

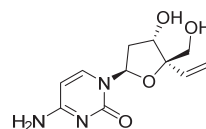
7. Інгібітор LINE-1 або його фармацевтична композиція для застосування за п. 1, у якому зазначене захворювання являє собою анемію Фанконі.

8. Інгібітор LINE-1 або його фармацевтична композиція для застосування за п. 1, у якому зазначене захворювання являє собою ідіопатичний фіброз легень.

9. Інгібітор LINE-1 або його фармацевтична композиція для застосування за п. 1, у якому зазначене захворювання являє собою серцево-судинне захворювання.

10. Інгібітор LINE-1 або його фармацевтична композиція для застосування за будь-яким з пп. 1-9, у якому зазначений інгібітор LINE-1 являє собою ценсавудин.

11. Інгібітор LINE-1 або його фармацевтична композиція для застосування за будь-яким з пп. 1-9, у якому зазначений інгібітор LINE-1 являє собою



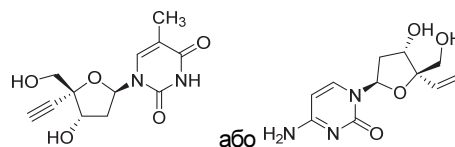
12. Інгібітор LINE-1 або його фармацевтична композиція для застосування за будь-яким з пп. 1-11 для лікування захворювання.

13. Інгібітор LINE-1 або його фармацевтична композиція для застосування за будь-яким з пп. 1-11 для запобігання захворювання.

14. Інгібітор LINE-1 або його фармацевтична композиція для застосування за будь-яким з пп. 1-13, у якому лікування або запобігання додатково включає введення суб'єкту одного або більше необов'язкових терапевтичних агентів.

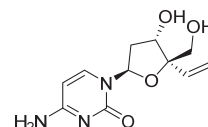
15. Інгібітор LINE-1 або його фармацевтична композиція для застосування за будь-яким з пп. 1-14, у якому зазначений суб'єкт (а) не інфікований вірусом ВІЛ, (б) не підозрюється в інфікуванні вірусом ВІЛ та/або (с) не проходить лікування для запобігання інфікуванню вірусом ВІЛ.

16. Набір, який містить інгібітор LINE-1 або його фармацевтичну композицію та інструкції щодо введення інгібітора LINE-1 або його фармацевтичної композиції суб'єкту, який має захворювання, де зазначене захворювання являє собою атаксію-телеангіектазію, вікову макулярну дегенерацію, системний червоний вовчак, ІФН-асоційоване аутоімунне захворювання, анемію Фанконі, ідіопатичний фіброз легень або серцево-судинне захворювання, і зазначений інгібітор LINE-1 являє собою ценсавудин,



17. Набір за п. 16, у якому зазначений інгібітор LINE-1 являє собою ценсавудин.

18. Набір за п. 16, у якому зазначений інгібітор LINE-1 являє собою



19. Набір за будь-яким з пп. 16-18, який додатково містить один або більше необов'язкових терапевтичних агентів.

20. Набір за будь-яким з пп. 16-19, у якому зазначений суб'єкт (а) не інфікований вірусом ВІЛ, (б) не підозрюється в інфікуванні вірусом ВІЛ та/або (с) не проходить лікування для запобігання інфікуванню вірусом ВІЛ.

(21) а 2023 05728
(22) 09.05.2022

(51) МПК (2024.01)
А61Р 35/00
А61Р 1/00

A61P 9/00
 A61P 11/00
 A61P 21/00
 A61P 25/16 (2006.01)
 A61P 27/02 (2006.01)
 A61P 29/00
C07D 491/048 (2006.01)
C07D 491/107 (2006.01)
C07D 498/04 (2006.01)
C07D 498/10 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61K 31/5386 (2006.01)
A61K 31/444 (2006.01)
C07D 213/74 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)

(31) 21173689.7

(32) 12.05.2021

(33) EP

(85) 12.12.2023

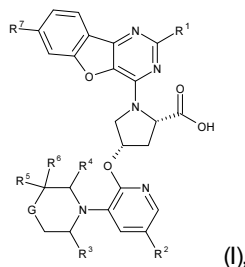
(86) РСТ/ЕР2022/062480, 09.05.2022

(71) БЬОРИНГЕР ИНГЕЛЬХАЙМ ІНТЕРНАЦІОНАЛЬ ГМБХ (DE)

(72) Хайманн Аннекатрін Шарлотте (DE), Гнамм Крістіан (DE), Годбу Седрікс (DE), Гросс Патрік (DE), Хандшу Сандра Рут (DE), Хьонке Крістоф (DE), Клей Йорг (DE), Куттурфф Крістіан Андреас (DE), Райнерт Дірк (DE), Штубер Рафаель (DE), Грундль Марк Александер (DE), Тайс Теодор (DE)

(54) ПІРИДИНОВІ ПОХІДНІ З N-ПРИСЇДНАНИМИ ЦИКЛІЧНИМИ ЗАМІСНИКАМИ ЯК ІНГІБІТОРИ cGAS

(57) 1. Сполука формули (I),



де

R¹ вибраний із метилу, етилу, галогенметилу, галогенетилу і галогену,

де

G вибраний із O, NR⁸, CH₂, C і CR⁸R⁹,

де

R² вибраний із H, галогену, циклопропілу, C₁₋₃-алкілу, -C₂₋₅-алкінілу, -S-метилу і CN,

або де R² являє собою циклічну групу, де ця циклічна група вибрана із групи, яка складається із фенілу або п'ятишестичленного гетероарилу, який містить 1, 2, 3 або 4 гетероатоми, кожний із яких незалежно вибраний із N, S і O, де ця циклічна група заміщена одним або двома, однаковими або різними замісниками R¹⁰,

де

R³ являє собою H або метил,

R⁴ являє собою H або метил,

R⁵ вибраний із H, метилу, -CN, -метилену-ОН і -CF₃,

або R⁵ може бути відсутнім,

R⁶ вибраний із H, метилу, -CN, -метилену-ОН і -CF₃, або R⁵ і R⁶ разом з C-атомами між ними утворюють кільце, вибране із оксетану, тетрагідрофурану і циклопропану,

R⁷ вибраний із H, галогену, (C₁₋₃)-алкілу і галоген-(C₁₋₃)-алкілу,

R⁸ вибраний із CN, H і метилу,

R⁹ вибраний із H, метилу і галогену,

або R⁹ може бути відсутнім,

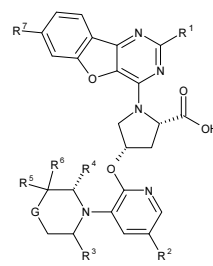
де кожний R¹⁰ незалежно вибраний із групи, яка складається із водню, галогену, галогеналкілу, -метилу, -етилу, -NH-CO-метилу, -N(CH₃)₂, -CH₂-OH, -NH(CH₃), -O-(C₁₋₃-алкілу), -CN, -S-CH₃, -CO-NH₂, -CH₂-NH(CH₃), -CH₂-NH₂, -SO-(CH₃), циклопропілу і -O-R¹¹,

де R¹¹ являє собою п'яти- або шестичленний гетероцикл з одним або двома гетероатомами, кожний із яких незалежно вибраний із N, O і S,

або G являє собою CR⁸R⁹, R⁵ і R⁹ відсутні, і R⁸ і R⁶ і два C-атоми між R⁸ і R⁶ утворюють анельований п'ятичленний ароматичний або неароматичний гетероцикл, який містить один, два або три гетероатоми, кожний із яких незалежно вибраний із N, S і O,

або G являє собою CR⁸R⁹, R⁵ і R⁹ відсутні, і R⁸ і R⁹ утворюють разом з C-атомом між R⁸ і R⁹ діазиринове кільце, та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.

2. Сполука за п. 1 формули (I'),



де R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹ і G мають значення, зазначені в п. 1,

та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.

3. Сполука формули (I) за п. 1 або формули (I') за п. 2, де R⁷ вибраний із H, F, Cl, метилу, етилу, галогенметилу і галогенетилу,

та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.

4. Сполука формули (I) за п. 1 або формули (I') за п. 2, де R¹ вибраний із галогенметилу, галогенетилу і метилу,

і її проліки або фармацевтично прийнятні солі.

5. Сполука за п. 3, де R¹ являє собою фторметил, вибраний із групи, яка складається із -CF₃, -CHF₂ і -CH₂F, та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.

6. Сполука формули (I) за п. 1 або формули (I') за п. 2, де щонайменше один із R³ і R⁴ являє собою метил, та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.

7. Сполука формули (I) за п. 1 або формули (I') за п. 2, де один із R³ і R⁴ являє собою метил, а інший являє собою H,

та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.

8. Сполука формули (I) за п. 1 або формули (I') за п. 2, де G являє собою O,

та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.

9. Сполука формули (I) за п. 1 або формули (I') за п. 2,

де G являє собою O,

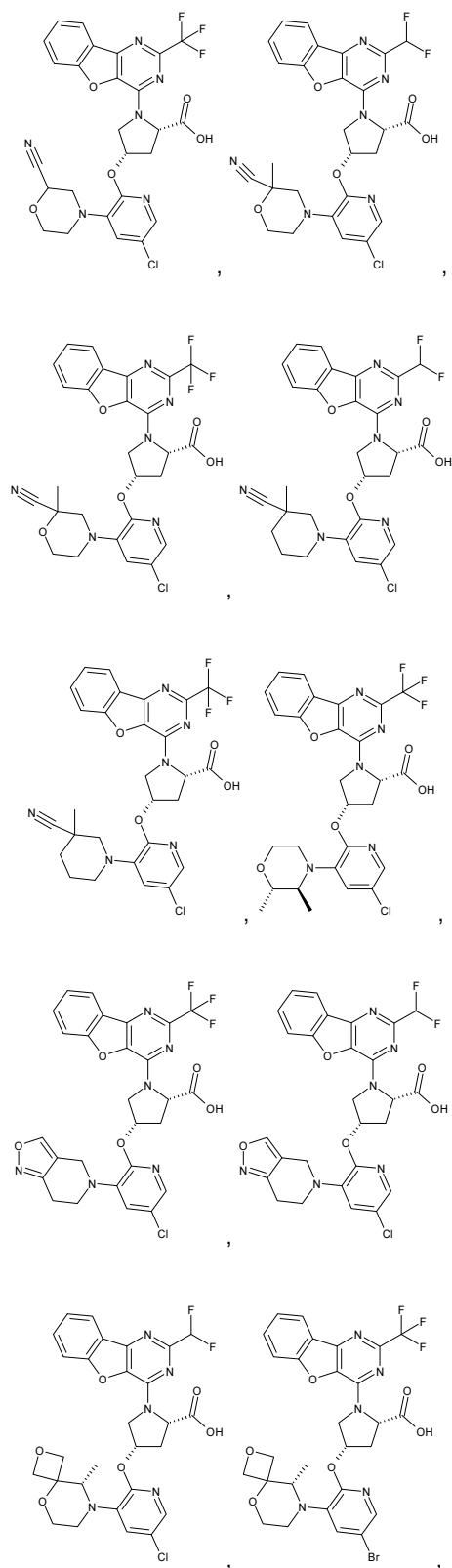
і де один із R³ або R⁴ являє собою метил, а інший являє собою H,

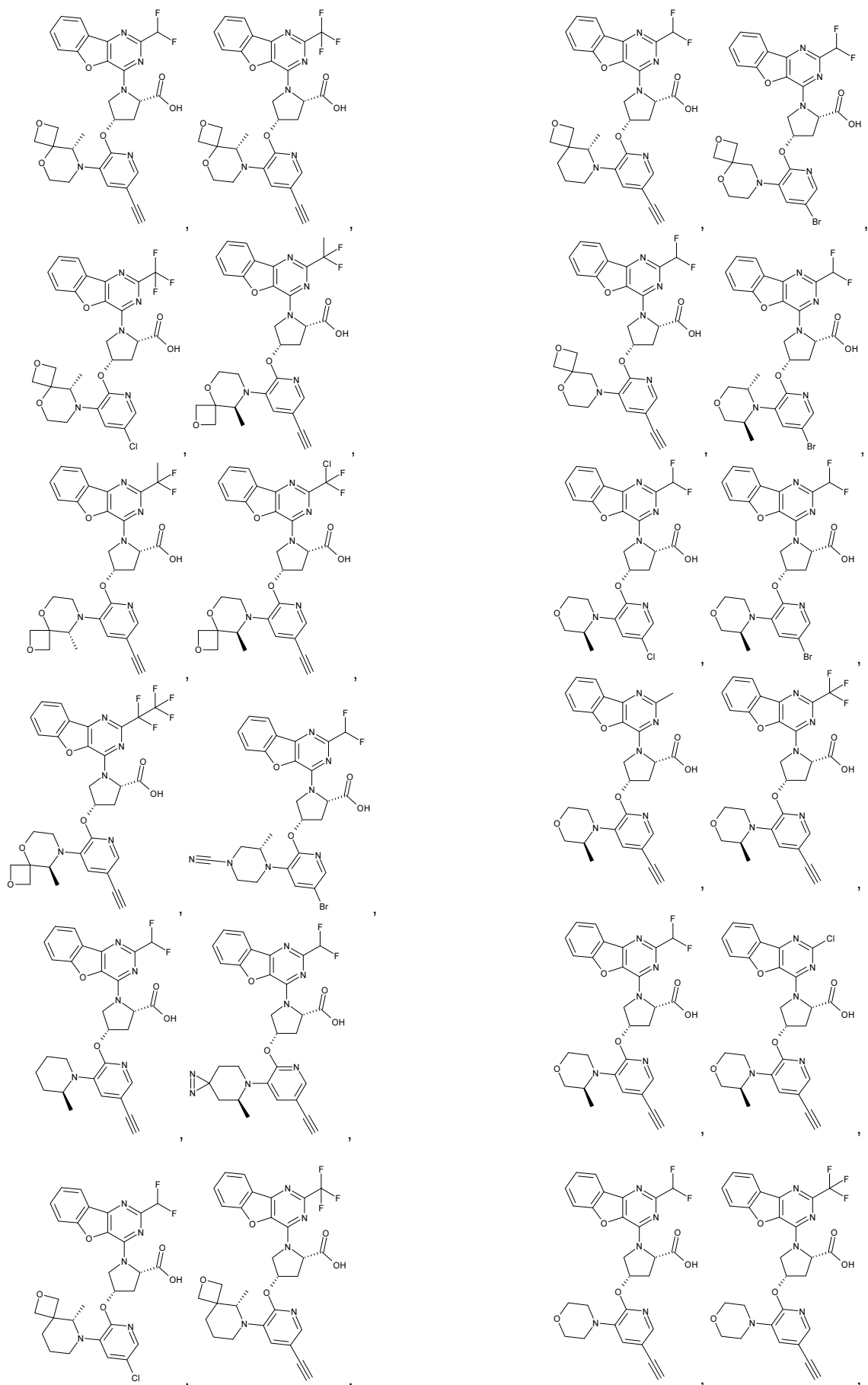
та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.

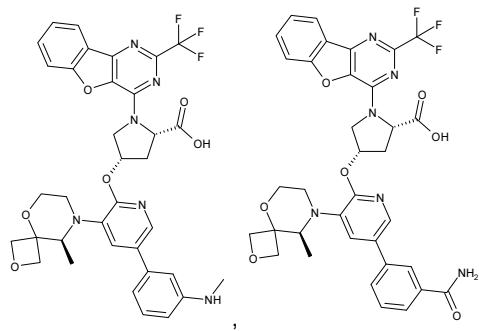
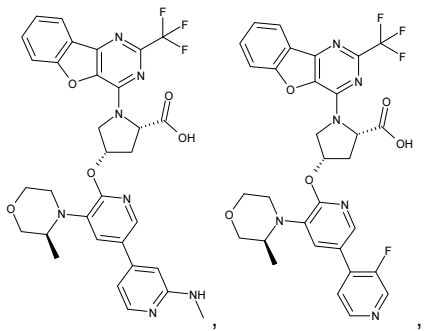
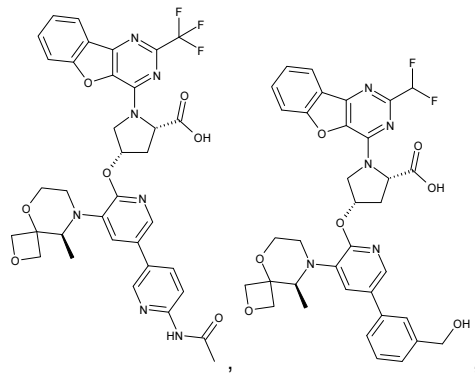
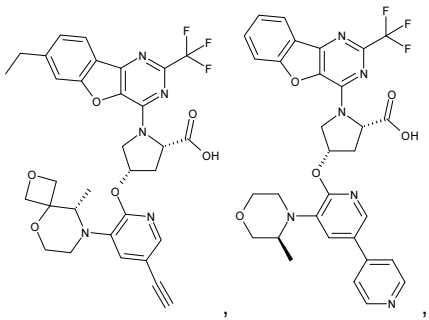
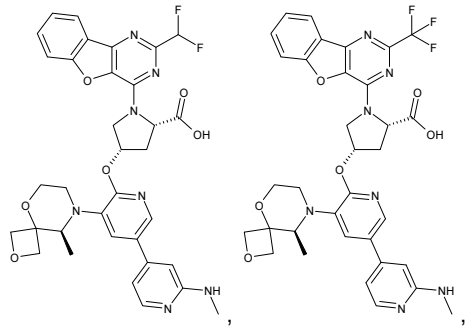
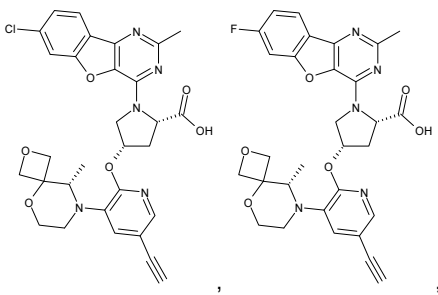
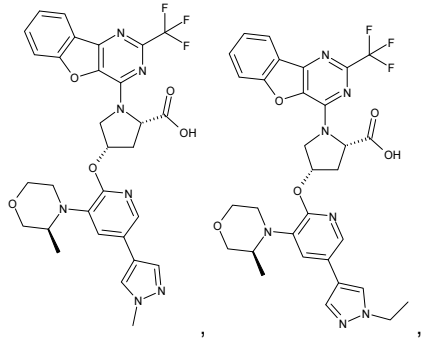
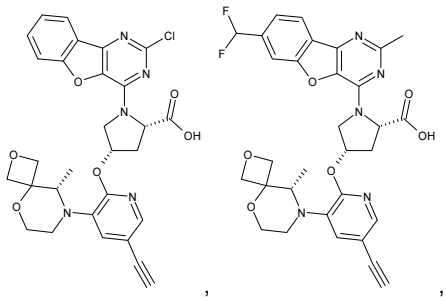
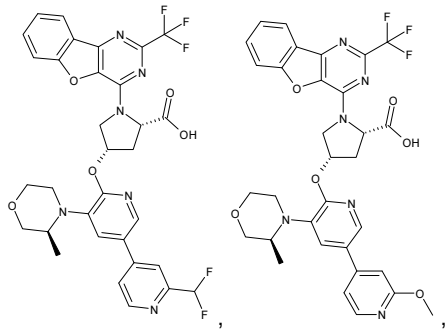
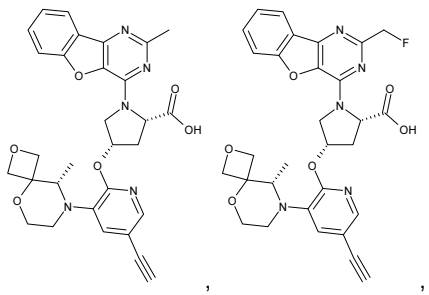
10. Сполука за п. 8,
де R^4 являє собою метил, і R^3 являє собою H,
де R^5 і R^6 разом з C-атомами між ними утворюють оксетанове кільце,
та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.
11. Сполука формули (I) за п. 1 або формули (I') за п. 2,
де R^2 вибраний із групи, яка складається із H, етинілу, 1-пропінілу, -S-метилу, галогену,
та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.
12. Сполука формули (I) за п. 1 або формули (I') за п. 2,
де R^2 являє собою етиніл,
та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.
13. Сполука формули (I) за п. 1 або формули (I') за п. 2,
де R^4 являє собою метил і R^3 являє собою H,
де G являє собою O,
де R^5 і R^6 разом утворюють оксетанове кільце,
де R^2 вибраний із групи, яка складається із H, етинілу, 1-пропінілу, -S-метилу, галогену,
та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.
14. Сполука формули (I) за п. 1 або формули (I') за п. 2,
де R^2 являє собою циклічну групу, де циклічна група вибрана із групи, яка складається із фенілу або п'ятишестичленного гетероарилу, який містить 1, 2 або 3 гетероатоми, які вибрані із N, S і O, де ця циклічна група заміщена одним або двома, однаковими або різними замісниками R^{10} ,
де кожний R^{10} незалежно вибраний із групи, яка складається із водню, галогену, галогеналкілу, -метилу, -етилу, -NH-CO-метилу, -N(CH₃)₂, -CH₂-OH, -NH(CH₃), -O-CH₃, -CN, -S-CH₃, -CO-NH₂, -CH₂-NH(CH₃), -CH₂-NH₂, -SO-(CH₃), циклопропілу і -O-R¹¹,
де кожний R^{11} вибраний із п'яти- або шестичленного гетероциклу з одним або двома гетероатомами, кожний із яких незалежно вибраний із N і O,
та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.
15. Сполука за п. 14, де R^2 являє собою циклічну групу, вибрану із групи, яка складається із піразолілу, піридинілу, імідазолілу, фенілу і ізоксазолілу,
де ця циклічна група заміщена одним або двома, однаковими або різними замісниками R^{10} ,
де кожний R^{10} незалежно вибраний із групи, яка складається із водню, галогену, галогеналкілу, -метилу, -етилу, -NH-CO-метилу, -N(CH₃)₂, -CH₂-OH, -NH(CH₃), -O-CH₃, -CN, -S-CH₃, -CO-NH₂, -CH₂-NH(CH₃), -CH₂-NH₂, -SO-(CH₃), циклопропілу і -O-R¹¹,
де кожний R^{11} являє собою тетрагідропіран,
та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.
16. Сполука за п. 15,
де G являє собою O,
де один із R^3 або R^4 являє собою метил, а інший являє собою H,
та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.
17. Сполука за п. 16,
де R^4 являє собою метил і R^3 являє собою H,
де R^5 і R^6 разом з C-атомом між ними утворюють оксетанове кільце,
та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.
18. Сполука формули (I) за п. 1 або формули (I') за п. 2,
де
G являє собою CR⁸R⁹,
і де
 R^8 і R^6 два C-атоми між R^8 і R^6 утворюють анельований п'ятичленний ароматичний гетероцикл, який містить один або два гетероатоми, кожний із яких незалежно вибраний із N і O, який вибраний із анельованого ізоксазолільного кільця, анельованого піразолільного кільця, ане-

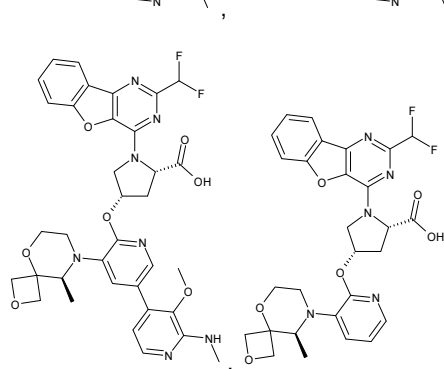
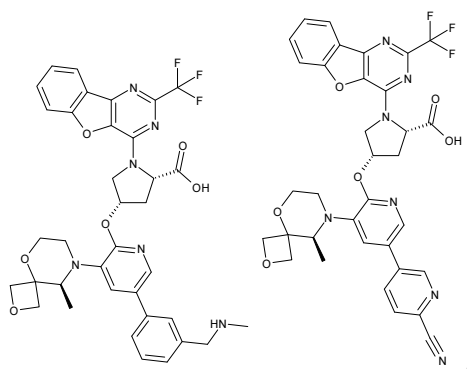
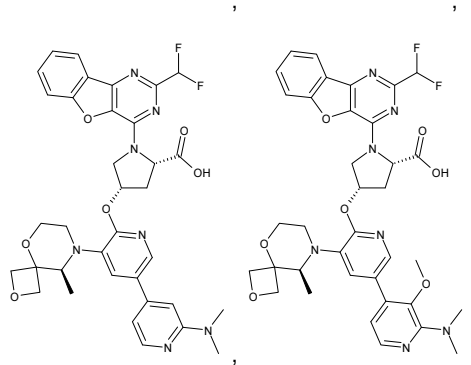
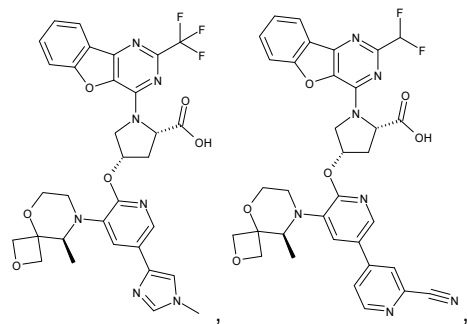
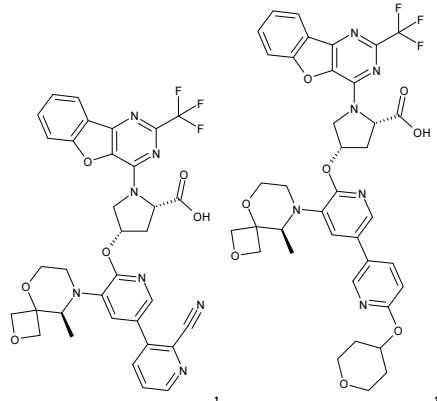
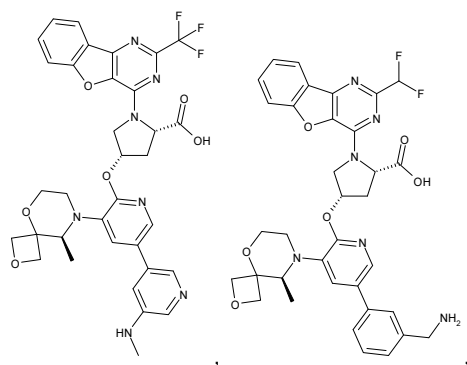
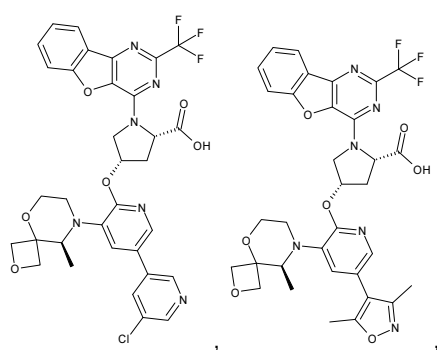
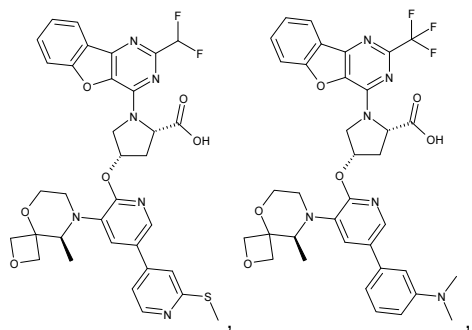
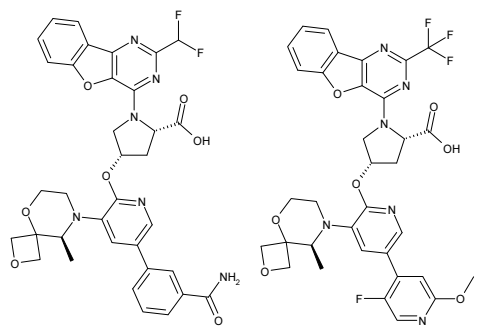
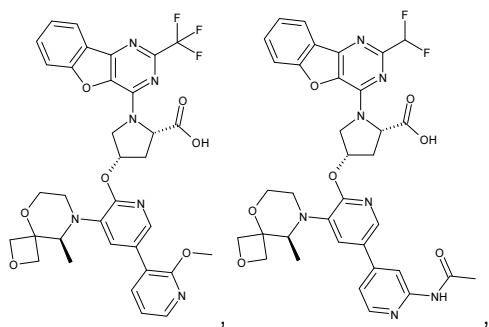
льованого піролільного кільця і анельованого фуранільного кільця,
де R^9 і R^5 відсутні,
та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.

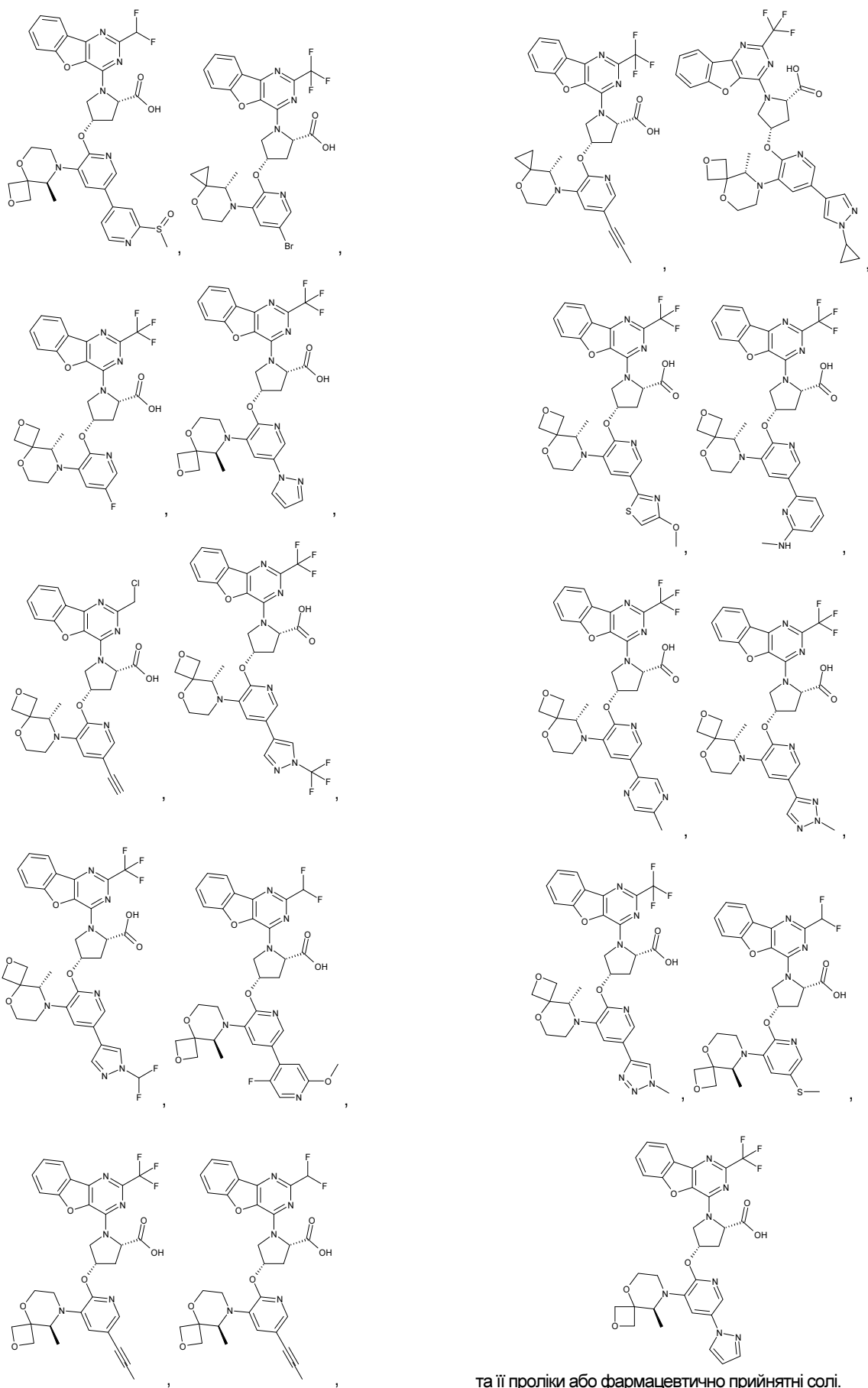
19. Сполука формули (I) за п. 1 або формули (I') за п. 2,
вибрана із групи, яка складається із:





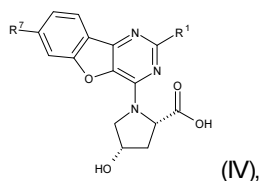




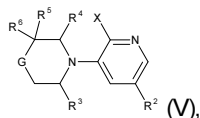


та її проліки або фармацевтично прийнятні солі.

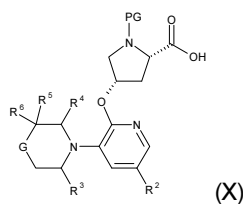
20. Проміжна сполука формули (IV)



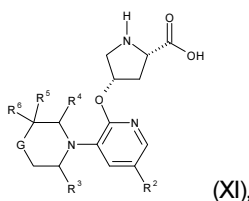
або формули (V)



або формули (X)



або формули (XI)

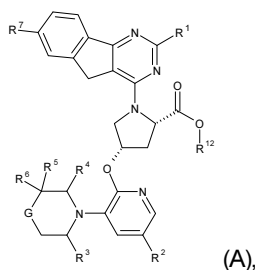


де G, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ мають значення, зазначені в п. 1,

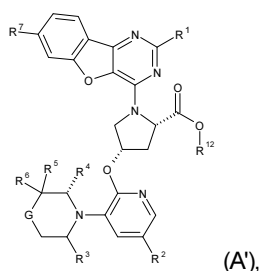
і де X являє собою F або NO₂,

і де PG являє собою захисну групу, вибрану із групи, яка складається із трет-бутоксикарбонілу (BOC), бензилоксикарбонілу (Cbz), флуоренілметиленоксикарбонілу (Fmoc) і алілоксикарбонілу (Alloc).

21. Проліки будь-якої із сполук за будь-яким із пп. 1-19, формули (A)



або формули (A')



де R¹² являє собою C₁₋₄-алкіл, арил, -CH₂-арил, NH-SO₂-C₁₋₃-алкіл.

22. Проліки формули (A) або формули (A') за п. 21, де R¹² являє собою метил.

23. Сполука формули (I) або формули (I') за будь-яким із пп. 1-19 для застосування для лікування захворювання, яке може підлягати лікуванню шляхом інгібування cGAS.

24. Сполука формули (I) або формули (I') за будь-яким із пп. 1-19 для застосування для лікування захворювання, вибраного із групи, яка складається із наступних: системний червоний вовчак (SLE), інтерферопатія, синдром Айкарді-Гут'єрес, вікова макулярна дегенерація (AMD), аміотрофічний латеральний склероз (ALS), запальне захворювання кишечника (IBD), хронічне обструктивне захворювання легень (COPD), синдром Блума, синдром Шегрена, хвороба Паркінсона, серцева недостатність і злоякісне новоутворення, системний склероз (SSc), неалкогольний стеатогепатит (NASH), інтерстиціальне захворювання легень (ILD), краще прогресуюче фіброзне інтерстиціальне захворювання легень (PF-ILD), зокрема, ідіопатичний фіброз легень (IPF).

25. Сполука формули (I) або формули (I') за будь-яким із пп. 1-19 для застосування для лікування захворювання, вибраного із групи, яка складається із наступних: системний червоний вовчак (SLE), інтерферопатія, синдром Айкарді-Гут'єрес, вікова макулярна дегенерація (AMD), аміотрофічний латеральний склероз (ALS), запальне захворювання кишечника (IBD), хронічне обструктивне захворювання легень (COPD), синдром Блума, синдром Шегрена і хвороба Паркінсона.

26. Сполука формули (I) або формули (I') за будь-яким із пп. 1-19 для застосування для лікування фіброзного захворювання, вибраного із групи, яка складається із наступних: системний склероз (SSc), неалкогольний стеатогепатит (NASH), інтерферопатія, інтерстиціальне захворювання легень (ILD), краще прогресуюче фіброзне інтерстиціальне захворювання легень (PF-ILD), зокрема, ідіопатичний фіброз легень (IPF).

27. Сполука формули (I) або формули (I') за будь-яким із пп. 1-19 для застосування для лікування захворювання, вибраного із групи, яка складається із наступних: вікова макулярна дегенерація (AMD), серцева недостатність, інфекційне захворювання COVID-19/SARS-CoV-2, запалення нирок, фіброз нирок, дисметаболізм, судинні захворювання, серцево-судинні захворювання та злоякісне новоутворення.

28. Фармацевтична композиція, яка містить сполуку формули (I) або формули (I') за будь-яким із пп. 1-19 і не обов'язково один або декілька фармацевтично прийнятних носіїв та/або допоміжних речовин.

29. Фармацевтична композиція, яка містить сполуку формули (I) або формули (I') за будь-яким із пп. 1-19 в комбінації з одним або декількома активними агентами, вибраними із групи, яка складається із наступних: проти-запальні агенти, антифіброзні агенти, протиалергічні агенти/антигістаміни, бронходилататори, бета-2-агоністи/бета-міметики, адренергічні агоністи, антихолінергічні агенти, метотрексат, мікофенолату мофетил, модулятори лейкотрієну, інгібітори JAK, антитіла до інтерлейкіну, неспецифічні імунотерапевтичні агенти, такі як інтерферони або інші цитокіни/хемокіни, модулятори цитокінових/хемокинових рецепторів, агоністи толл-подібних рецепторів, регулятори імунних контрольних точок, антитіло до TNF, таке як Humira™, антитіло до BAFF, таке як белімумаб і етанерцепт.

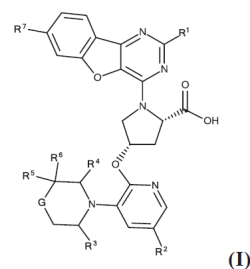
30. Фармацевтична композиція за п. 29, де сполука формули (I) або формули (I') об'єднана з одним або декількома антифіброзними агентами, вибраними із групи, яка складається із пірфенідону і нінтеданібу.

31. Фармацевтична композиція за п. 29, де сполука формули (I) або формули (I') об'єднана з одним або декількома протизапальними агентами, вибраними із групи, яка складається із NSAID і кортикостероїдів.

32. Фармацевтична композиція за п. 29, де сполука формули (I) або формули (I') об'єднана з одним або декількома активними агентами, вибраними із групи бронходилататорів, бета-2-агоністів/бетаіміметиків, адренергічних агоністів та антихолінергічних агентів.

33. Фармацевтична композиція за п. 29, де сполука формули (I) або формули (I') об'єднана з одним або декількома антитілами до інтерлейкіну, вибраними із групи, яка складається із наступних: антитіла до IL-23, такі як

рисанкізумаб, антитіла до IL-17, антитіла до IL-1, антитіла до IL-4, антитіла до IL-13, антитіла до IL-5, антитіла до IL-6, такі як Actemra™, антитіла до IL-12 і антитіла до IL-15.



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

(21) **а 2023 05512** (51) МПК
(22) **26.04.2022** **B01D 1/30** (2006.01)
B01D 3/34 (2006.01)
C07C 273/04 (2006.01)
C07C 273/16 (2006.01)

(31) **21170937.3**

(32) **28.04.2021**

(33) **EP**

(85) **17.11.2023**

(86) **PCT/EP2022/060995, 26.04.2022**

(71) **КАСАЛЕ СА (CH)**

(72) Беретті Андреа (IT), Верньє Маддалена (IT), Ланцані Ріккардо (IT), Бертіні Паоло (CH)

(54) **УДОСКОНАЛЕННЯ ОБЛАДНАННЯ УСТАНОВКИ ДЛЯ ОДЕРЖАННЯ СЕЧОВИНИ**

(57) 1. Апарат установки для одержання сечовини, що являє собою апарат (S) відпарювання сечовини або випарний апарат (E), причому апарат (S) відпарювання сечовини виконаний з можливістю обробки реакційної суміші, що містить сечовину, для розкладання карбамату амонію, який не прореагував, що міститься в суміші, на газоподібну суміш аміаку і діоксиду вуглецю, і включає відпарну секцію (2), в якій здійснюється процес відпарювання, і нижній резервуар (11) для рідини, виконаний з можливістю збирання розчину, що містить сечовину після процесу відпарювання; випарний апарат (E) виконаний з можливістю оброблення водного розчину сечовини для видалення води та одержання концентрованого розчину або плаву сечовини, і включає герметизовану посудину, що працює під вакуумом, і нижній резервуар (11) для рідини, виконаний з можливістю збирання концентрованого розчину або плаву сечовини; і апарат (S) відпарювання сечовини або випарний апарат (E) додатково містить принаймні одне з наступного:

а) один або більше перфорованих екранів (20), горизонтально встановлених у нижньому резервуарі для рідини;

б) один або більше перфорованих екранів (25), вертикально встановлених у нижньому резервуарі для рідини;

в) ізольовану камеру (29), розташовану всередині резервуару для рідини, для зменшення розміру внутрішньої камери (21) збирання розчину сечовини резервуару для рідини;

г) групу лопаток (30) і/або вертикальних пластин (31), які виступають від внутрішньої поверхні (19) куполоподібного днища (10) відпарного апарату, що з'єднує відпарну секцію з резервуаром для рідини.

2. Апарат за п. 1, в якому опція (а) включає ряд перфорованих екранів (20), розташованих на різній висоті всередині нижнього резервуару (11) для рідини.

3. Апарат за п. 2, в якому ряд перфорованих екранів включає екрани (20, 24) у формі диску і/або екрани (23) у формі кільця, переважно розташовані один над одним.

4. Апарат за п. 2 або 3, в якому ряд перфорованих екранів включає екрани (22), розташовані так, що принаймні два екрани, поміщені один над одним, проходять через різні частини поперечного перерізу внутрішньої камери резервуару для рідини.

5. Апарат за будь-яким з пп. 1-4, в якому опція (а) включає горизонтальний екран (34), що розташований у безпосередній близькості до випускного отвору (12) для рідини резервуару для рідини і має неперфоровану центральну ділянку (35), виконану з можливістю дії як гасника завихрень, і перфоровану кільцеву ділянку (36) навколо цієї центральної ділянки.

6. Апарат за будь-яким з пп. 1-5, в якому опція (а) включає один або більше горизонтальних екран(ів), що становить(ять) єдине ціле з гасником завихрень (16), вставленим всередину резервуару (11) для рідини.

7. Апарат за будь-яким із попередніх пунктів, в якому опція (б) включає перфоровану циліндричну стінку (25), розміщену всередині нижнього резервуару для рідини так, що нижній резервуар для рідини розділений на кільцеву камеру (27) навколо зазначеної стінки та центральну камеру (26) всередині зазначеної стінки, причому камери зв'язані через перфорації у зазначеній стінці (25).

8. Апарат за будь-яким із попередніх пунктів, у якому опція (б) включає вертикально розташовану перфоровану циліндричну стінку (51), яка проходить вниз від неперфорованого горизонтального екрану (50).

9. Апарат за будь-яким із попередніх пунктів, в якому опція (в) включає закриту циліндричну камеру (29), розміщену в нижньому резервуарі для рідини так, що кільцева ділянка навколо камери (29) є єдиною внутрішньою ділянкою нижнього резервуару для рідини, де може збиратися рідина.

10. Апарат за будь-яким із попередніх пунктів, який є апаратом відпарювання сечовини, пристосованим для роботи відповідно до будь-якого з наступних процесів: процес самовідпарювання, процес відпарювання аміаком, процес відпарювання діоксидом вуглецю.

11. Установка для одержання сечовини, яка включає принаймні один апарат за будь-яким із попередніх пунктів.

12. Спосіб модернізації апарату відпарювання сечовини або вакуумного випарного апарату установки для одержання сечовини, в якій апарат відпарювання сечовини включає відпарну секцію для здійснення процесу відпарювання і нижній резервуар для рідини для збирання розчину, що містить сечовину, після процесу відпарювання, а вакуумний випарний апарат включає посудину, в якій забезпечується видалення води з водного розчину сечовини, для одержання концентрованого розчину або плаву сечовини, причому зазначена посудина містить нижній резервуар для рідини, в якому збирається концентрований розчин або плав сечовини;

і при здійсненні способу встановлюють принаймні одне з наступного:

а) один або більше перфорованих екранів, горизонтально встановлюваних в нижній частині;

б) один або більше перфорованих екранів, вертикально встановлюваних в нижньому резервуарі для рідини;

в) ізольовану камеру, розташовану в резервуарі для рідини для зменшення об'єму в резервуарі для рідини, в якому може збиратися розчин сечовини;

г) групу лопаток і/або вертикальних пластин, що виступають від внутрішньої поверхні куполоподібного днища відпарного апарату, що з'єднує відпарну секцію з резервуаром для рідини.

13. Спосіб за п. 12, в якому опція (а) включає установку ряду перфорованих екранів (20), що розміщуються на різній висоті в нижньому резервуарі для рідини, і, переважно, ряд перфорованих екранів включає екрани у формі диску і/або екрани у формі кільця.

14. Спосіб за п. 13, в якому опція (а) включає установку екранів, що розміщуються так, що принаймні два екрани, розташовані один над одним, проходять через різні частини поперечного перерізу внутрішньої камери (21) резервуару для рідини.

15. Спосіб за будь-яким з пп. 12-14, в якому опція (а) включає встановлення модернізованого гасника завихрень, який включає:

принаймні перший горизонтальний екран у безпосередній близькості до випускного отвору для рідини резервуара для рідини, що має неперфоровану центральну частину, яка діє як гасник завихрень, і перфоровану кільцеву ділянку навколо цієї центральної ділянки;

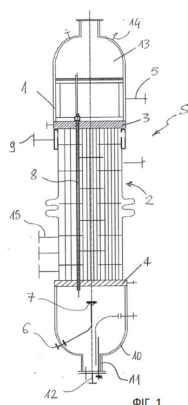
опційно, принаймні другий перфорований горизонтальний екран, розміщений над першим екраном.

16. Спосіб за п. 12, в якому опція (б) включає установку модернізованого гасника завихрень, який включає: неперфорований горизонтальний перший екран; вертикально розташований перфорований кільцевий екран, який проходить вниз від першого екрану.

17. Спосіб за п. 12, в якому:

опція (б) включає встановлення перфорованої циліндричної стінки в нижній резервуар для рідини так, що він розділяється на кільцеву камеру навколо зазначеної стінки і центральну камеру всередині зазначеної стінки, причому камери з'єднуються через перфорацію у зазначеній стінці, або

опція (в) включає установку закритої циліндричної камери, розміщеної в нижньому резервуарі для рідини так, що кільцева ділянка навколо цієї закритої камери є єдиною ділянкою нижнього резервуара для рідини, де може збиратися рідина.



B 22

(21) а 2023 05636
(22) 26.04.2022

(51) МПК (2024.01)
B22F 9/08 (2006.01)
B22F 1/00
B33Y 70/00

(31) РСТ/В2021/053456

(32) 27.04.2021

(33) В

(85) 23.11.2023

(86) РСТ/В2022/053852, 26.04.2022

(71) АРСЕЛОРМИТТАЛ (LU)

(72) Ерраіс Лалана Енріке (ES), Кодукула Удаа Бхаскар (US)

(54) ОБЛАДНАННЯ ДЛЯ ВИРОБНИЦТВА МЕТАЛІЧНИХ ПОРОШКІВ

(57) 1. Обладнання (1) для виробництва металічних порошків, яке містить:

пристрій (2) для газового розпилення, який містить розпилювальну камеру (4), яка має верхню стінку і днище, розпилювальне сопло (5), розміщене на верхній стінці розпилювальної камери і виконане з можливістю протікання через нього рідкого металу, газову форсунку (6), розташовану поблизу зазначеного сопла і виконану з можливістю спрямування газу у вигляді струменя на рідкий метал, і отвір (8) в днищі розпилювальної камери для вивантаження металічного порошку;

теплообмінник (3) типу труба в трубі, який містить внутрішню трубу (9) і зовнішню трубу (10), при цьому зазначені дві труби є концентричними, внутрішня труба сполучена з отвором (8) в днищі розпилювальної камери, а зовнішня труба сполучена з газовою форсункою (6) пристрою для газового розпилення.

2. Обладнання за п. 1, яке додатково містить дільницю класифікації (14).

3. Обладнання за пп. 1-2, в якому внутрішня труба (9) являє собою транспортувальний пневматичний трубопровід.

4. Обладнання за будь-яким з пп. 1-3, в якому внутрішня труба (9) забезпечена вхідним трубопроводом (13) для транспортувального газу.

5. Обладнання за п. 4, в якому вхідний трубопровід (13) для транспортувального газу розташований поблизу отвору (8) в днищі розпилювальної камери.

6. Обладнання за будь-яким з пп. 1-5, в якому внутрішня труба (9) сполучена з отвором (8) в днищі камери розпилювання зі сторони першого кінця (11) теплообмінника типу труба в трубі.

7. Обладнання за будь-яким з пп. 2-6, в якому внутрішня труба (9) зі сторони другого кінця (12) теплообмінника типу труба в трубі сполучена з вхідним трубопроводом дільниці класифікації (14).

8. Обладнання за будь-яким з пп. 2-6, в якому внутрішня труба (9) зі сторони першого кінця (11) теплообмінника типу труба в трубі сполучена з вихідним трубопроводом дільниці класифікації (14).

9. Обладнання за будь-яким з пп. 1-8, в якому зовнішня труба (10) зі сторони першого кінця (11) теплообмінника типу труба в трубі сполучена з газовою форсункою (6).

10. Обладнання за будь-яким з пп. 2-9, в якому зовнішня труба (10) зі сторони другого кінця (12) тепло-

обмінника типу труба в трубі сполучена з вихідним трубопроводом дільниці класифікації (14).

11. Обладнання за будь-яким з пп. 1-10, в якому зовнішня труба (10) сполучена з регулятором потоку газу.

12. Обладнання за будь-яким з пп. 1-11, в якому пристрій для газового розпилення додатково містить засоби продування (17) в розпилювальній камері (4) для продування шару металічних частинок, який утворився на дні розпилювальної камери.

13. Обладнання за п. 12, в якому зовнішня труба (10) сполучена із засобами продування (17) зі сторони першого кінця (11) теплообмінника типу труба в трубі.

14. Обладнання за п. 12, в якому засоби продування (17) сполучені з вхідним трубопроводом (13) для транспортувального газу внутрішньої труби (9).

15. Обладнання за будь-яким з пп. 1-14, в якому пристрій (2) для газового розпилення додатково містить пристрій (38) для відведення газу, сполучений з камерою розпилювання (4).

16. Обладнання за п. 15, в якому пристрій (38) для відведення газу сполучений з газовою форсункою (6).

17. Обладнання за п. 16, в якому пристрій (38) для відведення газу зі сторони другого кінця (12) теплообмінника типу труба в трубі сполучений із зовнішньою трубою (10).

18. Спосіб охолодження металічних частинок на виході з пристрою (2) для газового розпилення, в якому газ, що підлягає використанню для розпилення, спочатку приводять в контакт з металічними частинками, які вивантажуються з пристрою для газового розпилення, в теплообміннику (3) типу труба в трубі, який містить внутрішню трубу (9) і зовнішню трубу (10), при цьому зазначені дві труби розташовані концентрично.

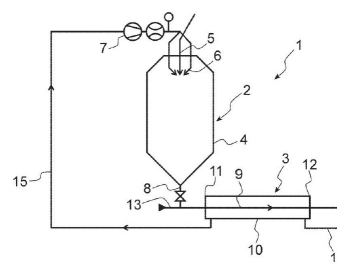
19. Спосіб за п. 18, в якому газ, що підлягає використанню для розпилення, проходить в одному напрямку в зовнішній трубі (10), в той час як металічні частинки, які вивантажуються з газового пристрою для розпилення, переміщуються у внутрішній трубі (9) в іншому напрямку.

20. Спосіб за будь-яким з пп. 18-19, в якому газ, що підлягає використанню для розпилення, є газом рециркуляції, який повертається з дільниці класифікації (14), яка є частиною обладнання (1) для виробництва металічних порошків і, яка містить пристрій (2) для газового розпилення і теплообмінник типу труба в трубі.

21. Спосіб за будь-яким з пп. 18-20, в якому газ, що підлягає використанню для розпилення, є газом рециркуляції, який повертається із пристрою (2) для газового розпилення.

22. Спосіб за будь-яким з пп. 18-21, в якому газ, що використовується для транспортування металічних частинок вздовж внутрішньої труби (9), є газом, що повертається з дільниці (14) класифікації, яка є частиною обладнання (1) для виробництва металічних порошків і, яка містить пристрій (2) для газового розпилення і теплообмінник (3) типу труба в трубі.

23. Спосіб за будь-яким з пп. 18-22, в якому газ, що використовується для транспортування металічних частинок внутрішньої труби (9), є газом, що повертається з пристрою для газового розпилення.



Фігура 1

B 23

(21) a 2023 05413
(22) 12.04.2022

(51) МПК (2024.01)
B23P 17/06 (2006.01)
B21B 1/16 (2006.01)
B21F 13/00
B21F 45/00
B21H 8/00
E04C 5/01 (2006.01)
E04C 5/03 (2006.01)
E04C 5/07 (2006.01)

(31) 10 2021 001 946.6

(32) 14.04.2021

(33) DE

(85) 10.11.2023

(86) PCT/EP2022/059742, 12.04.2022

(71) ХАКАНОКА ГМБХ (DE)

(72) Шталь Карл-Германн (DE), Шталь Гансйорг (DE)

(54) СПОСІБ ВИГОТОВЛЕННЯ МЕТАЛЕВИХ ВОЛОКОН, ЗОКРЕМА СТАЛЕВИХ ВОЛОКОН

(57) 1. Спосіб виготовлення металевих волокон, зокрема загартованих або незагартованих сталевих волокон, з плоского матеріалу у формі стрічки, в якому металеві волокна мають по суті прямокутний поперечний переріз і принаймні одна, переважно обидві відповідні ширші бічні поверхні волокон мають щонайменше один V-подібний анкерний проріз, що простягається в поздовжньому напрямку волокон, причому для формування металевих волокон металева стрічка забезпечена в поздовжньому напрямку, бажано на обох поверхнях металевої стрічки, прорізами розлому, в результаті чого в основі прорізу утворюються розділяючі перемички, які створюють розділові поверхні з низьким рівнем задирок і стійкі до розлому під час наступного відокремлення, за бажанням також після процесу прокатки, що деформує розділяючі перемички шляхом згинання, який відрізняється тим, що матеріал, що має міцність, необхідну для металевих волокон при подальшому використанні, спочатку використовується як металева стрічка, металева стрічка подається на першу виробничу лінію у формі рулону від приводного та контрольованого розмотувача (1) до блоку випрямлення та транспортування (3), який оснащений обгінною муфтою, що забезпечує вільний хід, і розташованими далі обрізними ножицями (4), які формують принаймні початок стрічки, після чого металева стрічка подається на профільний вал (6), який складається з верхнього

валу та нижнього валу і має форму прокатного інструменту для нанесення як анкерних прорізів, розташованих з аксіальним зміщенням один відносно одного на верхній та нижній сторонах, так і прорізів розлому, в яких два вали можуть бути забезпечені підрізами для формування анкерних поверхонь та/або анкерів у анкерних прорізах і прорізах розлому відповідно, які утворюють на металевій стрічці анкерні лінії, для чого вали можуть бути точно відрегульовані за своїми властивостями синхронізації для точного позиціонування анкерних ліній по відношенню до верхнього і нижнього валів і додатково виконані з можливістю стабільного і регульованого осьового ведення двох валів по відношенню один до одного, і тим, що металева стрічка потім проходить, якщо потрібно, крізь комбінований блок для надрізання та випрямлення (7) для глибшого прорізування, надрізання та випрямлення анкерів у прорізах розлому за допомогою однієї або кількох пар надрізних валів і, нарешті, знову намотується у рулон за допомогою пристрою для намотування (8) або залишається на відповідній виробничій лінії.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що металева стрічка за бажанням проходить крізь кілька вузлів прокатки у додатковому блоці (7) надрізання та випрямлення після пар надрізних валів, а потім здійснюється оптичне виявлення (9.1) анкерів, присутніх у прорізах та розташованих на анкерних лініях перпендикулярно до напрямку руху металевої стрічки, і разом з цим здійснюється керування поздовжнім розділяючим валом (9.2), який виконує попереднє відокремлення ниток металевих волокон в анкерній зоні прорізу розлому, де профільована металева стрічка протягується крізь поздовжній розділяючий вал (9.2) за допомогою розташованого далі протягуючого валу (10), так що поздовжній розділяючий вал (9.2) не потребує приводу або потребує лише власний опорний привід, де перед пристроєм для намотування (13) за бажанням передбачені випрямляючий блок (11), що має обрізні ножиці і додатковий блок випрямлення (12) для попереднього згинання профільованої металевої стрічки перед намотуванням.

3. Спосіб за п. 1 або 2, який **відрізняється** тим, що на наступному етапі способу профільована металева стрічка за бажанням піддається відомому і стандартному процесу загартування.

4. Спосіб за пп. 1-3, який **відрізняється** тим, що на другій виробничій лінії профільована та/або загартована металева стрічка розмотується з приводного та контрольованого розмотувача (21) і подається до блоку випрямлення (22), також оснащеного обгінною муфтою для випрямлення та втягування початку стрічки, причому на початку стрічки за допомогою обрізних ножиць (23) забезпечується чиста пласка ділянка, при чому після проходження крізь плаский вузький направляючий елемент для стрічки (25), виконується оптичне виявлення пристроєм (26) анкерів, присутніх в анкерних прорізах і розташованих на анкерних лініях, перпендикулярних до напрямку руху металевої стрічки, що слугує для подальшого контролю поперечних розділяючих ножиць (12), і після проходження крізь додатковий плаский вузький направляючий елемент для стрічки (27) відбувається повне відділення металевих волокон одне від одного в тягових поздовжніх розділяючих валах (28) або по-

здовжніх розділяючих валах (28), оснащених опорним приводом, де для цієї мети відокремлені металеві волокна протягують крізь вузький направляючий елемент (29) з високим розтягуючим навантаженням протягуючого валу (30) і далі вузьким направляючим елементом (31) спрямовують до поперечних розділяючих ножиць (32) і відрізають необхідну довжину і, нарешті, подають у збірний контейнер (33) для відокремлених металевих волокон.

5. Пристрій для здійснення способу за пп. 1-4, в якому металеві волокна, зокрема сталеві волокна, виготовляють з плаского матеріалу у формі стрічки, металеві волокна мають по суті прямокутний поперечний переріз і принаймні одну, переважно обидві відповідні ширші бічні поверхні волокон з принаймні одним V-подібним анкерним прорізом, що простягається в поздовжньому напрямку волокон, і, щоб сформувати металеві волокна, металева стрічка має прорізи розлому в поздовжньому напрямку, переважно на обох поверхнях, за допомогою чого в основі прорізу формуються розділяючі перемички, які під час подальшого відокремлення утворюють розділяючі поверхні з низьким рівнем задирок і стійкістю до розлому, за бажанням також після процесу прокатки, який деформує розділяючі перемички шляхом згинання, що **відрізняється** тим, що на першій виробничій лінії передбачений приводний і контрольований розмотувач (1) для металевої стрічки у формі рулону, далі блок випрямлення і транспортування (3) для металевої стрічки, який оснащений обгінною муфтою, виконаною з можливістю забезпечення вільного ходу, далі розташовані обрізні ножиці (4) для формування принаймні початку стрічки, далі профільний вал (6), який складається з верхнього та нижнього валів і має форму прокатного інструменту, для нанесення анкерних прорізів та прорізів розлому в металевій стрічці, причому властивості синхронізації двох валів та їх осьове ведення відносно один одного є точно налаштованими, далі комбінований блок надрізання та випрямлення (7), що має одну або більше пар надрізних валів для глибшого прорізування, надрізання або також, за бажанням, для вирівнювання анкерів у прорізах розлому в металевій стрічці, і, нарешті, включає пристрій для намотування (8) для змотування металевої стрічки у рулон.

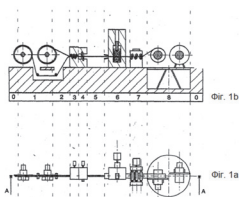
6. Пристрій за п. 5, який **відрізняється** тим, що, за потреби, передбачено декілька вузлів прокатки для металевої стрічки після пар надрізних валів, причому додатково передбачений блок оптичного виявлення (9.1) для анкерів, наявних в анкерних виїмках і розташованих на анкерних лініях, перпендикулярних до напрямку руху металевої стрічки, за допомогою яких здійснюється контроль поздовжнього розділяючого валу (9.2), що забезпечує попереднє відокремлення ниток металевих волокон від анкерів в області прорізів розлому, де передбачений розташований нижче протягуючий вал (10) для переміщення профільованої металевої стрічки, а також перед намотувальним пристроєм (13) за бажанням розміщено блок випрямлення (11), що має обрізні ножиці для попереднього згинання профільованої металевої стрічки перед змотуванням.

7. Пристрій за пп. 5 і 6 для реалізації другої виробничої лінії, який **відрізняється** тим, що для розмотування тепер профільованої та загартованої метале-

вої стрічки також передбачено приводний і контрольний розмотувач (21) і випрямляючий пристрій (22), оснащений обгінною муфтою для вирівнювання та втягування початку стрічки, далі обрізні ножиці (23) для створення чистої пласкої ділянки на початку стрічки, далі оптичний пристрій виявлення (26) для виявлення анкерів, присутніх в анкерних прорізах та прорізах розлому і розташованих на анкерних лініях, перпендикулярних до напрямку руху металевої стрічки, причому для спрямування металевої стрічки спереду і позаду пристрою оптичного виявлення (26) встановлені вузькі направляючі елементи для стрічки 25 або 27, передбачені для металевих волокон, які були частково відокремлені одне від одного, таким чином, що для повного відділення металевих волокон одне від одного передбачені тягові поздовжні розділяючі вали (28) або за бажанням оснащені приводом поздовжні розділяючі вали (28), а також протягуючий вал (30), в якому нитки металевих волокон проштовхують протягуючим валом (30) крізь вузький направляючий елемент (29) поперечних розділяючих ножиць (32), що контролюються оптичним пристроєм визначення положення (26) для відрізання необхідної довжини, а волокна подають у збірний контейнер (33).

8. Пристрій за пп. 5-7, який **відрізняється** тим, що блок надрізання та випрямлення (7) є забезпеченням декількома, переважно двома, парами надрізних валів.

9. Металеве волокно, зокрема сталеве волокно, за пунктами 1-6, сформоване з плаского матеріалу у формі стрічки, де металеве волокно має по суті прямокутний поперечний переріз і принаймні одна, переважно обидві відповідні ширші бічні поверхні волокна мають щонайменше один V-подібний анкерний проріз, що простягається в поздовжньому напрямку волокна, причому металеве волокно утворюється з металевої стрічки, яка має в поздовжньому напрямку, переважно на обох поверхнях металевої стрічки, прорізи розлому, основи прорізів утворюють розділяючі перемички, які під час подальшого відокремлення, за бажанням також після процесу прокатки, який деформує розділяючі перемички шляхом згинання, утворюють розділяючі поверхні з низьким рівнем задирок і стійкістю до розлому, які **відрізняються** тим, що використовується металева стрічка складається з матеріалу, який має міцність, необхідну для металевих волокон при подальшому використанні, де анкерні прорізи, розташовані з аксіальним зсувом один відносно одного на верхній і нижній сторонах, а також прорізи розлому наносять профільним валом (6), який складається з верхнього валу та нижнього валу і має форму прокатного інструменту, два вали якого, які мають точно синхронізовані властивості ходу, можуть бути забезпечені підрізами для формування анкерних поверхонь та/або анкерів у анкерних прорізах або прорізах розлому, причому прорізи розлому можуть бути прорізані глибше, надрізані глибше, або анкери у прорізах розлому можуть бути вирівняні парами надрізних валів блоку надрізання та випрямлення (7).



B 26

(21) а 2023 05608
(22) 22.11.2023

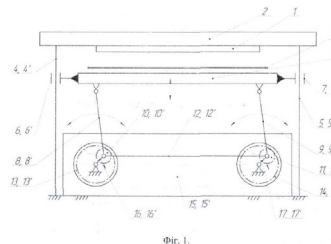
(51) МПК
B26F 1/40 (2006.01)
B31B 50/14 (2017.01)

(71) УКРАЇНЬСЬКА АКАДЕМІЯ ДРУКАРСТВА (UA)

(72) Четербух Остап Юрійович (UA)

(54) ПРЕС ШТАНЦОВАЛЬНОГО АВТОМАТА

(57) Прес штанцювального автомата, який складається з пласко штанцювальної форми закріпленої на нерухомій плиті та рухомої натискної плити, який **відрізняється** тим, що приводний механізм рухомої натискної плити містить ліві та праві коромисла, які однією стороною шарнірно з'єднані з рухомою натискною плитою, що переміщується по вертикальним нерухомим напрямним напрямними втулками рухомої натискної плити, а другою - шарнірно з важелями, кривошипам та рухливими зубчастими колесами, які знаходяться в постійному контакті та переміщуються по нерухомим зубчастим колесам з внутрішнім зачепленням, що вмонтовані в нерухомих плитах.



B 29

(21) а 2022 03007
(22) 19.08.2022

(51) МПК (2024.01)
B29B 17/00
B29B 11/02 (2006.01)
C08J 11/04 (2006.01)

(71) ЗЕ ГУД ПЛАСТИК КОМПАНИ ІНТЕРНЕТШНЛ ЛІМІТЕД (GB)

(72) Цибуляню Микола Павлович (UA)

(54) СПОСІБ ОТРИМАННЯ ЛИСТОВИХ ВИРОБІВ З ТЕРМОПЛАСТИЧНИХ ПЛАСТМАС ТА ВИРОБНИЧА ЛІНІЯ ДЛЯ ЙОГО ЗДІЙСНЕННЯ

(57) 1. Спосіб отримання листових виробів з термопластичних пластмас, який включає дозування сировини з термопластичних пластмас для виготовлення щонайменше одного листового виробу, подачу дозованої сировини для її нагрівання під тиском, нагрівання дозованої сировини під тиском у щонайменше одному гарячому пресі з отриманням напівфабрикату листового виробу, подачу напівфабрикату листового виробу для охолодження під тиском, охолодження напівфабрикату під тиском у щонайменше одному холодному пресі до отримання готового листового виробу, який **відрізняється** тим, що для дозування сировини використовують форму, що містить щонайменше роз'ємні між собою нижню частину форми і верхню частину форми, виконану з можливістю на-

кривання нижньої частини форми зверху, сировину дозують у нижню частину форми у кількості, необхідній для виготовлення листового виробу, після дозування накривають нижню частину форми верхньою частиною форми з отриманням закритої форми, нагрівання дозованої сировини під тиском здійснюють за допомогою електричних нагрівачів та робочих плит гарячого пресу, між якими розташовують закриту форму з дозованою сировиною і за допомогою яких здійснюють тиск на дозовану сировину у закритій формі, а охолодження напівфабрикату під тиском виконують за допомогою потоку повітря та робочих плит холодного пресу, між якими розташовують закриту форму з отриманим після гарячого пресу напівфабрикатом та за допомогою яких здійснюють тиск на напівфабрикат у закритій формі, причому виймання готового листового виробу здійснюють шляхом розкриття верхньої частини форми, при цьому подають дозовану сировину для її нагрівання під тиском та подають напівфабрикат листового виробу для охолодження під тиском за допомогою конвеєра, на якому розташовують форму.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що сировину дозують у нижню частину форми шляхом її насипання у декілька шарів.

3. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що після дозування перед накриванням нижньої частини форми її верхньою частиною виконують вирівнювання верхньої поверхні сировини за допомогою вирівнюючого пристрою.

4. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що перед дозуванням встановлюють нижню частину форми з можливістю зміни висоти її розташування.

5. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що перед вийманням готового листового виробу встановлюють закриту форму з можливістю зміни висоти її розташування.

6. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що нагрівання дозованої сировини під тиском у гарячому пресі здійснюють до температури, яка менше температури деградації матеріалу сировини.

7. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що перед нагріванням та/або у процесі нагрівання дозованої сировини під тиском у гарячому пресі здійснюють вакуумування внутрішнього об'єму закритої форми.

8. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що отримують готовий листовий виріб з декоративним малюнком щонайменше на частині зовнішньої поверхні виробу шляхом використання сировини різного кольору.

9. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що отримують готовий листовий виріб з декоративною рельєфною текстурою щонайменше на частині зовнішньої поверхні виробу шляхом її полірування або використання нижньої частини форми та/або верхньої частини форми з виступами та/або впадинами, які у сукупності формують декоративну рельєфну текстуру.

10. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що використовують холодний прес з механічним або гідравлічним приводом або холодний прес з механічним або гідравлічним приводом, комбінованим з пневматичним приводом.

11. Виробнича лінія для отримання листових виробів з термопластичних пластмас, яка складається з розташованих послідовно елементів, що включають ділянку пресування з нагрівом сировини (2), облад-

нану щонайменше одним гарячим пресом, та ділянку пресування з охолодженням напівфабрикату (3), обладнану щонайменше одним холодним пресом, яка **відрізняється** тим, що послідовно розташовані елементи додатково включають ділянку підготовки сировини та заповнення сировиною форми (1), розташовану перед ділянкою пресування з нагрівом сировини (2), та ділянку виймання готового листового виробу з форми (4), розташовану після ділянки пресування з охолодженням напівфабрикату (3), ділянка підготовки сировини та заповнення сировиною форми (1) обладнана заготівельним столом з поверхнею для встановлення форми (5) та рухомих бункером для насипу сировини у форму (5), форма (5) містить щонайменше роз'ємні між собою нижню частину форми і верхню частину форми, виконану з можливістю накривання нижньої частини форми зверху, гарячий прес ділянки пресування з нагрівом сировини (2) та холодний прес ділянки пресування з охолодженням сировини (3) обидва обладнані основною рамою, нижньою робочою плитою, виконаною рухомою вгору та вниз відносно основної рами за допомогою силових пневматичних приводів для створення тиску всередині форми (5), і верхньою робочою плитою, нерухомо закріпленою на основній рамі, причому по площі вказаних робочих плит гарячого пресу розташовано електричні нагрівачі для нагрівання сировини у формі (5), а холодний прес обладнано засобами подання холодного повітря через нижню робочу плиту і верхню робочу плиту всередину форми (5), при цьому ділянка виймання готового листового виробу з форми (4) містить стіл готової продукції для розбирання форми з готовим листовим виробом (6) та його виїмки, обладнаний поверхнею для встановлення форми з готовим листовим виробом (6), а заготівельний стіл ділянки підготовки сировини та заповнення сировиною форми (1), гарячий прес ділянки пресування з нагрівом сировини (2), холодний прес ділянки пресування з охолодженням сировини (3) та стіл готової продукції ділянки виймання готового листового виробу з форми (4) сполучені між собою конвеєром, прокладеним між двома рамами, розташованими вздовж вказаних вище заготівельного столу, гарячого пресу, холодного пресу та столу готової продукції.

12. Виробнича лінія за п. 11, яка **відрізняється** тим, що ділянка підготовки сировини та заповнення сировиною форми (1) обладнана вирівнюючим пристроєм, який містить засіб вібрації для вирівнювання шару сировини у формі (5).

13. Виробнича лінія за п. 11, яка **відрізняється** тим, що поверхня заготівельного столу для встановлення форми (5) виконаною рухомою вгору та вниз.

14. Виробнича лінія за п. 11, яка **відрізняється** тим, що поверхня столу готової продукції для встановлення форми з готовим листовим виробом (6) виконаною рухомою вгору та вниз.

15. Виробнича лінія за п. 11, яка **відрізняється** тим, що нижня частина форми (5) утворена сполученими між собою бічною рамою та нижнім листом, а верхня частина форми (5) утворена знімним верхнім листом, виконаним з можливістю накривання зверху бічної рами.

16. Виробнича лінія за п. 11, яка **відрізняється** тим, що нижня частина форми (5) утворена нижнім листом з відігнутими вгору краями, а верхня частина фо-

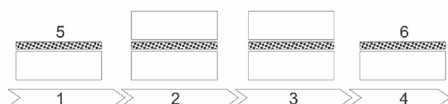
рми (5) утворена знімним верхнім листом, виконаним з можливістю накривання зверху відігнутих країв нижнього листа.

17. Виробнича лінія за п. 15 або п. 16, яка **відрізняється** тим, що внутрішня поверхня нижньої частини форми (5) та/або верхньої частини форми (5) містить виступи та/або впадини, які у сукупності формують декоративну рельєфну текстуру.

18. Виробнича лінія за п. 11, яка **відрізняється** тим, що додатково містить компресор для постачання стисненим повітрям вказаних вище силових пневматичних приводів заготівельного столу, гарячого пресу, холодного пресу та столу готової продукції через магістраль подачі стисненого повітря.

19. Виробнича лінія за п. 11, яка **відрізняється** тим, що містить холодний прес з механічним або гідравлічним приводом або холодний прес з механічним або гідравлічним приводом, комбінованим з пневматичним приводом.

20. Виробнича лінія за п. 11, яка **відрізняється** тим, що додатково обладнана вакуумним насосом, виконаним з можливістю вакуумування внутрішнього об'єму закритої форми (5).



В 62

(21) а 2023 05739 (51) МПК (2024.01)
(22) 28.04.2022 B62D 21/10 (2006.01)
B62D 21/16 (2006.01)
B62D 29/04 (2006.01)
B60K 16/00
B60R 19/20 (2006.01)

(31) FR2104460
(32) 29.04.2021
(33) FR
(31) FR2104595
(32) 30.04.2021
(33) FR
(85) 28.11.2023
(86) PCT/EP2022/061416, 28.04.2022
(71) ПАЯРД БЕНУА (FR)
(72) Паярд Бенуа (FR)

(54) СКЛАДНИЙ НАДУВНИЙ ТРАНСПОРТНИЙ ЗАСІБ

(57) 1. Транспортний засіб, що містить принаймні одну раму (400), причому ця рама складається принаймні з U-подібної форми (402) та надувної форми (401), який характеризується тим, що (U-подібна форма) (402) утримується в надувній формі (401) за допомогою тиску накачування (406), який притискає надувну форму (401) до U-подібної форми (402).

2. Транспортний засіб за п. 1, який характеризується тим, що він має надувну верхню конструкцію.

3. Транспортний засіб за п. 1, який характеризується тим, що він має кузов, причому зазначений кузов містить частину з двома напівпрозорими стінками (701),

відокремленими одна від одної, та одне або більше джерел світла (703) поблизу стінок (701), які забезпечують дифузію світла (705) між двома стінками (701) та рівномірний світловий потік (704), який виходить з кузова (710).

4. Транспортний засіб за п. 1, який характеризується тим, що надувна форма (401) являє собою надувну раму платформи (200), що складається з декількох надувних елементів (201), зібраних разом, причому деякі надувні елементи (201) мають регулятор тиску (203) з різними рівнями спрацьовування, щоб у разі ударів спрямовувати деформацію елементів і визначити послідовність їхнього здуття (201b), (201c), (201a) (201d), (201e), що повинно забезпечити збереження жорсткості пасажирського місця.

5. Транспортний засіб за п. 1, який характеризується тим, що надувна форма (401) являє собою надувну підлогу (300).

6. Транспортний засіб за п. 1, який характеризується тим, що для керування транспортним засобом принаймні одне колесо (500) з'єднане з ходовою частиною (400): принаймні один моторний елемент (11), принаймні один накопичувач енергії (516)/(515) і принаймні одне гальмо (512).

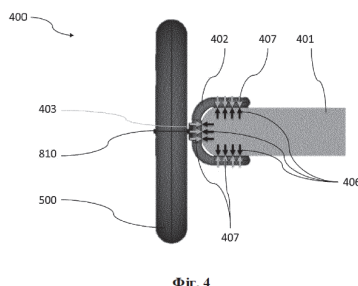
7. Транспортний засіб за п. 1, який характеризується тим, що транспортний засіб має принаймні один двигун (11) і що гальмування здійснюється за допомогою двигуна(-ів) (11).

8. Транспортний засіб за п. 1, який характеризується тим, що він має гальмо з відсутністю струму.

9. Транспортний засіб за п. 1, який характеризується тим, що це транспортний засіб (1000), який має принаймні один двигун (11), принаймні один накопичувач енергії (516)/(515), принаймні одне гальмо (512) і принаймні одну верхню конструкцію, яка закріплена на низькій платформі (900), причому ця низька платформа включає принаймні одну ходову частину (400), а також керування (850) та їх опори (851), які з'єднані з інтерфейсом керування (510).

10. Транспортний засіб за п. 1, який характеризується тим, що він може бути частково покритий сонячними панелями (801).

11. Транспортний засіб за п. 1, який характеризується тим, що транспортний засіб має принаймні один бризковик (601) із запасом енергії.)



В 65

(21) а 2022 02987 (51) МПК
(22) 17.08.2022 B65D 88/16 (2006.01)

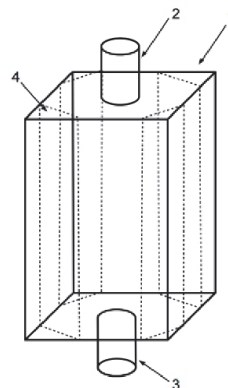
(71) РАБІЗО ІВАН ГЕОРГІЙОВИЧ (UA)

(72) Рабізо Іван Георгійович (UA)

(54) М'ЯКИЙ КОНТЕЙНЕР ДЛЯ ТРАНСПОРТУВАННЯ ЛЕГКИХ СИПКИХ ВАНТАЖІВ

(57) 1. М'який контейнер для транспортування легких сипких вантажів, що містить ємність із верхнім завантажувальним отвором і нижнім розвантажувальним отвором, силовий каркас, який **відрізняється** тим, що контейнер має форму прямокутного паралелепіпеда, об'єм якого становить від 15 до 20 м³, має завантажувальну горловину на верхній основі, яка виконана з можливістю закривання скрученням в рулон і фіксації застібкою, причому застібки закріплені на кінцях стрічок, які приєднані по бокам до горловини, на вивантажувальний клапан на дні, має чотири м'які перфоровані перегородки, розташовані усередині контейнера, який обладнаний строповою конструкцією, яка з'єднується між собою на дні мішка, вантажопідйомні петлі якої мають роз'ємне з'єднання з м'яким контейнером у верхній основі, а також сполучені між собою додатковою строповою стрічкою розподілу навантаження, яка, в свою чергу, також має

з'єднання з контейнером у верхній його основі, стропові стрічки, розташовані по зовнішньому периметру контейнера причому висота контейнера становить до 3500 мм.



Фіг. 1

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

(21) **а 2023 03195** (51) МПК
(22) **01.12.2021** **C01B 33/158** (2006.01)

(31) **63/119,801**

(32) **01.12.2020**

(33) **US**

(85) **30.06.2023**

(86) **PCT/EP2021/083714, 01.12.2021**

(71) **АЕРОБЕЛ БВ (ВЕ)**

(72) **де Путтер Стів (ВЕ), Штейнер Стівен А. Ії (US), Гріффін Джастін С. (US)**

(54) ВЕРТИКАЛЬНО ІНТЕГРОВАНЕ ВИГОТОВЛЕННЯ АЕРОГЕЛІВ НА ОСНОВІ ДІОКСИДУ КРЕМНІЮ З РІЗНИХ ДЖЕРЕЛ ДІОКСИДУ КРЕМНІЮ

(57) 1. Спосіб виготовлення аерогелю, при цьому спосіб включає:

проведення реакції джерела діоксиду кремнію із сумішшю, яка містить:

i) метанол та/або етанол і

ii) один або більше C_3 - C_5 спиртів,

iii) необов'язково жирну кислоту і

iv) необов'язково органічний полімер, завдяки чому забезпечується утворення алкоксиду кремнію, який містить:

i) метоксигрупу та/або етоксигрупу, і

ii) одну або більше C_3 - C_5 алкоксигруп, і

iii) необов'язково групу складного ефіру жирної кислоти;

гідроліз алкоксиду кремнію;

утворення силікагелю з гідролізованого алкоксиду кремнію та висушування силікагелю з одержанням аерогелю;

який відрізняється тим, що ступінь гідролізу є таким, що щонайменше деякі з алкоксигруп алкоксиду кремнію є присутніми на твердій сітці одержаного аерогелю.

2. Спосіб за п. 1, який відрізняється тим, що джерело діоксиду кремнію містить діоксид кремнію, одержаний із рисового лушпиння, кременистий пісок, діоксид кремнію, одержаний зі скла, та/або діоксид кремнію, одержаний зі скловолокна.

3. Спосіб за будь-яким із пп. 1-2, який відрізняється тим, що один або більше C_3 - C_5 спиртів вибрані з групи, яка включає ізопропанол, н-пропанол, трет-бутанол, втор-бутанол, н-бутанол, аміловий спирт, або органічний полімер являє собою поліол, більш переважно полівініловий спирт.

4. Спосіб за будь-яким із пп. 1-3, який відрізняється тим, що молярне співвідношення i) метанолу та/або етанолу і ii) одного або більше C_3 - C_5 спиртів у суміші становить від 1:1 до 4:1, переважно від 2:1 до 3:1.

5. Спосіб за будь-яким із пп. 1-4, який відрізняється тим, що одна або більше C_3 - C_5 алкоксигруп вибрані з групи, яка включає ізопропоксигрупу, н-пропоксигрупу, трет-бутоксигрупу, втор-бутоксигрупу, н-бутоксигрупу та амілоксигрупу.

6. Спосіб за будь-яким із пп. 1-5, який відрізняється тим, що алкоксид кремнію містить метоксигрупу та ізопропоксигрупу.

7. Спосіб за будь-яким із пп. 1-6, який відрізняється тим, що висушування здійснюють під тиском навколишнього середовища.

8. Спосіб за будь-яким із пп. 1-7, який відрізняється тим, що висушування здійснюють у присутності мікрохвильового випромінювання.

9. Спосіб за будь-яким із пп. 1-8, який відрізняється тим, що висушування здійснюють шляхом надкритичної екстракції порової рідини із силікагелю.

10. Спосіб за будь-яким із пп. 1-9, який відрізняється тим, що аерогель містить алкоксигрупу на своїй поверхні.

11. Спосіб за будь-яким із пп. 1-10, який відрізняється тим, що аерогель містить ізопропоксигрупу на своїй поверхні.

12. Спосіб за будь-яким із пп. 1-11, який відрізняється тим, що аерогель демонструє крайовий кут змочування, який становить більше 100° .

13. Спосіб за будь-яким із пп. 1-12, який відрізняється тим, що аерогель демонструє 24-годинне поглинання води, яке становить менше 15 %.

14. Спосіб за будь-яким із пп. 1-13, який відрізняється тим, що приєднання гідрофобної групи до силікагелю здійснюють за допомогою мікрохвильового випромінювання.

15. Спосіб за будь-яким із пп. 1-14, який відрізняється тим, що приєднання гідрофобної групи до силікагелю здійснюють у надкритичних умовах.

16. Спосіб за будь-яким із пп. 1-15, який відрізняється тим, що утворення алкоксиду кремнію здійснюють у присутності осушувача та/або поглинача води.

17. Спосіб за будь-яким із пп. 1-16, який відрізняється тим, що утворення алкоксиду кремнію здійснюють у присутності каталізатора, який включає в себе основу, сіль амонію, фторидну сполуку та їх суміші або вибраний із них.

18. Спосіб за п. 17, який відрізняється тим, що основа вибрана з групи, яка включає гідроксид лужного металу, гідроксид лужноземельного металу, аміак, гідроксид амонію, первинний амін, вторинний амін, третинний амін, сполуку четвертинного аміну та їх суміші.

19. Спосіб за п. 17, який відрізняється тим, що каталіз гідролізу алкоксиду кремнію та/або утворення силікагелю здійснюють за допомогою каталізатора, що використовується для каталізу утворення алкоксиду кремнію.

20. Спосіб за п. 17, який відрізняється тим, що каталіз гідролізу алкоксиду кремнію та/або утворення силікагелю здійснюють за допомогою основи, що використовується для каталізу утворення алкоксиду кремнію.

21. Спосіб за п. 16, який відрізняється тим, що осушувач та/або поглинач води, що використовуються для утворення алкоксиду кремнію, піддають гідратації до основного або кислого компонента, який змінює pH системи, коли воду додають назад до системи для індукування гідролізу алкоксидів.

22. Спосіб за будь-яким із пп. 1-21, при цьому спосіб додатково включає етап відновлення гідроксилвмісної органічної молекули, одержаної в результаті гідролізу алкоксиду кремнію та/або утворення силікагелю; та використання відновленої гідроксилвмісної органічної молекули для одержання іншого алкоксиду кремнію.

23. Спосіб за п. 22, який відрізняється тим, що відновлення гідроксилвмісної органічної молекули здійснюють у присутності осушувача та/або поглинача води.

C 07

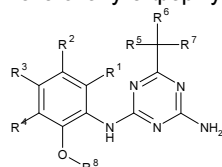
(21) а 2023 03636 (51) МПК (2024.01)
(22) 17.01.2022 C07D 251/18 (2006.01)
A01N 43/68 (2006.01)
A01P 13/00

(31) 21153660.2
(32) 27.01.2021
(33) EP
(85) 27.07.2023
(86) PCT/EP2022/050852, 17.01.2022
(71) БАСФ СЕ (DE)

(72) Гірдінк Денні (NL), Вітчель Маттіас (DE), Лопес Каррільйо Вероніка (DE), Ньютон Тревор Вілльям (DE), Зірке Томас (DE), Рек Майкл (DE), Петкова Десислава Славчева (DE), Хартмюллер Мартін (DE), Ланге Сандра (DE), Зайтц Томас (DE)

(54) ДІАМІНОТРИАЗИНОВІ СПОЛУКИ

(57) 1. Діамінотриазинова сполука формули (I)



де

R¹ являє собою Cl, Br, I, CR^{1A};

де R^{1A} являє собою H або галоген;

R² вибирають з групи, що містить H, галоген, CR^{2A};

де R^{2A} являє собою H або галоген;

R³ являє собою H, галоген;

R⁴ вибирають з групи, що містить галоген, CR^{4A};

де R^{4A} являє собою H або галоген;

R⁵ вибирають з групи, що містить H, галоген, CN, C₁-C₆-алкіл, (C₁-C₆-алкокси)-C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, (C₃-C₆-циклоалкіл)-C₁-C₄-алкіл, C₁-C₆-алкокси, C₂-C₆-алкенілокси, C₂-C₆-алкінілокси, C₃-C₆-циклоалкокси, (C₃-C₆-циклоалкіл)-C₁-C₄-алкокси, де аліфатичні і циклоаліфатичні частини радикалів є незаміщеними, частково або повністю галогенованими;

R⁶ вибирають з групи, що містить H, галоген, CN, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₆-алкокси і C₁-C₆-галогеналкокси;

R⁷ вибирають з групи, що містить галоген, CN, C₁-C₆-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₃-C₆-алкініл, C₃-C₆-циклоалкіл, (C₃-C₆-циклоалкіл)-C₁-C₄-алкіл, C₃-C₆-циклоалкеніл і C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкіл, де аліфатичні і циклоаліфатичні частини радикалів є незаміщеними, частково або повністю галогенованими;

R⁶ і R⁷ разом з атомом карбону, до якого вони приєднані, утворюють замісник, що вибирають з групи, яка містить карбоніл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-циклоалкеніл, три-шести-членний насичений або частково ненасичений гетероциклі, і замісник >C=CR^xR^y, де R^x та R^y являють собою гідроген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-га-

логеналкіл, C₃-C₆-циклоалкіл або CR^xR^y утворюють 3-6-членний циклоалкіл;

R⁸ вибирають з групи, що містить C₁-C₆-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкініл, (C₁-C₆-алкокси)-C₁-C₆-алкіл, (C₁-C₆-алкокси)-C₂-C₆-алкеніл, (C₁-C₆-алкокси)-C₂-C₆-алкініл, (C₁-C₆-циклоалкіл)-C₂-C₆-алкініл, (C₃-C₆-циклоалкіл)-C₁-C₄-алкіл, (C₃-C₆-циклоалкокси)-C₁-C₄-алкіл, де згадані вище радикали є незаміщеними, частково або повністю галогенованими та де циклоаліфатичні частини останніх 6 згаданих радикалів можуть нести 1, 2, 3, 4, 5 або 6 метильних груп,

включаючи її сільськогосподарсько прийнятні солі.

2. Сполука за п. 1, де R² вибирають з групи, що містить Cl, Br, CH₃.

3. Сполука за будь-яким з пп. 1 або 2, де R⁴ вибирають з групи, що містить H, F, CH₃.

4. Сполука за будь-яким з пп. 1-3, де R³ являє собою H.

5. Сполука за будь-яким з пп. 1-4, де R⁴ вибирають з групи, що містить F, Cl, Br, CH₃.

6. Сполука за будь-яким з пп. 1-5, де

R⁵ вибирають з групи, що містить гідроген, флуор, C₁-C₄-алкіл і C₁-C₄-алкокси;

R⁶ вибирають з групи, що містить гідроген, флуор, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкокси і C₁-C₆-галогеналкокси;

R⁷ вибирають з групи, що містить C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₃-C₆-алкініл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-циклоалкеніл, і C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкіл;

або

R⁶ і R⁷ разом з атомом карбону, до якого вони приєднані, утворюють замісник, що вибирають з групи, яка містить C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-циклоалкеніл і три-шести-членний насичений або частково ненасичений гетероциклі.

7. Сполука за будь-яким з пп. 1-6, де

R⁵ вибирають з групи, що містить гідроген, флуор;

R⁶ вибирають з групи, що містить гідроген, флуор, C₁-C₄-алкіл;

R⁷ вибирають з групи, що містить C₁-C₆-алкіл;

або

R⁶ і R⁷ разом з атомом карбону, до якого вони приєднані, утворюють замісник, що вибирають з групи, яка містить C₃-C₆-циклоалкіл.

8. Сполука за будь-яким з пп. 1-7, де

R⁸ вибирають з групи, що містить C₁-C₆-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкініл, (C₁-C₆-алкокси)-C₁-C₆-алкіл.

9. Сполука за будь-яким з пп. 1-8, де

R⁸ вибирають з групи, що містить CH₃, CH₂CC, CH₂CCCH₃, CH₂OCH₃.

10. Агрохімічна композиція, що містить гербіцидноактивну кількість, принаймні, однієї сполуки за будь-яким з пп. 1-9 і, принаймні, один інертний рідкий і/або твердий носій і, якщо необхідно, принаймні, одну поверхнево-активну речовину.

11. Спосіб контролю небажаної рослинності, що включає дію гербіцидноактивної кількості, принаймні, однієї сполуки за будь-яким з пп. 1-10 на рослини, їх оточення або на насіння.

12. Застосування сполуки за будь-яким з пп. 1-11 в якості гербіциду або для десикації/дефоліації рослин.

(21) а 2023 04858
(22) 15.03.2022

(51) МПК
C07D 417/14 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)
A61P 25/18 (2006.01)

(31) 63/162,333

(32) 17.03.2021

(33) US

(85) 16.10.2023

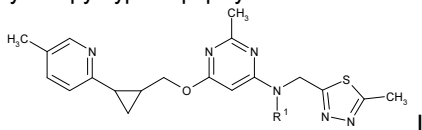
(86) PCT/US2022/020297, 15.03.2022

(71) МЕРК ШАРП ЕНД ДОУМ ЕЛЕЛСІ (US)

(72) Міттел Сечін (US), Скадларек Джейсон У. (US), Рахім Іззат Т. (US)

(54) ПРОЛІКАРСЬКІ ЗАСОБИ СПОЛУК PDE10

(57) 1. Сполука структурної формули I:



або її фармацевтично прийнятна сіль, де:

R¹ вибраний із групи, яка складається з

1) -C(O)OCH₂OC(O)R²;

2) -C(O)OC₁₋₆алкілу, причому вказаний алкіл необов'язково заміщений 1-3 групами R^a;

3) -C(O)-C₆₋₁₀арилу, C(O)-C₄₋₁₀гетероарилу, -C(O)-C₁₋₆алкілу, -C(O)-C₃₋₆циклоалкілу, причому вказаний арил, гетероарил, алкіл і циклоалкіл необов'язково заміщені 1-3 групами R^a;

4) -S-C₆₋₁₀арилу, -S-C₄₋₁₀гетероарилу, -S-C₁₋₆алкілу, -S-C₃₋₆циклоалкілу, причому вказаний арил, гетероарил, алкіл і циклоалкіл необов'язково заміщені 1-3 групами R^a; і

5) -C(O)OCH₂діоксолілу, необов'язково заміщеного 1-2 групами R^a;

R² вибраний із групи, яка складається з C₁₋₆алкілу, C₆₋₁₀арилу, C₄₋₁₀гетероарилу і C₃₋₆циклоалкілу; причому вказаний алкіл, арил гетероарил і циклоалкіл необов'язково заміщені 1-3 групами R^a;

R^a незалежно вибраний із групи, яка складається з C₁₋₆алкілу, OC₁₋₆алкілу, оксо і галогену.

2. Сполука за п. 1, де R¹ являє собою -C(O)OCH₂OC(O)R², або її фармацевтично прийнятна сіль.

3. Сполука за пп. 1 і 2, де R² являє собою C₆₋₁₀арил, причому вказаний арил є незаміщеним або заміщений 1-3 групами R^a, або її фармацевтично прийнятна сіль.

4. Сполука за будь-яким із пп. 1-3, де R² являє собою феніл або нафтил, причому вказаний феніл і нафтил є незаміщеними або заміщені 1-3 групами R^a, або її фармацевтично прийнятна сіль.

5. Сполука за будь-яким із пп. 1-4, де R² являє собою феніл, незаміщений або заміщений 1-3 групами R^a, або її фармацевтично прийнятна сіль.

6. Сполука за будь-яким із пп. 1 або 2, де R² являє собою C₁₋₆алкіл, незаміщений або заміщений 1-3 групами R^a, або її фармацевтично прийнятна сіль.

7. Сполука за будь-яким із пп. 1 або 2, де R² являє собою C₄₋₁₀гетероарил, незаміщений або заміщений 1-3 групами R^a, або її фармацевтично прийнятна сіль.

8. Сполука за п. 7, де R² являє собою піридил або піримідиніл, де піридил і піримідиніл є незаміщеними або заміщені 1-3 групами R^a, або її фармацевтично прийнятна сіль.

9. Сполука за пп. 1 і 2, де R² являє собою C₃₋₆циклоалкіл; причому вказаний циклоалкіл є незаміщеним або заміщений 1-3 групами R^a, або її фармацевтично прийнятна сіль.

10. Сполука за п. 9, де R² являє собою циклобутил, циклопентил або циклогексил, де циклобутил, циклопентил і циклогексил є незаміщеними або заміщені 1-3 групами R^a, або її фармацевтично прийнятна сіль.

11. Сполука за п. 1, де R¹ являє собою C(O)OC₁₋₆алкіл, причому вказаний алкіл необов'язково заміщений 1-3 групами R^a, де C₁₋₆алкіл -C(O)OC₁₋₆алкілу не являє собою трет-бутил, або її фармацевтично прийнятна сіль.

12. Сполука за п. 1, де R¹ являє собою -S-C₆₋₁₀арил або -C(O)-C₆₋₁₀арил, причому вказаний арил необов'язково заміщений 1-3 групами R^a, або її фармацевтично прийнятна сіль.

13. Сполука за п. 12, де арил являє собою феніл або нафтил, причому вказаний феніл або нафтил є незаміщеними або заміщені 1-3 групами R^a, або її фармацевтично прийнятна сіль.

14. Сполука за п. 1, де R¹ являє собою -C(O)OCH₂діоксоліл, причому вказаний діоксоліл є незаміщеним або заміщений 1-3 групами R^a, або її фармацевтично прийнятна сіль.

15. Сполука за п. 1, яка являє собою:

(5-метил-2-оксо-1,3,4-тіадіазол-4-іл)метил ((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)-(2-метил-6-(((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)карбамат;

N-((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)-N-(2-метил-6-(((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-ил)-S-фенілтіогідроксиамін;

N-((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)-N-(2-метил-6-(((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)бензамід;

пентил ((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)(2-метил-6-(((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)карбамат;

((((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)(2-метил-6-(((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-ил)карбамоїл)окси)метил бензоат;

((2-метил-6-(((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)карбамоїл)окси)метил гексаноат;

((2-метил-6-(((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)карбамоїл)окси)метил пропаноат;

((2-метил-6-(((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)карбамоїл)окси)метил піридин-4-карбоксилат;

((2-метил-6-(((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)карбамоїл)окси)метил піридин-2-карбоксилат;

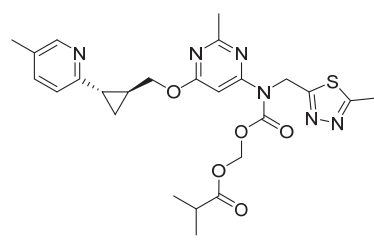
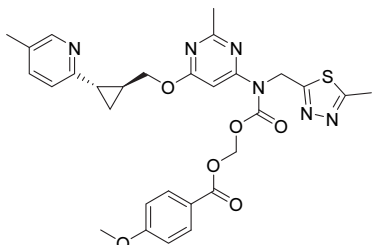
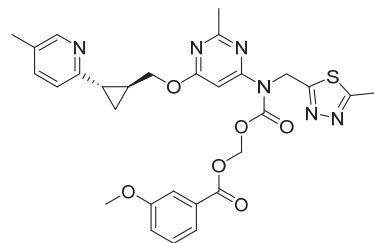
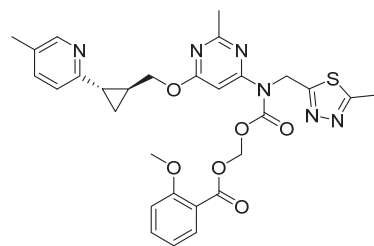
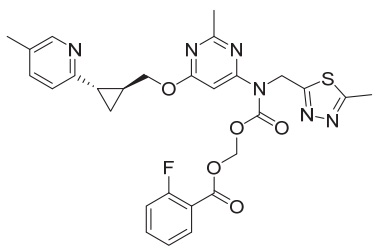
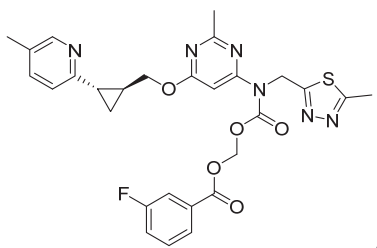
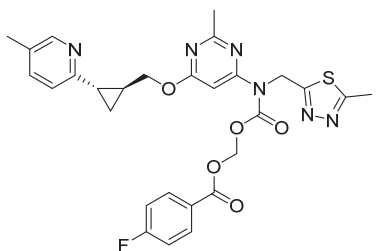
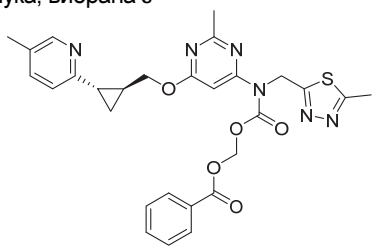
((2-метил-6-(((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)карбамоїл)окси)метил піридин-3-карбоксилат;

((2-метил-6-(((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)карбамоїл)окси)метил 4-фторбензоат;

((2-метил-6-(((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)карбамоїл)окси)метил 3-фторбензоат;

((2-метил-6-((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)карбамоїл)окси)метил 2-фторбензоат;
 ((2-метил-6-((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)карбамоїл)окси)метил 2-метоксибензоат;
 ((2-метил-6-((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)карбамоїл)окси)метил 3-метоксибензоат;
 ((2-метил-6-((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)карбамоїл)окси)метил 4-метоксибензоат;
 ((2-метил-6-((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)карбамоїл)окси)метил 2-метилпропаноат;
 ((2-метил-6-((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)карбамоїл)окси)метил циклогексанкарбоксилат; або
 ((2-метил-6-((1S,2S)-2-(5-метилпіридин-2-іл)циклопропіл)метокси)піримідин-4-іл)((5-метил-1,3,4-тіадіазол-2-іл)метил)карбамоїл)окси)метил 2-етилбуаноат;
 або її фармацевтично прийнятна сіль.

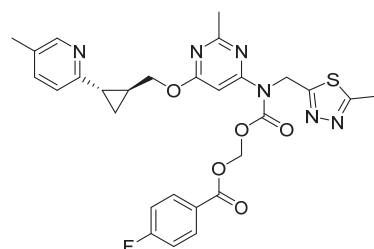
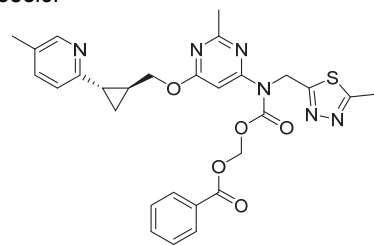
16. Сполука, вибрана з

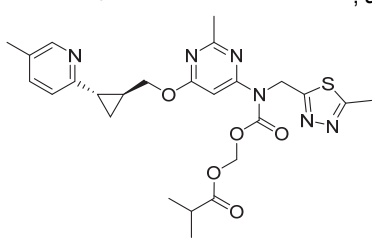
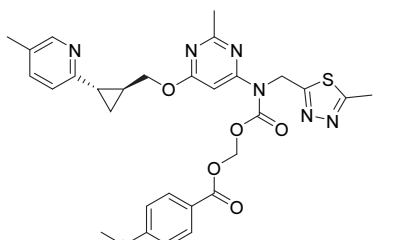
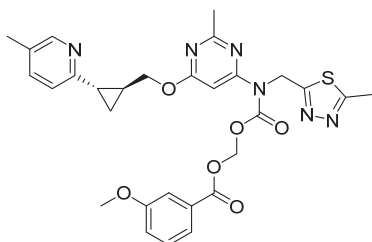
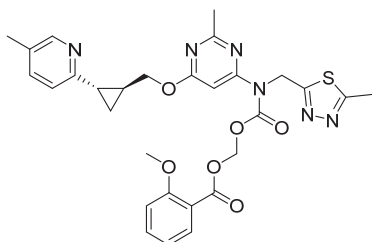
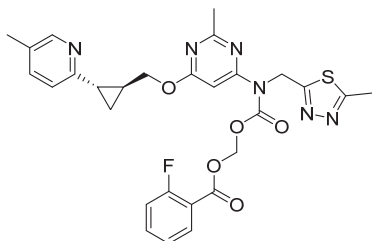
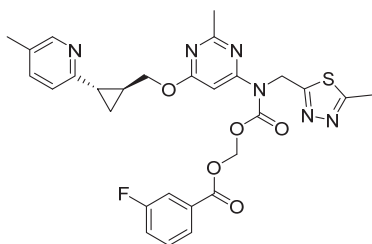


або її фармацевтично прийнятна сіль.

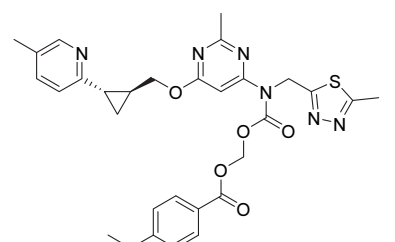
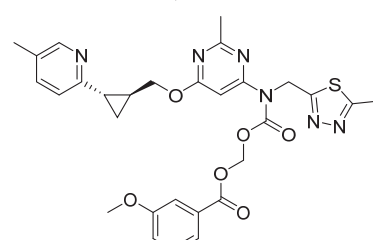
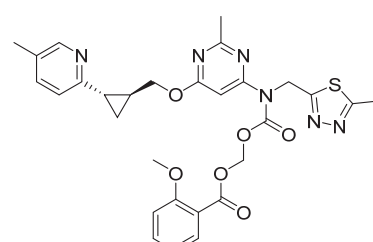
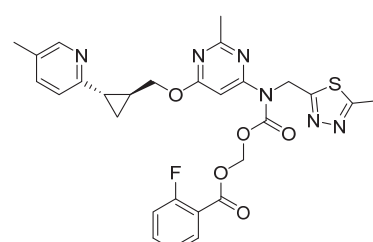
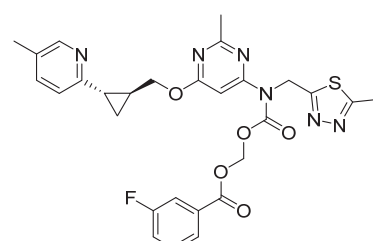
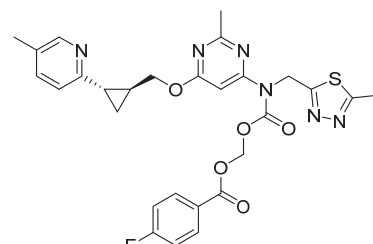
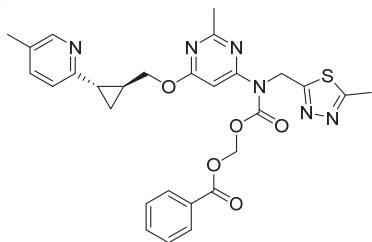
17. Фармацевтична композиція, яка містить фармацевтично прийнятний носій і сполуку за п. 1 або її фармацевтично прийнятну сіль.

18. Фармацевтична композиція за п. 17, де сполука являє собою:

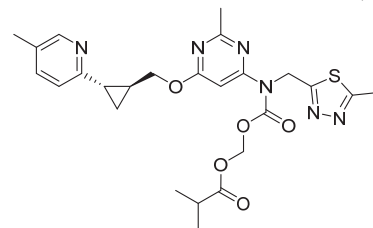




або її фармацевтично прийнятну сіль.
19. Сполука за п. 16, яка являє собою



, або



20. Сполука за будь-яким із пп. 1-16 або її фармацевтично прийнятна сіль для застосування у виготов-

ленні лікарського засобу для лікування розладу, вибраного із психотичних розладів, маревних розладів, психозів, індукованих лікарським засобом, тривожних розладів, рухових розладів і нейродегенеративних розладів.

21. Сполука за будь-яким із пп. 1-16 або її фармацевтично прийнятна сіль для застосування у виготовленні лікарського засобу для лікування шизофренії.

22. Сполука за будь-яким із пп. 1-16 або її фармацевтично прийнятна сіль для застосування у лікуванні неврологічного або психіатричного розладу, пов'язаного з дисфункцією PDE10, у пацієнта-савця, який потребує цього.

(21) а 2023 06106
(22) 18.05.2022

(51) МПК (2024.01)
C07D 471/04 (2006.01)
A61K 31/496 (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01)
A61P 29/00
A61P 19/10 (2006.01)
A61P 35/00

(31) 10-2021-0064416

(32) 18.05.2021

(33) KR

(85) 06.02.2024

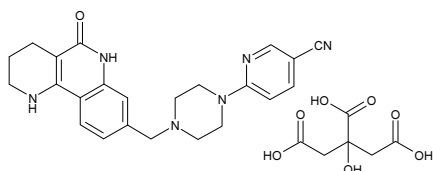
(86) РСТ/KR2022/007101, 18.05.2022

(71) ОНКОНИК ТЕРАПЬЮТИКС ИНК. (KR)

(72) Чон Сон Хен (KR), Ан Чон Гі (KR), Кім Джон (KR)

(54) КРИСТАЛІЧНА ФОРМА ТРИЦИКЛІЧНОЇ ПОХІДНОЇ СПОЛУКИ, СПОСІБ ЇЇ ОТРИМАННЯ І ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЯКА ЇЇ МІСТИТЬ

(57) 1. Кристалічна форма цитрату трициклічної похідної сполуки, представлена наступною формулою:



2. Кристалічна форма цитрату трициклічної похідної сполуки за п. 1, яка відрізняється тим, що цитрат трициклічної похідної сполуки являє собою ангідрат.

3. Кристалічна форма цитрату трициклічної похідної сполуки за п. 2, яка відрізняється тим, що кристалічна форма додатково має значення 2θ ($\pm 0,2^\circ$) $10,01^\circ$, $15,86^\circ$, $19,62^\circ$ і $26,58^\circ$ на порошковій дифрактограмі.

4. Кристалічна форма цитрату трициклічної похідної сполуки за п. 3, яка відрізняється тим, що кристалічна форма додатково має значення 2θ ($\pm 0,2^\circ$) $9,79^\circ$, $20,10^\circ$ і $27,71^\circ$ на порошковій дифрактограмі.

5. Кристалічна форма цитрату трициклічної похідної сполуки за п. 1, яка відрізняється тим, що цитрат трициклічної похідної сполуки являє собою моногідрат.

6. Кристалічна форма цитрату трициклічної похідної сполуки за п. 5, яка відрізняється тим, що кристалічна форма має значення 2θ ($\pm 0,2^\circ$) $6,94^\circ$, $9,99^\circ$, $16,57^\circ$, $18,17^\circ$, $23,68^\circ$ і $26,39^\circ$ на порошковій дифрактограмі.

7. Кристалічна форма цитрату трициклічної похідної сполуки за п. 6, яка відрізняється тим, що кристалі-

чна форма додатково має значення 2θ ($\pm 0,2^\circ$) $11,89^\circ$, $13,35^\circ$, $15,07^\circ$ і $20,90^\circ$ на порошковій дифрактограмі.

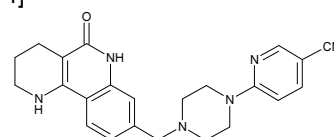
8. Кристалічна форма цитрату трициклічної похідної сполуки за п. 1, яка відрізняється тим, що цитрат трициклічної похідної сполуки являє собою дигідрат.

9. Кристалічна форма цитрату трициклічної похідної сполуки за п. 8, яка відрізняється тим, що кристалічна форма має значення 2θ ($\pm 0,2^\circ$) $8,15^\circ$, $10,96^\circ$, $16,09^\circ$, $21,47^\circ$, $25,45^\circ$ і $26,86^\circ$ на порошковій дифрактограмі.

10. Кристалічна форма цитрату трициклічної похідної сполуки за п. 9, яка відрізняється тим, що кристалічна форма додатково має значення 2θ ($\pm 0,2^\circ$) $13,35^\circ$, $18,73^\circ$ і $28,51^\circ$ на порошковій дифрактограмі.

11. Кристалічна форма трициклічної похідної сполуки, представлена формулою 1 нижче:

[Формула 1]



12. Кристалічна форма трициклічної похідної сполуки за п. 11, яка відрізняється тим, що кристалічна форма має значення 2θ ($\pm 0,2^\circ$) $7,88^\circ$, $10,23^\circ$, $15,16^\circ$, $19,27^\circ$, $22,79^\circ$ і $23,94^\circ$ на порошковій дифрактограмі.

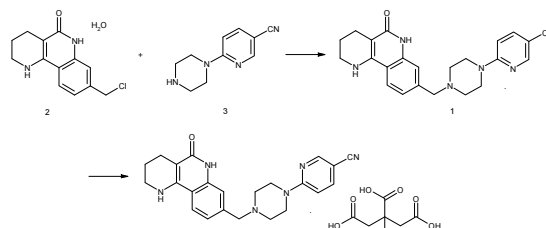
13. Кристалічна форма трициклічної похідної сполуки за п. 11, яка відрізняється тим, що кристалічна форма має значення 2θ ($\pm 0,2^\circ$) $7,95^\circ$, $10,25^\circ$, $13,25^\circ$, $13,78^\circ$, $21,12^\circ$ і $25,22^\circ$ на порошковій дифрактограмі.

14. Спосіб отримання кристалічної форми цитрату трициклічної похідної сполуки, представленої формулою 1 нижче, що включає:

(а) отримання кристалічної сполуки Формули 1 реакцією сполуки Формули 2 зі сполукою Формули 3 на схемі 1-1 нижче і подальшим проведенням процесу кристалізації; і

(б) реакцію кристалічної сполуки Формули 1 вище з лимонною кислотою за температури від 50 до 80°C в одному або декількох розчинниках, вибраних з групи, яка складається з органічного розчинника і води:

[Схема 1-1]

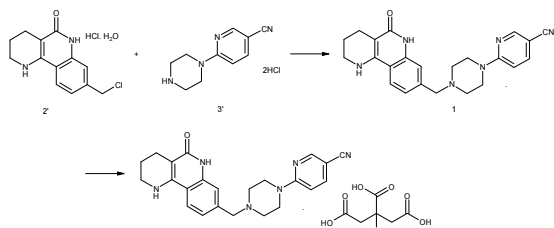


15. Спосіб отримання кристалічної форми цитрату трициклічної похідної сполуки, представленої формулою 1 нижче, що включає:

(1) отримання кристалічної сполуки Формули 1 реакцією сполуки формули 2' зі сполукою формули 3' на схемі 1-2 нижче і подальшим проведенням процесу кристалізації; і

(2) реакцію кристалічної сполуки формули 1 з лимонною кислотою за температури від 50 до 80°C в одному або декількох розчинниках, вибраних з групи, яка складається з органічного розчинника і води:

[Схема 1-2]



16. Спосіб отримання кристалічної форми цитрату трициклічної похідної сполуки за п. 14 або 15, який **відрізняється** тим, що щонайменше один з N,N-диметилформаміду (DMF), диметилацетаміду (DMAЦ), N-метилпіперидону (NMP) і диметилсульфоксиду (DMSO) використовують як розчинник реакції в реакції стадії (а) за п. 14 або стадії (1) за п. 15.

17. Спосіб отримання кристалічної форми цитрату трициклічної похідної сполуки за п. 16, який **відрізняється** тим, що метанол або воду використовують як розчинник кристалізації в процесі кристалізації на стадії (а) за п. 14 або на стадії (1) за п. 15.

18. Спосіб отримання кристалічної форми цитрату трициклічної похідної сполуки за п. 14 або 15, який **відрізняється** тим, що кристалічна форма являє собою ангідрид або гідрати.

19. Спосіб отримання кристалічної форми цитрату трициклічної похідної сполуки за п. 18, який **відрізняється** тим, що кристалічна форма являє собою ангідрид, і ангідрид отримують шляхом отримання цитрату трициклічної похідної сполуки, представленої Формулою 1, в кристалічній формі моногідрату на стадії (b) за п. 14 або на стадії (2) за п. 15, і потім перетворюють кристалічну форму моногідрату назад на кристалічну форму ангідриду.

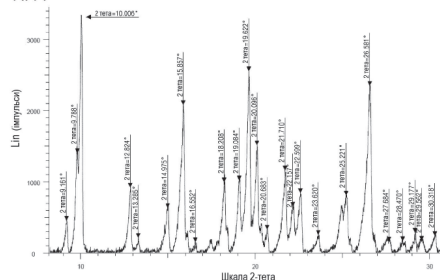
20. Спосіб отримання кристалічної форми цитрату сполуки Формули 1 за п. 14 або 15, який **відрізняється** тим, що змішаний розчинник метанолу і етанолу використовують як розчинник на стадії (b) за п. 14 або на стадії (2) за п. 15, і кристалічну форму моногідрату отримують з використанням цього розчинника.

21. Спосіб отримання кристалічної форми цитрату сполуки Формули 1 за п. 14 або 15, який **відрізняється** тим, що змішаний розчинник метанолу і етанолу використовують як розчинник на стадії (b) за п. 14 або на стадії (2) за п. 15, і кристалічну форму моногідрату отримують з використанням цього розчинника.

22. Спосіб отримання кристалічної форми цитрату сполуки формули 1 за п. 14 або 15, який **відрізняється** тим, що воду використовують як розчинник на стадії (b) за п. 14 або на стадії (2) за п. 15, і кристалічну форму дигідрату отримують з використанням цього розчинника.

23. Фармацевтична композиція, яка містить кристалічну форму за будь-яким з пп. 1-13 і один або декілька фармацевтично прийнятних носіїв або розріджувачів.

ФІГ. 7



(21) а 2023 05111
(22) 13.05.2022

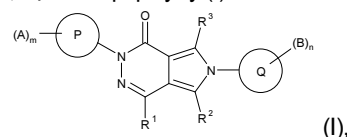
(51) МПК (2024.01)
C07D 487/04 (2006.01)
A61K 31/5025 (2006.01)
A61P 25/00

(31) 2106872.1
(32) 13.05.2021
(33) GB
(85) 11.12.2023
(86) РСТ/ЕР2022/063108, 13.05.2022
(71) АДДЕКС ФАРМА С.А. (СН)

(72) Папарен Жан-Лоран (СН), Рошер Жан-Філіп (СН), Фінн Террі (СН), Дюві Гійом (FR)

(54) КОНДЕНСОВАНІ ГЕТЕРОЦИКЛІЧНІ ПОХІДНІ ЯК НЕГАТИВНІ АЛОСТЕРИЧНІ МОДУЛЯТОРИ РЕЦЕПТОРА MGLU7

(57) 1. Сполука, що має формулу (I):

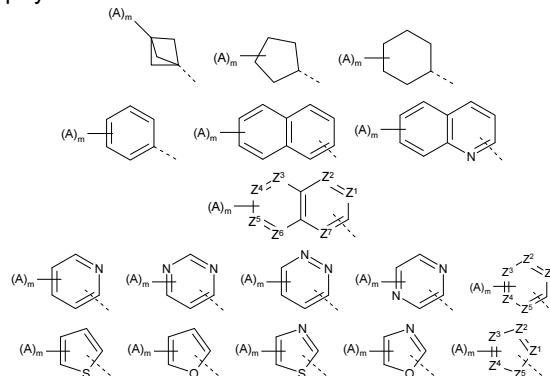


її фармацевтично прийнятна сіль приєднання кислоти або основи, її стереохімічно ізомерна форма або її N-оксидна форма, де:

R¹ вибрано з групи водню, -CH₃ і -CF₃;

кожен із R² і R³ незалежно вибрано з групи водню, -(C₁-C₆)алкілу та -(C₁-C₆)галогеналкілу, а також -CF₃;

R⁴ являє собою циклоалкіл, арил або гетероарил формули:



де кожне циклоалкільне, арильне або гетероарильне кільце необов'язково заміщено т радикалами А, де т являє собою ціле число, що дорівнює нулю, 1, 2, 3 або 4;

де кожен із Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, Z⁶ і Z⁷ незалежно вибрано із С, N, О або S; за умови, що щонайменше один із Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, Z⁶ і Z⁷ являє собою N;

цей або кожен (A)_m незалежно вибрано з групи водню, галогену, -CN, -OH, -NO₂, -CF₃, -SH, -NH₂ і необов'язково заміщеного радикала, вибраного з групи -(C₁-C₆)алкілу, -(C₁-C₆)галогеналкілу, -(C₂-C₆)алкінілу, -(C₂-C₆)алкенілу, -(C₃-C₇)циклоалкілу, -(C₁-C₆)алкілен-(C₃-C₇)циклоалкілу, -(C₃-C₈)циклоалкенілу, -(C₁-C₆)ціаноалкілу, -(C₁-C₆)алкіленгетероарилу, -(C₁-C₆)алкіленарилу, арилу, гетероарилу, -(C₁-C₆)алкіленгетероциклу, гетероциклу, -(C₀-C₆)алкілен-OR⁴, -O-(C₂-C₆)алкілен-OR⁴, -NR⁴-(C₂-C₆)алкілен-OR⁵, -(C₃-C₆)алкінілен-OR⁴, -(C₃-C₆)алкінілен-NR⁴R⁵, -(C₃-C₆)алкенілен-OR⁴, -(C₃-C₆)алкенілен-NR⁴R⁵, -(C₀-C₆)алкілен-S-R⁴, -O-(C₂-C₆)алкілен-S-R⁴, -NR⁴-(C₂-C₆)алкілен-S-R⁵, -(C₀-C₆)алкілен-S(=O)-R⁴, -O-(C₁-C₆)алкілен-S(=O)-R⁴, -NR⁴-(C₁-

C_6 алкілен-S(=O)-R⁵, -(C₀-C₆)алкілен-S(=O)₂-R⁴, -O-(C₁-C₆)алкілен-S(=O)₂-R⁴, -NR⁴-(C₁-C₆)алкілен-S(=O)₂-R⁵, -(C₀-C₆)алкілен-NR⁴R⁵, -O-(C₂-C₆)алкілен-NR⁴R⁵, -NR⁴-(C₂-C₆)алкілен-NR⁵R⁶, -(C₀-C₆)алкілен-S(=O)₂-NR⁴R⁵, -O-(C₁-C₆)алкілен-S(=O)₂-NR⁴R⁵, -NR⁴-(C₁-C₆)алкілен-S(=O)₂-NR⁵R⁶, -(C₀-C₆)алкілен-NR⁴-S(=O)₂R⁵, -O-(C₂-C₆)алкілен-NR⁴-S(=O)₂R⁵, -NR⁴-(C₂-C₆)алкілен-NR⁵-S(=O)₂R⁶, -(C₀-C₆)алкілен-C(=O)-NR⁴R⁵, -O-(C₁-C₆)алкілен-C(=O)-NR⁴R⁵, -NR⁴-(C₁-C₆)алкілен-C(=O)-NR⁵R⁶, -(C₀-C₆)алкілен-NR⁴C(=O)-R⁵, -O-(C₂-C₆)алкілен-NR⁴C(=O)-R⁵, -NR⁴-(C₂-C₆)алкілен-NR⁵C(=O)-R⁶, -(C₀-C₆)алкілен-OC(=O)-R⁴, -O-(C₂-C₆)алкілен-OC(=O)-R⁴, -NR⁴-(C₂-C₆)алкілен-OC(=O)-R⁵, -(C₀-C₆)алкілен-C(=O)-OR⁴, -O-(C₁-C₆)алкілен-C(=O)-OR⁴, -NR⁴-(C₁-C₆)алкілен-C(=O)-OR⁵, -(C₀-C₆)алкілен-C(=O)-R⁴, -O-(C₁-C₆)алкілен-C(=O)-R⁴, -NR⁴-(C₁-C₆)алкілен-C(=O)-R⁵, -(C₀-C₆)алкілен-NR⁴-C(=O)-OR⁵, -C(=O)-(C₁-C₆)алкілен-NR⁴-C(=O)-OR⁵, -(C₀-C₆)алкілен-O-C(=O)-NR⁴R⁵, -(C₀-C₆)алкілен-NR⁴-C(=O)-NR⁵R⁶, -O-(C₂-C₆)алкілен-NR⁴-C(=O)-NR⁵R⁶, -NR⁴-(C₂-C₆)алкілен-NR⁵-C(=O)-NR⁶R⁷, -(C₀-C₆)алкілен-NR⁴-C(=S)-NR⁵R⁶ і -(C₀-C₆)алкілен-NR⁴-C(=NR⁵)-NR⁶R⁷;

кожен із R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ незалежно являє собою водень або необов'язково заміщений радикал, вибраний із групи -(C₁-C₆)галогеналкілу, -(C₁-C₆)алкілу, -(C₁-C₆)ціаноалкілу, -(C₃-C₇)циклоалкілу, -(C₁-C₆)алкілен-(C₃-C₇)циклоалкілу, гетероарилу, -(C₁-C₆)алкіленгетероарилу, арилу, -(C₁-C₆)алкіленгетероциклу, гетероциклу, -(C₁-C₆)алкіленарилу, -(C₀-C₆)алкілен-O-(C₀-C₆)алкілу та -(C₀-C₆)алкілен-N-((C₀-C₆)алкілу)₂;

Q являє собою арил або гетероарил, який необов'язково заміщено n радикалами B, де n являє собою ціле число, що дорівнює нулю, 1, 2, 3, 4 або 5;

цей або кожен (B)_n незалежно вибрано з групи водню, галогену, -CN, -OH, -NO₂, -CF₃, -SH, -NH₂ і необов'язково заміщеного радикала, вибраного з групи -(C₁-C₆)алкілу, -(C₁-C₆)галогеналкілу, -(C₂-C₆)алкінілу, -(C₂-C₆)алкенілу, -(C₃-C₇)циклоалкілу, -(C₁-C₆)алкілен-(C₃-C₇)циклоалкілу, -(C₃-C₈)циклоалкенілу, -(C₁-C₆)ціаноалкілу, -(C₁-C₆)алкіленгетероарилу, -(C₁-C₆)алкіленарилу, арилу, гетероарилу, -(C₁-C₆)алкіленгетероциклу, гетероциклу, -(C₀-C₆)алкілен-OR⁸, -O-(C₂-C₆)алкілен-OR⁸, -NR⁸-(C₂-C₆)алкілен-OR⁹, -(C₃-C₆)алкінілен-OR⁸, -(C₃-C₆)алкінілен-NR⁸R⁹, -(C₃-C₆)алкенілен-OR⁸, -(C₃-C₆)алкенілен-NR⁸R⁹, -(C₀-C₆)алкілен-S-R⁸, -O-(C₂-C₆)алкілен-S-R⁸, -NR⁸-(C₂-C₆)алкілен-S-R⁹, -(C₀-C₆)алкілен-S(=O)-R⁸, -O-(C₁-C₆)алкілен-S(=O)-R⁸, -NR⁸-(C₁-C₆)алкілен-S(=O)-R⁹, -(C₀-C₆)алкілен-S(=O)₂-R⁸, -O-(C₁-C₆)алкілен-S(=O)₂-R⁸, -NR⁸-(C₁-C₆)алкілен-S(=O)₂-R⁹, -O-(C₂-C₆)алкілен-NR⁸R⁹, -O-(C₂-C₆)алкілен-NR⁸R⁹, -NR⁸-(C₂-C₆)алкілен-NR⁹R¹⁰, -(C₀-C₆)алкілен-S(=O)₂-NR⁸R⁹, -O-(C₁-C₆)алкілен-S(=O)₂-NR⁸R⁹, -NR⁸-(C₁-C₆)алкілен-S(=O)₂-NR⁹R¹⁰, -(C₀-C₆)алкілен-NR⁸-S(=O)₂R⁹, -O-(C₂-C₆)алкілен-NR⁸-S(=O)₂R⁹, -NR⁸-(C₂-C₆)алкілен-NR⁹-S(=O)₂R¹⁰, -(C₀-C₆)алкілен-C(=O)-NR⁸R⁹, -O-(C₁-C₆)алкілен-C(=O)-NR⁸R⁹, -NR⁸-(C₁-C₆)алкілен-C(=O)-NR⁹R¹⁰, -(C₀-C₆)алкілен-NR⁸-C(=O)-R⁹, -O-(C₂-C₆)алкілен-NR⁸-C(=O)-R⁹, -NR⁸-(C₂-C₆)алкілен-NR⁹-C(=O)-R¹⁰, -(C₀-C₆)алкілен-OC(=O)-R⁸, -O-(C₂-C₆)алкілен-OC(=O)-R⁸, -NR⁸-(C₂-C₆)алкілен-OC(=O)-R⁹, -(C₀-C₆)алкілен-C(=O)-OR⁸, -O-(C₁-C₆)алкілен-C(=O)-OR⁸, -NR⁸-(C₁-C₆)алкілен-C(=O)-OR⁹, -(C₀-C₆)алкілен-C(=O)-R⁸, -O-(C₁-C₆)алкілен-C(=O)-R⁸, -NR⁸-(C₁-C₆)алкілен-C(=O)-R⁹, -(C₀-C₆)алкілен-NR⁸-C(=O)-OR⁹, -(C₀-C₆)алкілен-O-C(=O)-NR⁸R⁹, -(C₀-C₆)алкілен-NR⁸-C(=O)-

NR⁹R¹⁰, -O-(C₂-C₆)алкілен-NR⁸-C(=O)-NR⁹R¹⁰, -NR⁸-(C₂-C₆)алкілен-NR⁹-C(=O)-NR¹⁰R¹¹, -(C₀-C₆)алкілен-NR⁸-C(=S)-NR⁹R¹⁰ і -(C₀-C₆)алкілен-NR⁸-C(=NR⁹)-NR¹⁰R¹¹;

кожен із R⁸, R⁹, R¹⁰ і R¹¹ незалежно являє собою водень або необов'язково заміщений радикал, вибраний із групи -(C₁-C₆)галогеналкілу, -(C₁-C₆)алкілу, -(C₁-C₆)ціаноалкілу, -(C₃-C₇)циклоалкілу, -(C₁-C₆)алкілен-(C₃-C₇)циклоалкілу, гетероарилу, -(C₁-C₆)алкіленгетероарилу, арилу, -(C₁-C₆)алкіленгетероциклу, гетероциклу, -(C₁-C₆)алкіленарилу, -(C₀-C₆)алкілен-O-(C₀-C₆)алкілу та -(C₀-C₆)алкілен-N-((C₀-C₆)алкілу)₂;

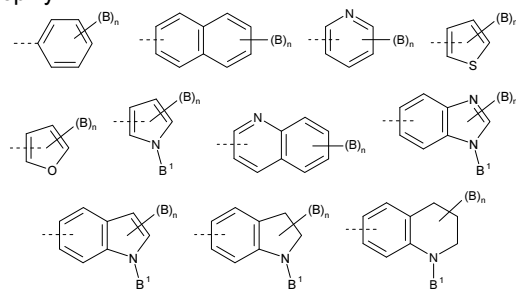
де необов'язково будь-які два радикали A об'єднані з проміжними атомами з утворенням 3-10-членного біциклічного гетероциклу, арильного або гетероарильного кільця, де кожне кільце необов'язково додатково заміщено 1-5 радикалами, незалежно вибраними з групи галогену, -CN, нітро, -(C₁-C₆)алкілу, -(C₀-C₆)алкілен-O-(C₀-C₆)алкілу та -(C₀-C₆)алкілен-N-((C₀-C₆)алкілу)₂;

де необов'язково два із замісників R⁴, R⁵, R⁶ або R⁷ об'єднані з проміжними атомами з утворенням 3-10-членного гетероциклічного, арильного або гетероарильного кільця, де кожне кільце необов'язково додатково заміщено 1-5 радикалами, незалежно вибраними з групи галогену, ціано, нітро, -(C₁-C₆)алкілу, -(C₀-C₆)алкілен-O-(C₀-C₆)алкілу та -(C₀-C₆)алкілен-N-((C₀-C₆)алкілу)₂;

де необов'язково будь-які два радикали B об'єднані з проміжними атомами з утворенням 3-10-членного біциклічного гетероциклу, арильного або гетероарильного кільця, де кожне кільце необов'язково додатково заміщено 1-5 радикалами, незалежно вибраними з групи галогену, -CN, нітро, -(C₁-C₆)алкілу, -(C₀-C₆)алкілен-O-(C₀-C₆)алкілу та -(C₀-C₆)алкілен-N-((C₀-C₆)алкілу)₂.

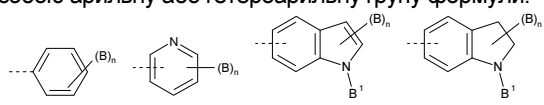
2. Сполука за п. 1, що має формулу (I), де:

Q являє собою арильну або гетероарильну групу формули:



де кожен радикал необов'язково заміщено n радикалами B, де n являє собою ціле число, що дорівнює нулю, 1, 2, 3, 4 або 5; і де B¹ являє собою радикал B.

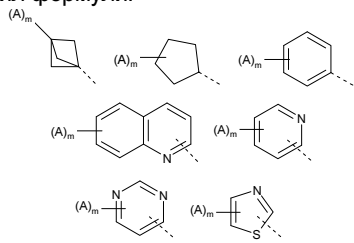
3. Сполука за п. 2, що має формулу (I), де Q являє собою арильну або гетероарильну групу формули:



де кожен радикал необов'язково заміщено p радикалами B , де p являє собою ціле число, що дорівнює нулю, 1, 2, 3, 4 або 5, і де B^1 являє собою радикал B .

4. Сполука за п. 2 або п. 3, що має формулу (I), де B^1 являє собою -водень, (C_1-C_6) алкіл або $-(C_3-C_7)$ циклоалкіл.

5. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, що має формулу (I), де P являє собою циклоалкіл, арил або гетероарил формули:



де кожен радикал необов'язково заміщено m радикалами A , де m являє собою ціле число, що дорівнює нулю, 1, 2, 3 або 4.

6. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, що має формулу (I), де:

циклоалкільні, гетероциклічні, арильні та гетероарильні кільцеві системи $(A)_m$ вибрані з групи азетидинілу, бензімідазолілу, бензізотіазолілу, бензізоксазолілу, бензофурилу, бензопіразолілу, бензотіазолілу, бензотіофенілу, бензотриазолілу, бензоксазолілу, дигідрофуранілу, дигідротієнілу, діоксоланілу, 1,1-діоксо-тіоморфолінілу, фуразанілу, фурилу, імідазолідинілу, імідазолінілу, імідазолонілу, імідазолілу, імідазопіридазинілу, імідазопіридилилу, індолілу, ізоіндолілу, ізохінолінілу, ізотіазолінілу, ізотіазолілу, ізоксазолідинілу, ізоксазолінілу, ізоксазолілу, морфолінілу, нафтилу, нафтиридинілу, оксадіазолілу, оксазолідинілу, оксазолінілу, оксазолонілу, оксазоліпіридазинілу, оксазоліпіридилилу, оксазолілу, оксетанілу, фенілу, піперазинілу, піперазинілу, піперидинонілу, піперидинілу, фталазинілу, птеридинілу, пуринілу, піранілу, піразинілу, піразолопіридинілу, піразолілу, піридазинілу, піридонілу, піридилилу, піримідилилу, піролідинонілу, піролідинілу, піролінілу, піролілу, хіназолілу, хінолілу, хіноксалінілу, тетрагідрофуранілу, тетрагідропіранілу, тетрагідротіопіранілу, тетрагідротриазолопіридилилу, тетрагідротриазолопіримідинілу, тетразолілу, тіадіазолілу, тіазолідинілу, тіазолінілу, тіазолонілу, тіазолопіридазинілу, тіазолопіридилилу, тіазолілу, тієнілу, тіоморфолінілу, тіонафтилу, тіопіранілу, триазолінілу, триазинілу, триазолілу, циклопропілу, циклобутилу, циклопентилу, циклопентенілу, циклогексилу, циклогексенілу, циклогептилу, циклогептенілу, циклооктилу та циклооктенілу, і кожне кільце вказаної кільцевої системи необов'язково незалежно заміщено 1-4 замісниками R^4 , R^5 , R^6 або R^7 .

7. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, що має формулу (I), де:

циклоалкільні, гетероциклічні, арильні та гетероарильні кільцеві системи $(B)_n$ вибрані з групи азетидинілу, бензімідазолілу, бензізотіазолілу, бензізоксазолілу, бензофурилу, бензопіразолілу, бензотіазолілу, бензотіофенілу, бензотриазолілу, бензоксазолілу, дигідрофуранілу, дигідротієнілу, діоксоланілу, 1,1-діоксо-тіоморфолінілу, фуразанілу, фурилу, імідазолідинілу, імідазолінілу, імідазолонілу, імідазолілу, імідазопіридазинілу, імідазопіридилилу, індолілу, ізоіндолілу, ізохі-

нолінілу, ізотіазолінілу, ізотіазолілу, ізоксазолідинілу, ізоксазолінілу, ізоксазолілу, морфолінілу, нафтилу, нафтиридинілу, оксадіазолілу, оксазолідинілу, оксазолінілу, оксазолонілу, оксазоліпіридазинілу, оксазоліпіридилилу, оксазолілу, оксетанілу, фенілу, піперазинілу, піперазинілу, піперидинонілу, піперидинілу, фталазинілу, птеридинілу, пуринілу, піранілу, піразинілу, піразолопіридинілу, піразолілу, піридазинілу, піридонілу, піридилилу, піримідилилу, піролідинонілу, піролідинілу, піролінілу, піролілу, хіназолілу, хінолілу, хіноксалінілу, тетрагідрофуранілу, тетрагідропіранілу, тетрагідротіопіранілу, тетрагідротриазолопіридилилу, тетрагідротриазолопіримідинілу, тетразолілу, тіадіазолілу, тіазолідинілу, тіазолінілу, тіазолонілу, тіазолопіридазинілу, тіазолопіридилилу, тіазолілу, тієнілу, тіоморфолінілу, тіонафтилу, тіопіранілу, триазолінілу, триазинілу, триазолілу, циклопропілу, циклобутилу, циклопентилу, циклопентенілу, циклогексилу, циклогексенілу, циклогептилу, циклогептенілу, циклооктилу та циклооктенілу, і кожне кільце вказаної кільцевої системи необов'язково незалежно заміщено 1-4 замісниками R^8 , R^9 , R^{10} або R^{11} .

8. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, що має формулу (I), де:

циклоалкільні, гетероциклічні, арильні та гетероарильні кільцеві системи R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} або R^{11} вибрані з групи азетидинілу, бензімідазолілу, бензізотіазолілу, бензізоксазолілу, бензофурилу, бензопіразолілу, бензотіазолілу, бензотіофенілу, бензотриазолілу, бензоксазолілу, дигідрофуранілу, дигідротієнілу, діоксоланілу, 1,1-діоксо-тіоморфолінілу, фуразанілу, фурилу, імідазолідинілу, імідазолінілу, імідазолонілу, імідазолілу, імідазопіридазинілу, імідазопіридилилу, індолілу, ізоіндолілу, ізохінолінілу, ізотіазолінілу, ізотіазолілу, ізоксазолідинілу, ізоксазолінілу, ізоксазолілу, морфолінілу, нафтилу, нафтиридинілу, оксадіазолілу, оксазолідинілу, оксазолінілу, оксазолонілу, оксазоліпіридазинілу, оксазоліпіридилилу, оксазолілу, оксетанілу, фенілу, піперазинілу, піперазинілу, піперидинонілу, піперидинілу, фталазинілу, птеридинілу, пуринілу, піранілу, піразинілу, піразолопіридинілу, піразолілу, піридазинілу, піридонілу, піридилилу, піримідилилу, піролідинонілу, піролідинілу, піролінілу, піролілу, хіназолілу, хінолілу, хіноксалінілу, тетрагідрофуранілу, тетрагідропіранілу, тетрагідротіопіранілу, тетрагідротриазолопіридилилу, тетрагідротриазолопіримідинілу, тетразолілу, тіадіазолілу, тіазолідинілу, тіазолінілу, тіазолонілу, тіазолопіридазинілу, тіазолопіридилилу, тіазолілу, тієнілу, тіоморфолінілу, тіонафтилу, тіопіранілу, триазолінілу, триазинілу, триазолілу, циклопропілу, циклобутилу, циклопентилу, циклопентенілу, циклогексилу, циклогексенілу, циклогептилу, циклогептенілу, циклооктилу та циклооктенілу, і кожне кільце вказаної кільцевої системи необов'язково незалежно заміщено 1-5 радикалами, незалежно вибраними з водню, галогену, $-CN$, нітро, (C_1-C_6) алкілу, $-(C_0-C_6)$ алкілен- O -(C_0-C_6)алкілу та $-(C_0-C_6)$ алкілен- N -(C_0-C_6)алкілу $_2$.

9. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, що має формулу (I), де кожен із R^2 і R^3 незалежно вибрані з групи водню, метилу й етилу.

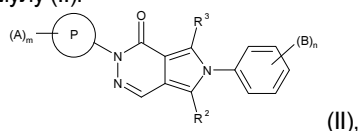
10. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, що має формулу (I), де кожен із R^4 і R^5 незалежно являє собою водень або $-(C_1-C_6)$ алкіл.

11. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, що має формулу (I), де цей або кожен $(A)_m$ незалежно вибрано з групи водню, галогену, $-\text{CN}$, $-\text{OH}$, $-\text{CF}_3$ і не обов'язково заміщеного радикала, вибраного з групи $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ алкілу, $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ галогеналкілу, $-(\text{C}_3-\text{C}_7)$ циклоалкілу, $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ ціаноалкілу, арилу, гетероциклу, $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- OR^4 , $-\text{O}-(\text{C}_2-\text{C}_6)$ алкілен- OR^4 , $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^4$, $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- NR^4R^5 , $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{S}(=\text{O})\text{NR}^4\text{R}^5$, $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{C}(=\text{O})-\text{NR}^4\text{R}^5$, $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{NR}^4\text{C}(=\text{O})-\text{R}^5$, $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^4$, $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{C}(=\text{O})-\text{R}^4$ і $-\text{C}(=\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{NR}^4-\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^5$.

12. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів формули (I), де цей або кожен $(B)_n$ незалежно вибрано з групи водню, галогену, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$ і не обов'язково заміщеного радикала, вибраного з групи $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ алкілу, $-(\text{C}_3-\text{C}_7)$ циклоалкілу, арилу, гетероарила, гетероциклу, $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- OR^8 , $-\text{NR}^8(\text{C}_2-\text{C}_6)$ алкілен- OR^9 , $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- NR^8R^9 , $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^8$ і $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{C}(=\text{O})-\text{R}^8$.

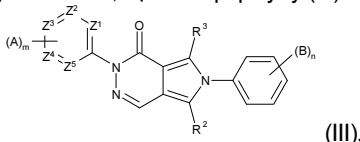
13. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, що має формулу (I), де кожен із R^8 і R^9 незалежно вибрано з групи водню, $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ галогеналкілу, $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ алкілу, $-(\text{C}_3-\text{C}_7)$ циклоалкілу й арилу.

14. Сполука за будь-яким із попередніх пунктів, що має формулу (II):



її фармацевтично прийнятна сіль приєднання кислоти або основи, її стереохімічно ізомерна форма або її N-оксидна форма.

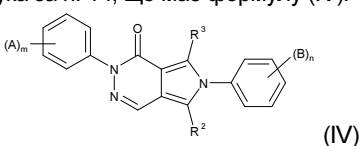
15. Сполука за п. 14, що має формулу (III):



її фармацевтично прийнятна сіль приєднання кислоти або основи, її стереохімічно ізомерна форма або її N-оксидна форма, де:

кожен із Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 і Z^5 незалежно вибрано з C або N.

16. Сполука за п. 14, що має формулу (IV):



її фармацевтично прийнятна сіль приєднання кислоти або основи, її стереохімічно ізомерна форма або її N-оксидна форма.

17. Сполука за п. 16, що має формулу (IV), де:

R^2 і R^3 незалежно вибрані з групи метилу й етилу; цей або кожен $(A)_m$ незалежно вибрано з групи водню, галогену, $-\text{CN}$, $-\text{OH}$, $-\text{CF}_3$ і не обов'язково заміщеного радикала, вибраного з групи $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ алкілу, $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ галогеналкілу, $-(\text{C}_3-\text{C}_7)$ циклоалкілу, $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ ціаноалкілу, арилу, гетероциклу, $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- OR^4 , $-\text{O}-(\text{C}_2-\text{C}_6)$ алкілен- OR^4 , $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^4$, $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- NR^4R^5 , $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{S}(=\text{O})\text{NR}^4\text{R}^5$, $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{C}(=\text{O})-\text{NR}^4\text{R}^5$, $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{NR}^4\text{C}(=\text{O})-\text{R}^5$, $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^4$, $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{C}(=\text{O})-\text{R}^4$ і $-\text{C}(=\text{O})-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{NR}^4-\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^5$;

кожен із R^4 і R^5 незалежно являє собою водень або $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ алкіл;

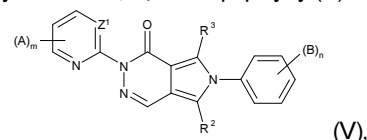
цей або кожен $(B)_n$ незалежно вибрано із групи водню, галогену та не обов'язково заміщеного радикала, вибраного з групи $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ алкілу, гетероциклу, $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- OR^8 , $-\text{NR}^8(\text{C}_2-\text{C}_6)$ алкілен- OR^9 , $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- NR^8R^9 , $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^8$ і $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{C}(=\text{O})-\text{R}^8$; та

кожен із R^8 і R^9 незалежно являє собою водень і $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ алкіл.

18. Сполука за п. 16, що має формулу (IV), де:

один або обидва з R^2 і R^3 являють собою метил.

19. Сполука за п. 14, що має формулу (V):



її фармацевтично прийнятна сіль приєднання кислоти або основи, її стереохімічно ізомерна форма або її N-оксидна форма, де:

Z^1 вибрано з C або N;

R^2 і R^3 незалежно вибрані з групи водню, метилу й етилу;

цей або кожен $(A)_m$ незалежно вибрано з групи водню, галогену, $-\text{CN}$, $-\text{OH}$, $-\text{CF}_3$ і не обов'язково заміщеного радикала, вибраного з групи $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ алкілу, $-(\text{C}_3-\text{C}_7)$ циклоалкілу, гетероциклу та $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- OR^4 ; R^4 вибрано з водню або $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ алкілу;

цей або кожен $(B)_n$ незалежно вибрано з групи водню, галогену, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$ і не обов'язково заміщеного радикала, вибраного з групи $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ алкілу, $-(\text{C}_3-\text{C}_7)$ циклоалкілу, арилу, гетероарила, гетероциклу, $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- OR^8 , $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- NR^8R^9 , $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^8$ і $-(\text{C}_0-\text{C}_6)$ алкілен- $\text{C}(=\text{O})-\text{R}^8$; та

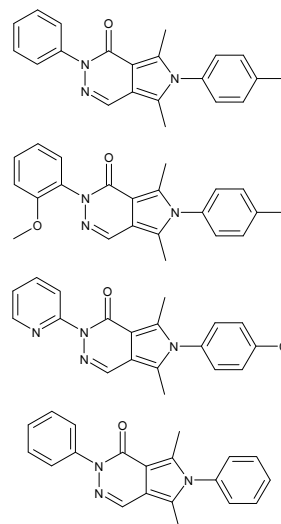
кожен із R^8 і R^9 незалежно являє собою водень, $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ галогеналкіл, $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ алкіл, $-(\text{C}_3-\text{C}_7)$ циклоалкіл або арил.

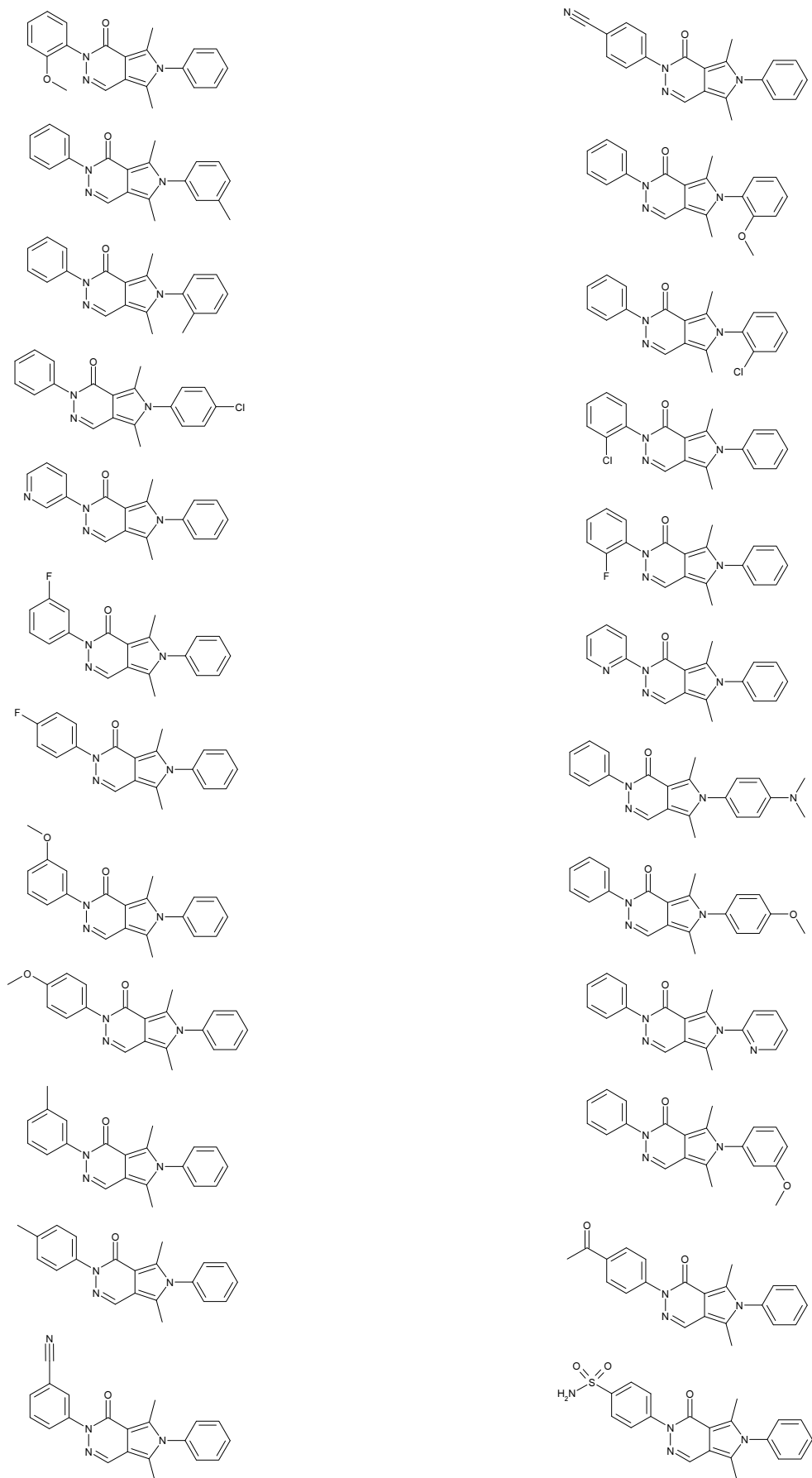
20. Сполука за п. 19, що має формулу (V), де:

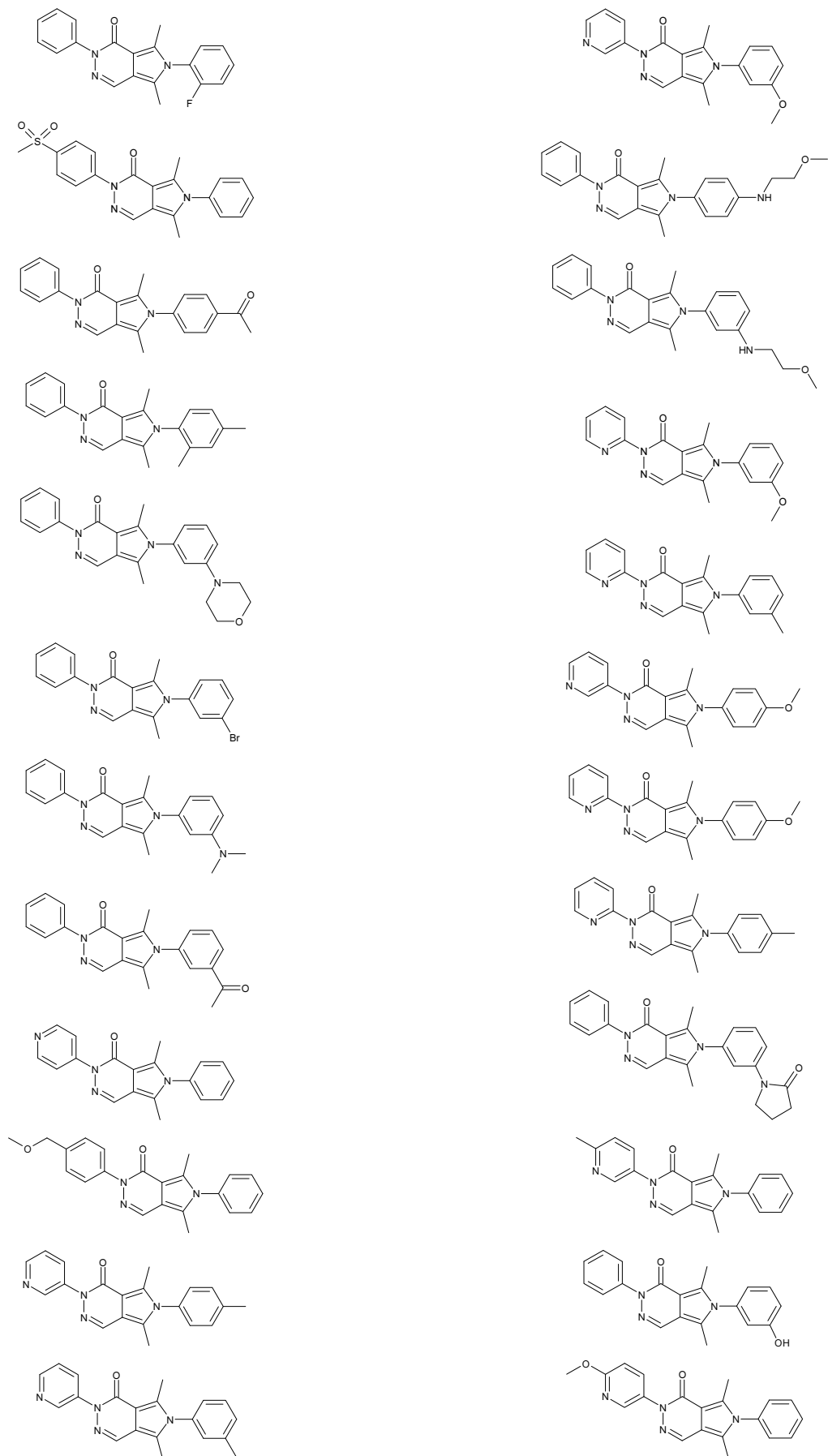
один або обидва з R^2 і R^3 являють собою метил.

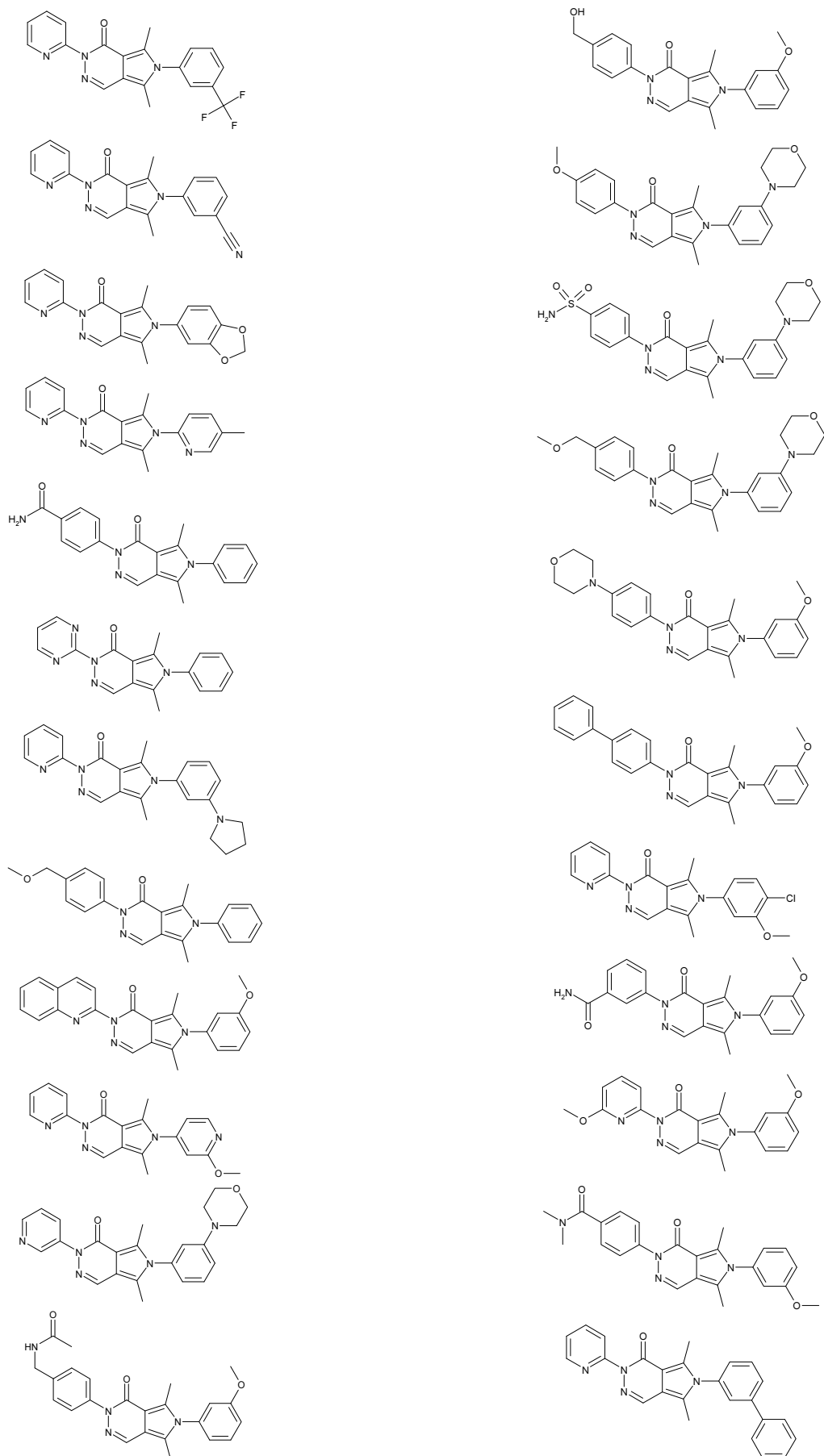
21. Сполука за пп. 1-20, де сполука може існувати у вигляді оптичних ізомерів, і де сполука являє собою або рацемічну суміш, або один або обидва індивідуальні оптичні ізомери.

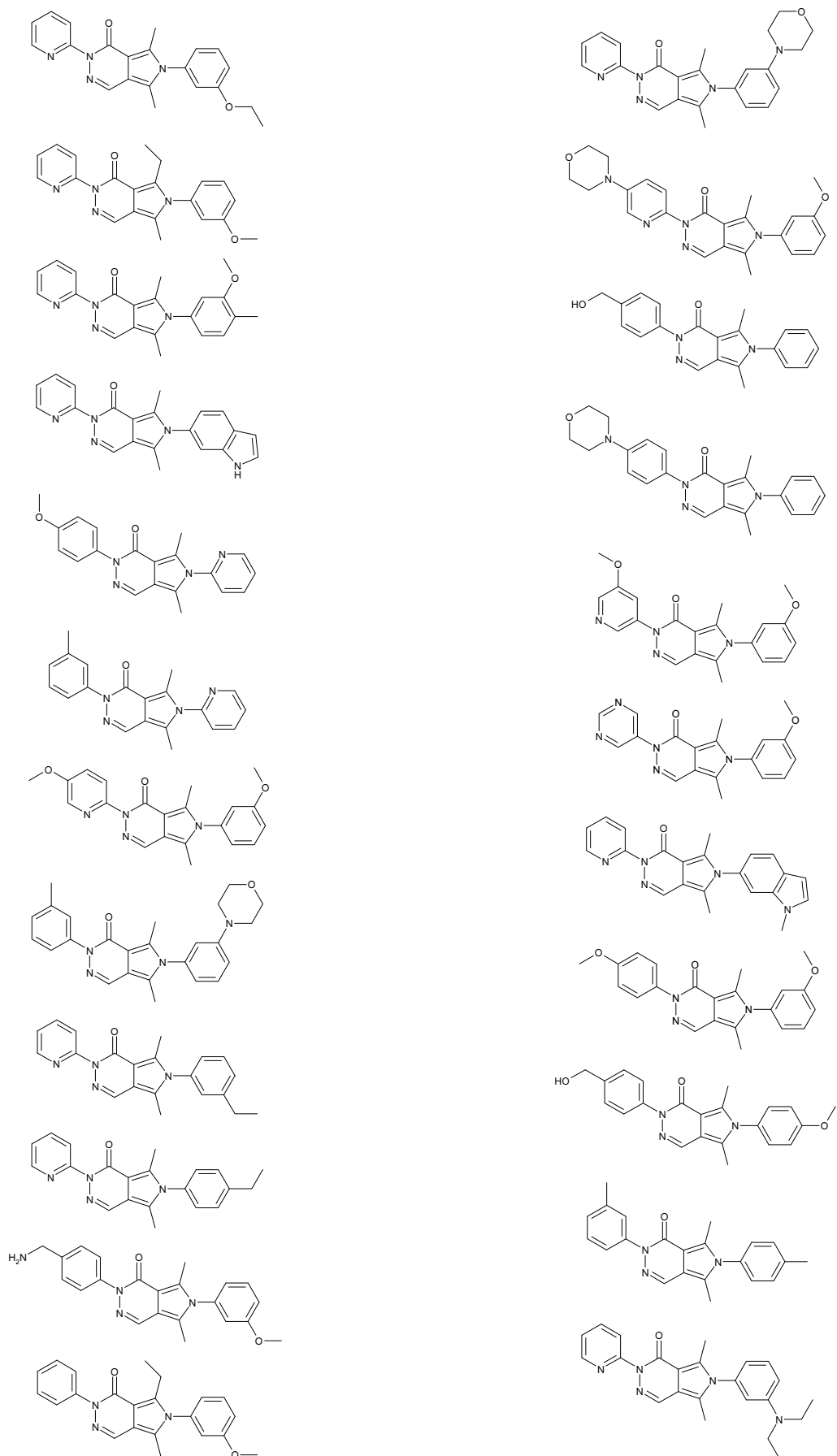
22. Сполука за пп. 1-21, де вказана сполука являє собою одну або більше вибраних із:

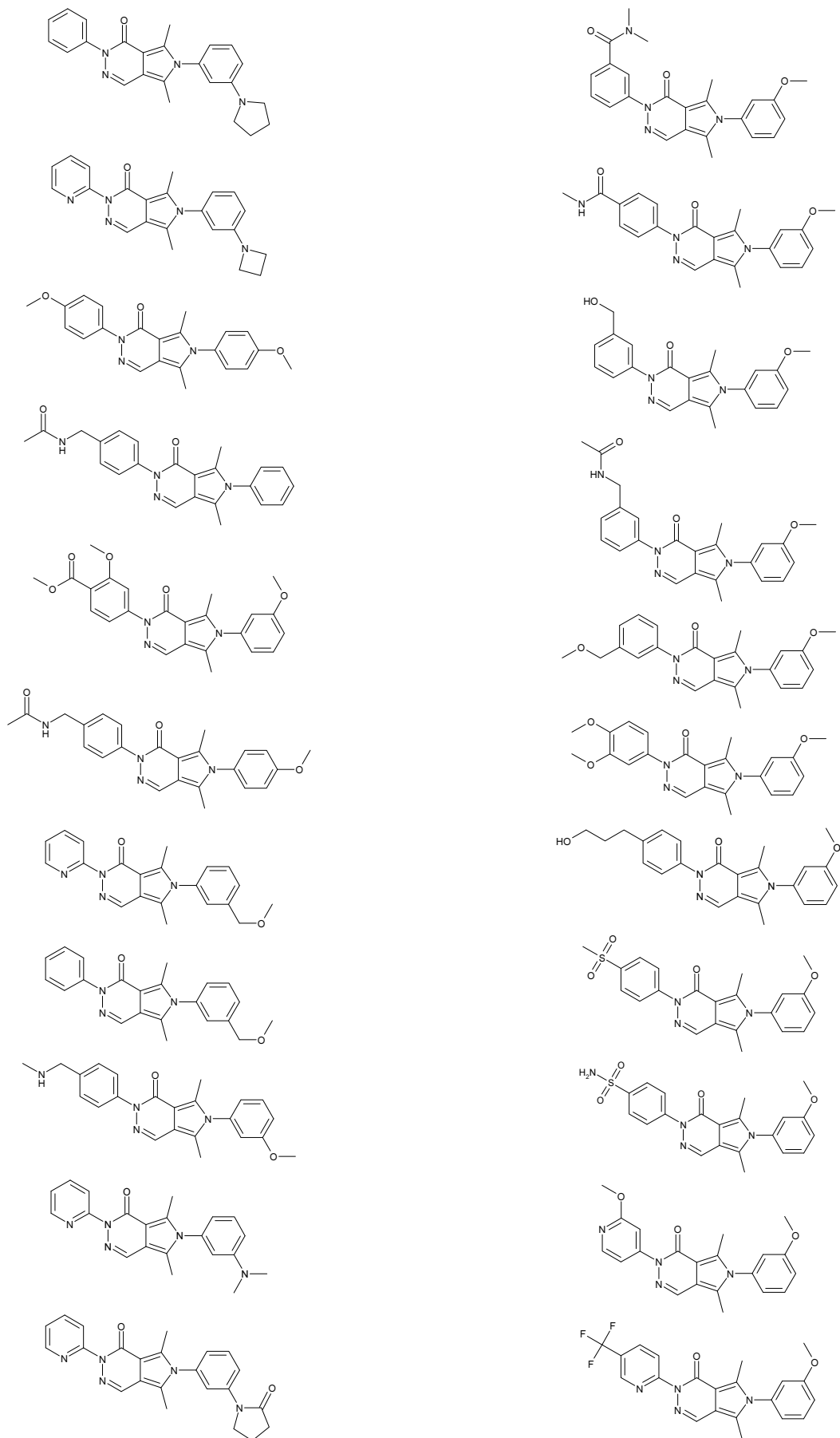


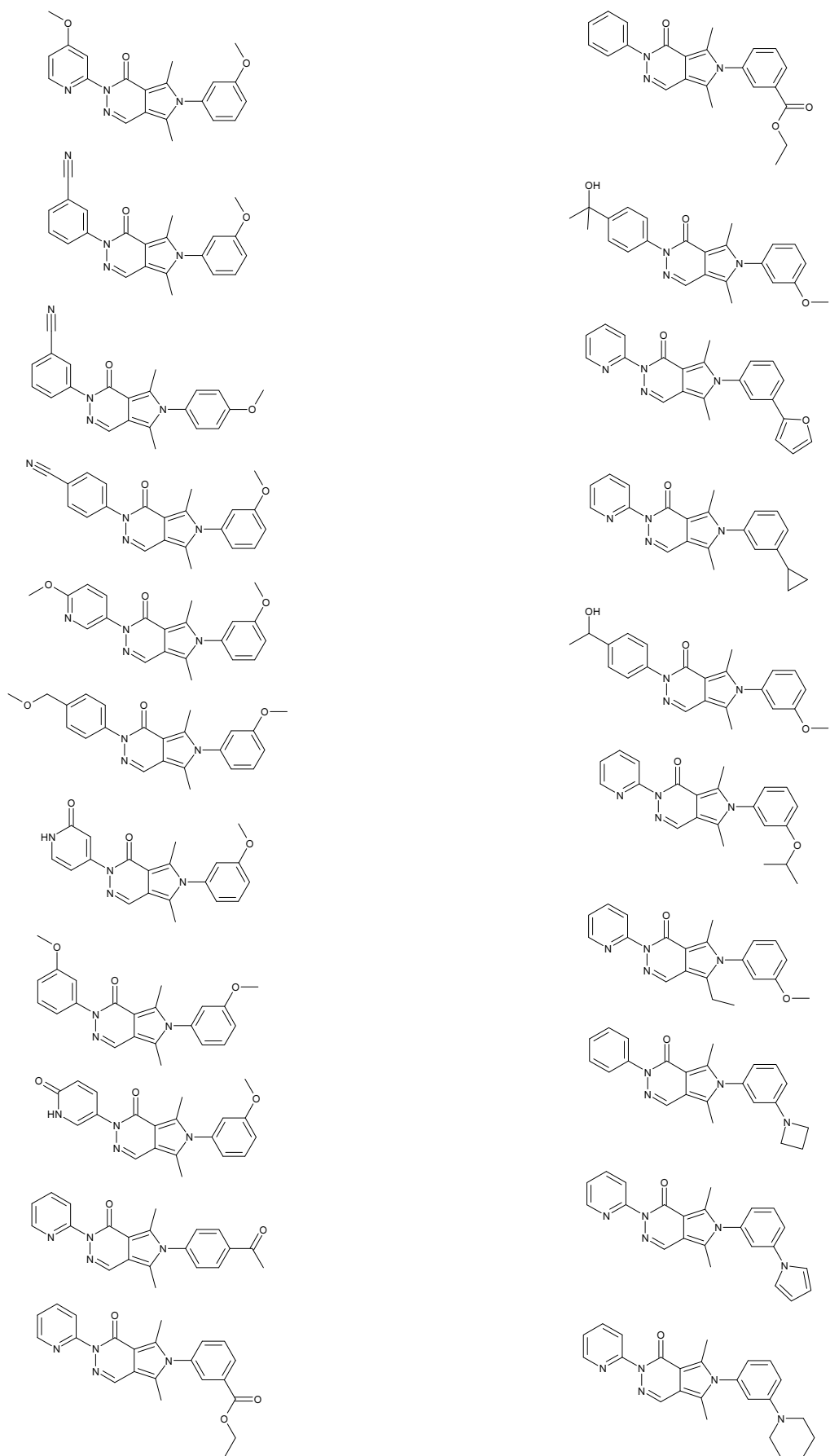


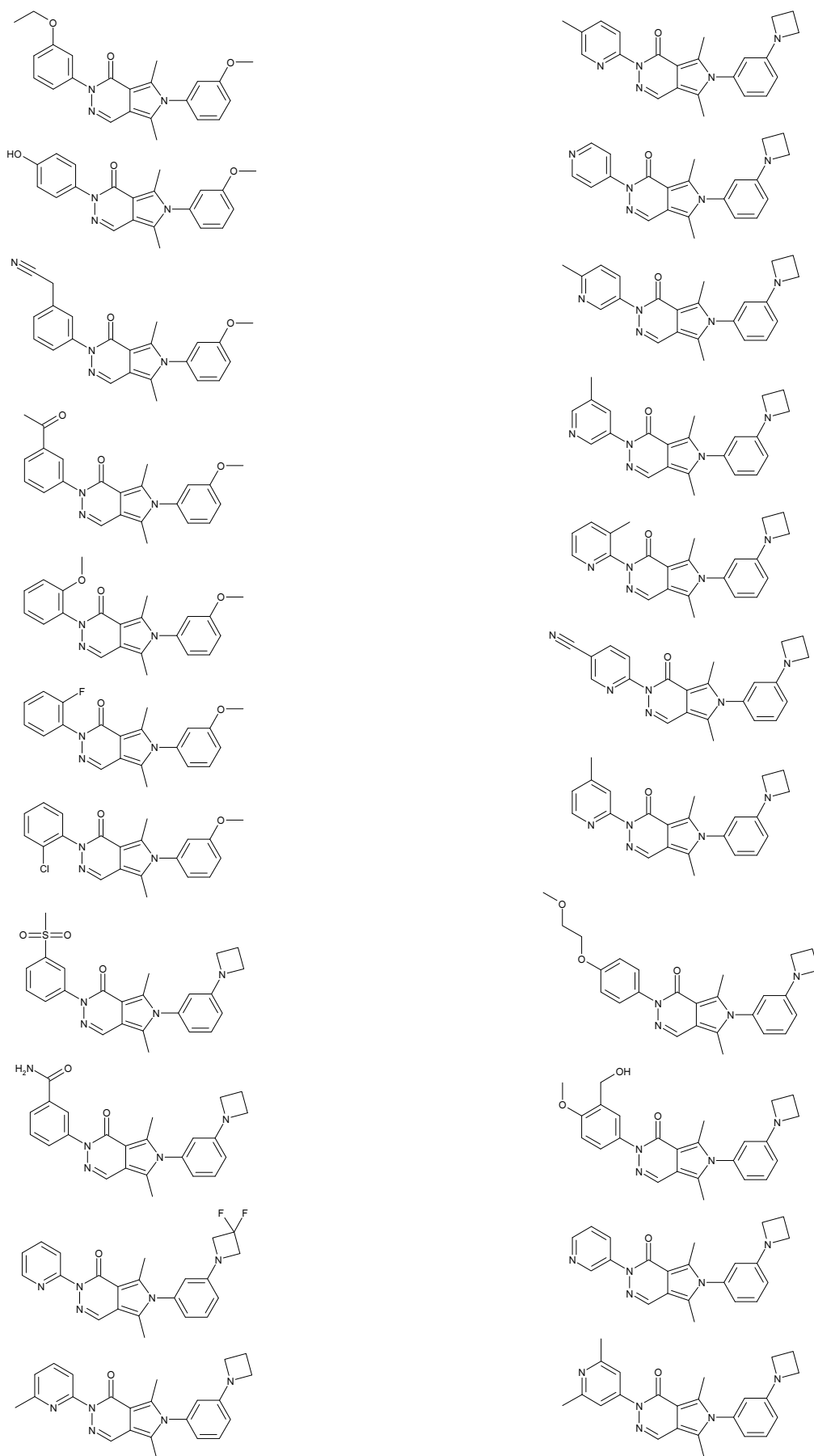


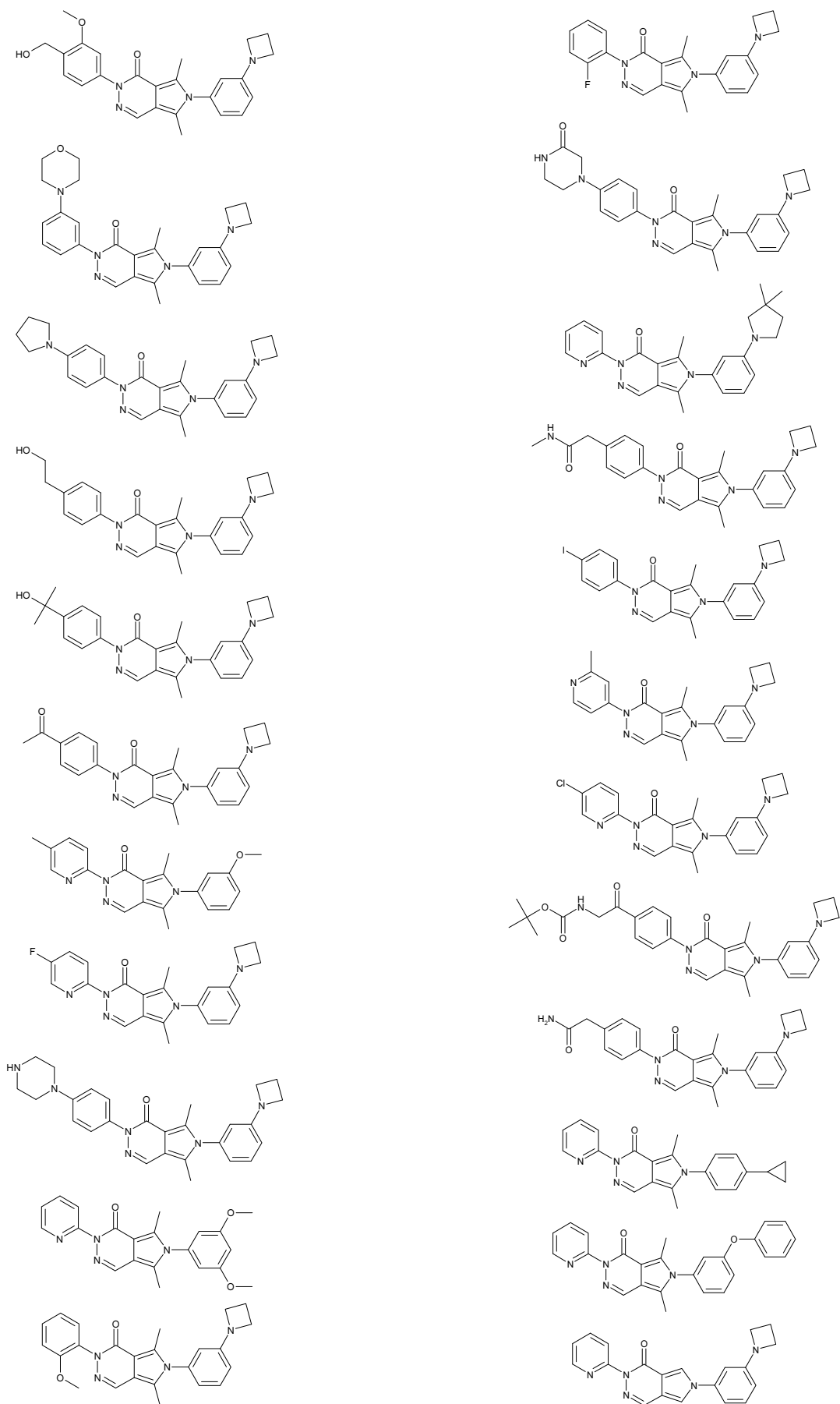


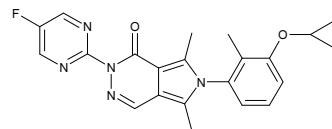
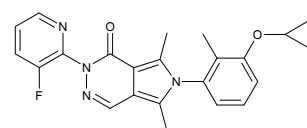
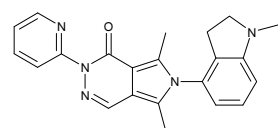
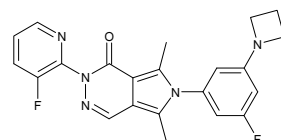
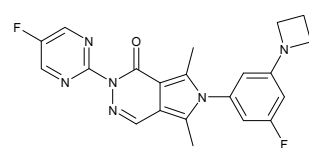
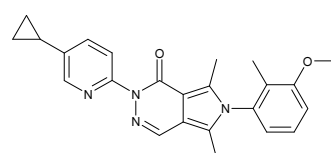
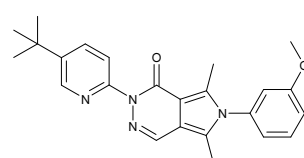
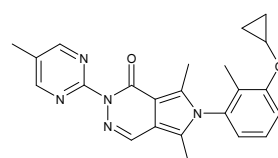
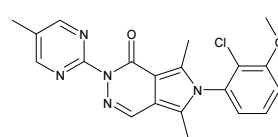
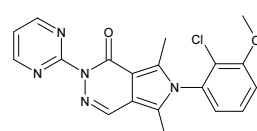
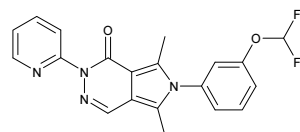
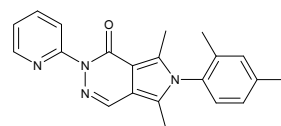
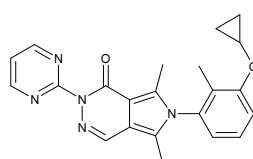
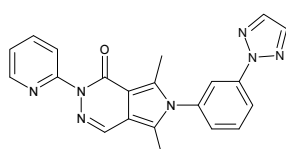
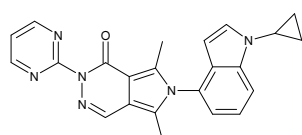
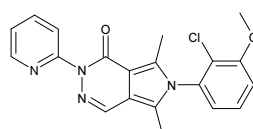
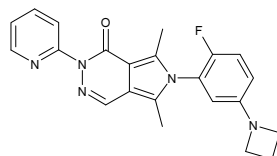
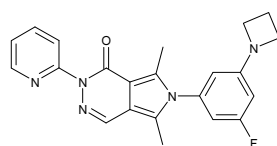
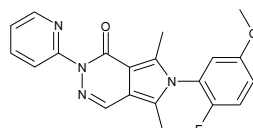
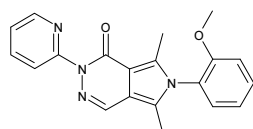
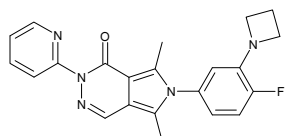
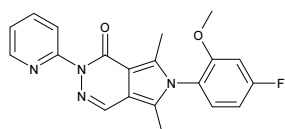
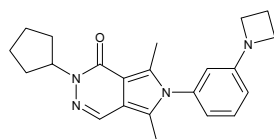
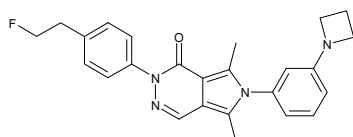


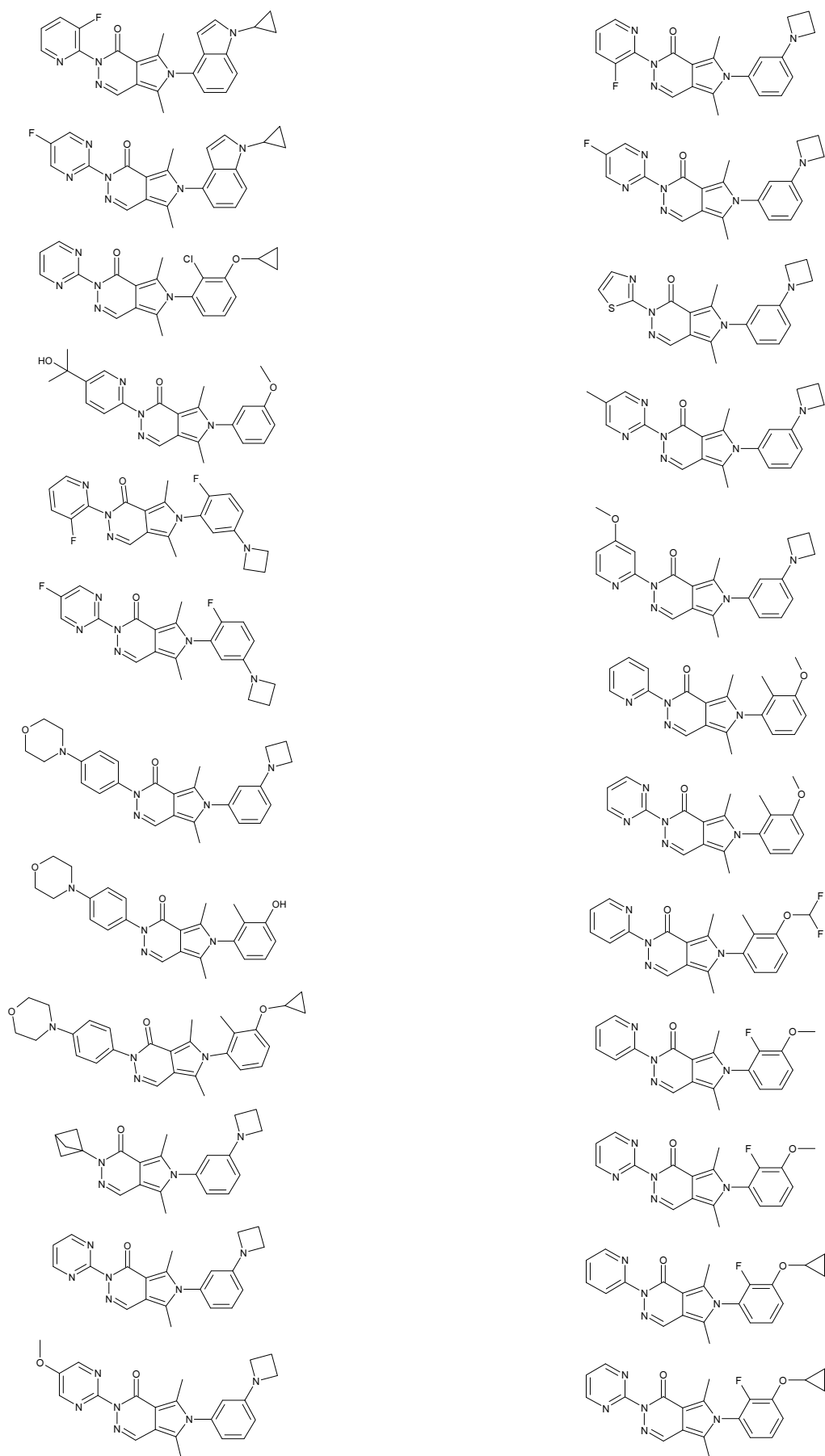


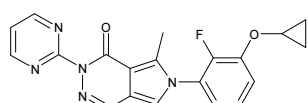
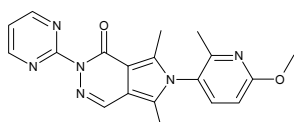
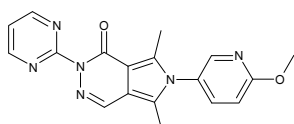
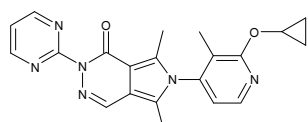
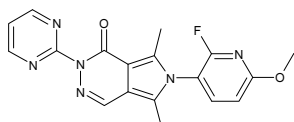
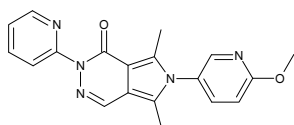
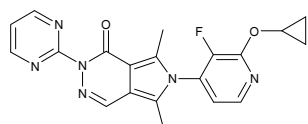






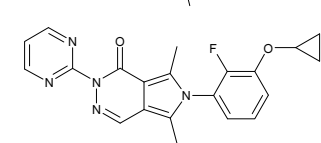
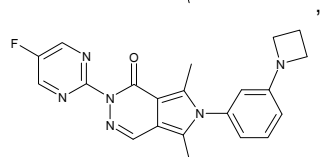
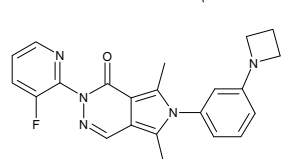
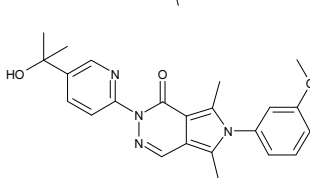
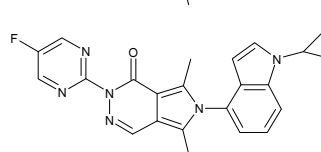
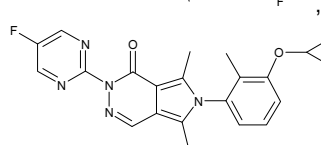
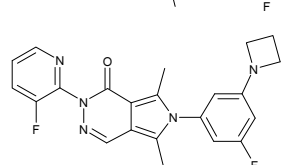
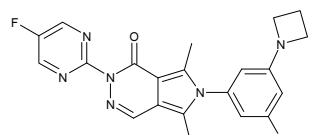
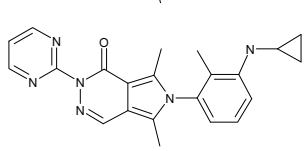
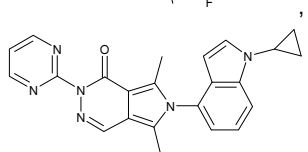
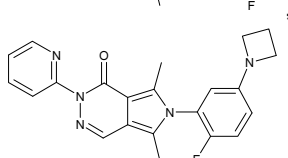
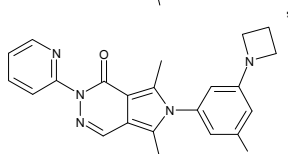
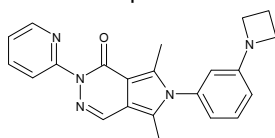






та їх фармацевтично прийнятну сіль приєднання кислоти або основи, їх стереохімічно ізомерну форму або її N-оксидну форму.

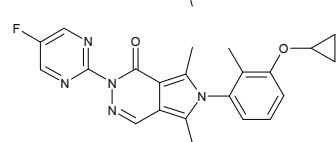
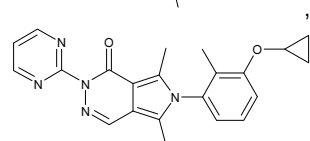
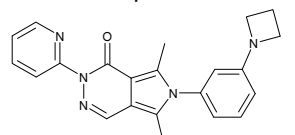
23. Сполука за п. 22, де вказана сполука являє собою одну або більше вибраних із



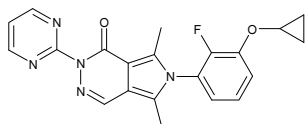
та

та їх фармацевтично прийнятну сіль приєднання кислоти або основи, їх стереохімічно ізомерну форму або її N-оксидну форму.

24. Сполука за п. 23, де вказана сполука являє собою одну або більше вибраних із



та



та їх фармацевтично прийнятну сіль приєднання кислоти або основи, їх стереохімічно ізомерну форму або її N-оксидну форму.

25. Фармацевтична композиція, що містить терапевтично ефективну кількість сполуки за будь-яким із пп. 1-24 та фармацевтично прийнятний носій та/або допоміжну речовину.

26. Спосіб лікування або попередження стану у ссавця, що включає введення ссавцю, який потребує такого лікування або попередження, ефективної кількості сполуки/композиції відповідно до пп. 1-25.

27. Спосіб за п. 26, де на лікування або попередження впливає модуляторний ефект алостеричного модулятора mGlu7, такого як негативний алостеричний модулятор mGlu7, або полегшує їх.

28. Спосіб лікування, попередження, полегшення, контролю або зниження ризику різних неврологічних і психіатричних порушень, асоційованих із дисфункцією глутамату у ссавця, що включає введення ссавцю, який потребує такого лікування або попередження, ефективної кількості сполуки/композиції за будь-яким із пп. 1-25.

29. Спосіб за п. 28, де на лікування або попередження впливає модуляторний ефект негативного алостеричного модулятора mGlu7, або полегшує їх.

30. Спосіб за будь-яким із п. 26 або п. 27, де стан являє собою одне або кілька з порушення центральної нервової системи, захворювання або порушення слуху, або больового порушення.

31. Спосіб за п. 30, де порушення центральної нервової системи являє собою тривожне порушення, такий як агорафобія, генералізований тривожне порушення (GAD), obsесивно-компульсивне порушення (OCD), панічне порушення або посттравматичний стресове порушення (PTSD).

32. Спосіб за п. 30, де захворювання та порушення слуху являє собою одне або кілька з ураження внутрішнього вуха, вікового порушення слуху (пресбікузис), хвороби Мен'єра, раптової втрати слуху, втрати слуху, викликані шумом, отиту середнього вуха, аутоімунного захворювання внутрішнього вуха, гострого тинітуса, хронічного тинітуса, втрати слуху, спричиненої прийманням лікарських засобів, прихованої втрати слуху, втрати слуху, спричиненої аміноглікозидами, ототоксичності, порушення центральної частини слухового аналізатора або вестибулярного порушення.

33. Спосіб за п. 30, де больове порушення являє собою одне або кілька з невропатичного болю, запального болю, вісцерального болю, гострого болю, хронічного болю, сильного болю, непереборного болю, посттравматичного болю, післяопераційного болю, головного болю або ракового болю.

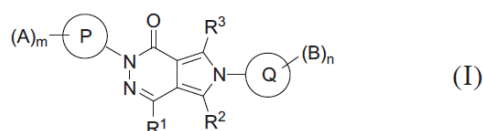
34. Сполука або композиція за будь-яким із пп. 1-25 для застосування як лікарського препарату.

35. Сполука або композиція за будь-яким із пп. 1-25 для застосування в способі лікування або попередження, як визначено в будь-якому з пп. 26, 27, 30, 31, 32 або 33.

36. Сполука або композиція за будь-яким із пп. 1-25 для застосування в способі, як визначено у п. 28 або п. 29.

37. Застосування сполуки за будь-яким із пп. 1-25 у виробництві лікарського препарату для лікування або попередження, як визначено в будь-якому з пп. 26, 27, 30, 31, 32 або 33.

38. Застосування сполуки за будь-яким із пп. 1-25 у виробництві лікарського препарату для лікування або попередження, як визначено у п. 28 або п. 29.



(21) а 2023 04291
(22) 14.04.2022

(51) МПК
C07D 493/14 (2006.01)
C07H 9/04 (2006.01)
C08G 63/42 (2006.01)

(31) 21169040.9

(32) 18.04.2021

(33) EP

(85) 25.10.2023

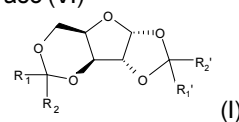
(86) РСТ/ЕР2022/060153, 14.04.2022

(71) ЕКОЛЬ ПОЛІТЕХНІК ФЕДЕРАЛ ДЕ ЛОЗАННЕ
(ЕПФЛ) (СН)

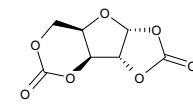
(72) Комарова Анастасія (СН), Лютербахер Джереми (СН)

(54) ЗЕЛЕНІ РОЗЧИННИКИ ДЛЯ ХІМІЧНИХ РЕАКЦІЙ

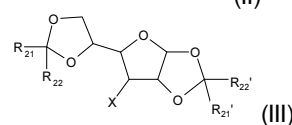
(57) 1. Застосування сполуки за загальною формулою (I), (II), (III) (VI), (V) або (VI)



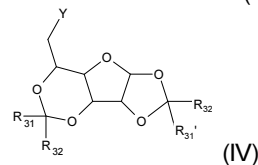
(I)



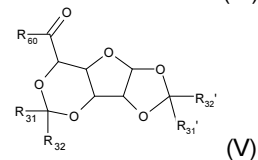
(II)



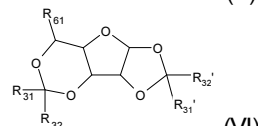
(III)



(IV)



(V)



(VI)

де R₁ і R₁', R₂₁ і R₂₁', R₃₁ і R₃₁' є однаковими й являють собою водень, лінійний або розгалужений від C-1 до

C₁₈ алкіл, лінійний або розгалужений від C₂ до C₁₈ алкеніл, лінійний або розгалужений від C₁ до C₁₀ алкокси, лінійний або розгалужений від C₁ до C₉ алканоліокси, лінійний або розгалужений від C₁ до C₉ алкоксикарбоніл, амінокарбоніл, гідроксикарбоніл, лінійний або розгалужений від C₁ до C₉ алкоксіалкіл, незаміщений циклоалкіл, лінійний або розгалужений від C₁ до C₆ алкіл заміщений циклоалкілом, переважно незаміщений циклогексил, незаміщений від C₆ до C₁₂ арил, лінійний або розгалужений від C₁ до C₄ алкіл заміщений від C₆ до C₁₂ арилом, або від C₇ до C₁₂ аралкіл,

R₂ і R₂' , R₂₂ і R₂₂' , R₃₂ і R₃₂' є однаковими й являють собою водень, лінійний або розгалужений від C₁ до C₁₈ алкіл, лінійний або розгалужений від C₁ до C₉ алкоксіалкіл, або

R₂ і R₂' утворюють разом з R₁ і R₁' відповідно, R₂₂ і R₂₂' утворюють разом з R₂₁ і R₂₁' відповідно, R₃₂ і R₃₂' утворюють разом з R₁ і R₁' відповідно, 5- або 6-членне ненасичене або насичене карбоциклічне кільце, що додатково містить 1 або 2 атоми кисню,

X вибраний з групи, що складається з водню, фтору, хлору, бром, йоду, алкоксикарбонілу, амінокарбонілу, гідроксикарбонілу, алканоліокси, лінійного або розгалуженого від C₁ до C₁₈ алкілу, від C₁ до C₁₈ алкенілу, лінійного або розгалуженого від C₂ до C₁₀ алкенілу, сульфонату та OR₅₀, де R₅₀ вибраний з групи, що складається з водню та лінійного або розгалуженого від C₁ до C₁₈ алкілу,

Y вибраний з групи, що складається з водню, фтору, хлору, бром, йоду, лінійного або розгалуженого від C₁ до C₁₈ алкілу, від C₁ до C₁₈ алкенілу, лінійного або розгалуженого від C₂ до C₁ алкенілу, сульфонату та O R₅₀, де R₅₀ вибраний з групи, що складається з водню, лінійного або розгалуженого від C₁ до C₁₈ алкілу, від C₁ до C₉ алканоліокси, від C₁ до C₉ алканоліокси і від C₁ до C₉ алкілкарбонілу, та R₆₀ вибраний з групи, що складається з водню, гідрокси і від C₁ до C₁₈ алкокси, і R₆₁ вибраний з групи, що складається з водню, гідрокси, від C₁ до C₁₀ алкілсульфонілу-C₁ до R₅ і від C₁ до C₁₈ алкілу в якості розчинника для хімічних реакцій, перекристалізації або екстракції.

2. Застосування сполук (I), (II), (III), (IV) за п. 1 в якості полярного апротонного 10 розчинника, де сполуки (I) і (II) є такими, як визначено у п. 1, а у сполуці (III) й у сполуці (IV) R₅₀ не являє собою водень.

3. Застосування сполук (III) та (IV) за п. 1 в якості полярного протонного розчинника, де у сполуках (III) і (IV) R₅₀ являє собою водень або сполуку (V).

4. Застосування за будь-яким із попередніх пунктів, де розчинник використовують для 15 проведення хімічних реакцій.

5. Застосування за будь-яким із попередніх пунктів, де хімічна реакція включає принаймні дві вихідні сполуки.

6. Застосування за будь-яким із попередніх пунктів, де розчинник використовують для хімічної реакції у присутності кислоти або лугу, переважно сильною кислоти або 20 сильною лугу.

7. Застосування за будь-яким із пп. 1-2 і 4-6, де кожний з R₂ і R₂' являє собою водень.

8. Застосування за будь-яким із пп. 1-2 і 4-7, де R₁ і R₁' являють собою водень або лінійний від C₁ до C₁₈ алкіл, лінійний від C₂ до C₁₈ алкеніл, лінійний від C₁ до C₁₈ алкокси, лінійний або розгалужений від C₁ до

C₉ алканоліокси, лінійний від C₁ до C₉ алкоксикарбоніл або лінійний від C₁ до C₉ алкоксіалкіл, бажано лінійний від C₁ до C₉ алкоксикарбоніл.

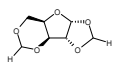
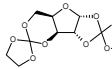
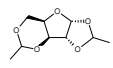
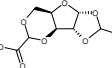
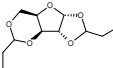
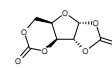
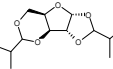
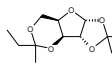
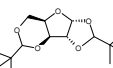
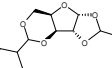
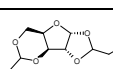
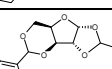
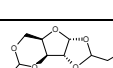
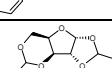
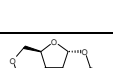
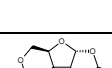
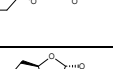
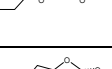
9. Застосування за будь-яким із пп. 1-2 і 4-7, де R₁ і R₁' являють собою розгалужений від C₁ до C₁₈ алкіл, розгалужений від C₁ до C₉ алкоксіалкіл, і де R₂ і R₂' є однаковими й обидва містять водень.

10. Застосування за будь-яким із пп. 1-2 і 4-9, де хімічна реакція вибрана з групи, що складається з реакції Хека, реакції алкілювання, реакції гідратування, реакції Ульмана або сполуки Ульмана, реакції Вюрца, реакції Гріньяра, реакції Гомберга-Бахмана, сполуки Кастро-Стівенса, синтезу Корі-Хауса, реакції Кассара, сполуки Кумаді, сполуки Соногашіра, сполуки Негіші, перехресної сполуки Стіллі, реакції Сузукі, сполуки Хіяма, реакції Бухвальда-Хартвіга, сполуки Фукуяма, сполуки Лібескінда-Срогла, твердофазного пептидного синтезу (SPPS), нуклеофільного заміщення, амідування, етерифікації, реакції Бігінеллі, карбонільного приєднання, приєднання аза-Майкла, деалкоксикарбонілювання Крапчо, перегрупування Бультона-Катрицького, приєднання Майкла та перегрупування Бекмана, і дегідрогалогенної сполуки.

11. Застосування за будь-яким із пп. 1-2 і 4-10, де хімічна реакція вибрана з групи, що складається з реакції Хека, реакції алкілювання, фракціонування біомаси за допомогою альдегідів і реакції гідратування.

12. Застосування за п. 3, де хімічна реакція вибрана з групи, що складається з відновлення 10 нітросполук, гідратування, галогенування, синтезу іонних рідин, нуклеофільного заміщення за механізмом SN1, реакції елімінування за механізмами E1 і E2, синтезу за механізмом SnAr, екстракції біологічно активних сполук й екстракції будь-яких сполук із біологічних джерел.

13. Застосування за будь-яким із попередніх пунктів, де сполуку за формулою (I), (II), (III), (IV), (V) або (VI) вибирають з групи, що складається з

| | | | |
|---|--|----|---|
| 1 |  | 13 |  |
| 2 |  | 14 |  |
| 3 |  | 15 |  |
| 4 |  | 16 |  |
| 5 |  | 17 |  |
| 6 |  | 18 |  |
| 7 |  | 19 |  |
| 8 |  | 20 |  |
| 9 |  | 21 |  |

| | | | |
|----|--|----|--|
| 10 | | 22 | |
| 11 | | 23 | |
| 12 | | 24 | |
| 25 | | 26 | |
| 27 | | 28 | |
| 29 | | 30 | |
| 31 | | 32 | |
| 33 | | 34 | |
| 35 | | 36 | |
| 37 | | 38 | |
| 39 | | 40 | |
| 41 | | 42 | |
| 43 | | 44 | |
| 45 | | 46 | |
| 47 | | 48 | |
| 49 | | 50 | |
| 51 | | 52 | |
| 53 | | 54 | |
| 55 | | 56 | |
| 57 | | 58 | |
| 59 | | 60 | |
| 61 | | 62 | |

| | | | |
|----|--|----|--|
| 63 | | 64 | |
| 65 | | 66 | |
| 67 | | 68 | |
| 69 | | 70 | |
| 71 | | 72 | |
| 73 | | 74 | |
| 75 | | 76 | |
| 77 | | 78 | |
| 79 | | 80 | |
| 81 | | 82 | |

14. Застосування за будь-яким із попередніх пунктів, де сполука загальної формули (I), (II) (III), (IV), (V) і (VI) застосовують

- в якості розчинника у ферментативних реакціях, зокрема для поліконденсації при синтезі поліефірів, або

- в якості щонайменше одного з компонентів електродів акумуляторів,

- для синтезу металоорганічних, с каркасів (MOF),

- для підготовки електродів,

- в якості розчинника для рідиннофазного пілінгу, зокрема, в якості заміни NMP при рідинному пілінгу частинок MoS₂,

- розчинник для зберігання,

- розчинник для попередньої обробки біомаси та переробки біомаси, зокрема для; фракціонування біомаси за допомогою альдегідів,

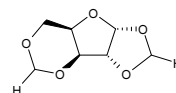
- для твердофазного синтезу пептидів, зокрема в якості заміни N,N-диметилацетаміду (DMAc) у твердофазному пептидному синтезі,

- для підготовки мембран для мікрофільтрації,

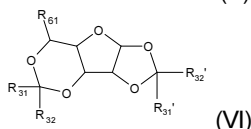
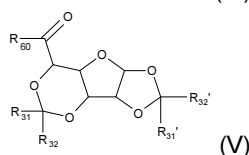
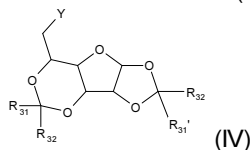
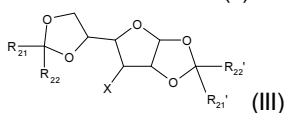
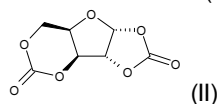
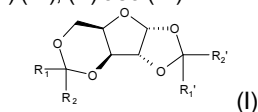
- компонент глибоких евтектичних розчинників.

15. Застосування за будь-яким із пп. 1-2 і 4-14, де сполуки за загальною формулою (I) або (II) використовують в якості заміни N-метилпіролідинону, N,N-диметилацетаміду (DMAc) або N,N-диметилформаміду (DMF), 1,3-диметил-2-імідазолідинону (DMI) для хімічної реакції, зокрема, для органічного синтезу.

16. Застосування за будь-яким із попередніх пунктів, де сполука являє собою диформілксилозу (DFX)



17. Спосіб одержання сполуки за загальною формулою (I), (II), (III) (VI), (V) або (VI)



де R_1 і R_1' , R_{21} і R_{21}' , R_{31} і R_{31}' є однаковими й являють собою водень, лінійний або розгалужений від C_1 до C_{18} алкіл, лінійний або розгалужений від C_2 до C_{18} алкеніл, лінійний або розгалужений від C_1 до C_{10} алкокси, лінійний або розгалужений від C_1 до C_9 алканойлокси, лінійний або розгалужений від C_1 до C_9 алкоксикарбоніл, амінокарбоніл, гідроксикарбоніл, лінійний або розгалужений від C_1 до C_9 алкоксіалкіл, незаміщений циклоалкіл, лінійний або розгалужений від C_1 до C_6 алкіл заміщений циклоалкілом, переважно незаміщений циклогексил, незаміщений від C_6 до C_{12} арил, лінійний або розгалужений від C_1 до C_4 алкіл заміщений від C_6 до C_{12} арилом, або від C_7 до C_{12} аралкіл,

R_2 і R_2' , R_{22} і R_{22}' , R_{32} і R_{32}' є однаковими й являють собою водень, лінійний або розгалужений від C_1 до C_{18} алкіл, лінійний або розгалужений від C_1 до C_9 алкоксіалкіл, або R_2 і R_2' утворюють разом з R_1 і R_1' відповідно, R_{22} і R_{22}' утворюють разом з R_{21} і R_{21}' відповідно, R_{32} і R_{32}' утворюють разом з R_1 і R_1' відповідно, 5- або 6-членне ненасичене або насичене карбоциклічне кільце, яке необов'язково включає 1 або 2 атоми кисню,

X вибраний з групи, що складається з водню, фтору, хлору, бром, йоду, алканойлокси, алкоксикарбонілу, амінокарбонілу, гідроксикарбонілу, лінійного або розгалуженого від C_1 до C_{18} алкілу, від C_1 до C_{18} алкенілу, лінійного або розгалуженого від C_2 до C_{10} алкенілу, сульфонату та OR_{50} , де R_{50} вибраний з групи, що складається з водню, лінійного або розгалуженого від C_1 до C_{18} алкілу,

Y вибраний з групи, що складається з водню, фтору, хлору, бром, йоду, лінійного або розгалуженого від C_1 до C_{18} алкілу, від C_1 до C_{18} алкенілу, лінійного або розгалуженого від C_2 до C_{10} алкенілу, сульфонату та OR_{50} , де R_{50} вибраний з групи, що складається з во-

дню, лінійного або розгалуженого від C_1 до C_{18} алкілу та лінійного або розгалуженого від C_1 до C_9 алкілкарбонілу,

R_{60} вибраний з групи, що складається з водню, гідрокси і від C_1 до C_{18} алкокси, і

R_{61} вибраний з групи, що складається з водню, гідрокси, від C_1 до C_{10} алкілсульфоніл- C_1 до C_5 і від C_1 до C_{18} алкілу,

який включає стадію реакції

реагування D-ксилози або D-глюкози з

альдегідом за загальною формулою (XXX) $R_{11}CHO$,

(XXXI) $R_{21}CHO$ або (XXXII) $R_{31}CHO$, або

кетонном за загальною формулою (XXIII) $R_{11}COR_{12}$,

(XXIV) $R_{21}COR_{22}$ або (XXV) $R_{31}COR_{32}$, або

циклічним або лінійним карбонатом

причому R_{11} , R_{12} , R_{21} , R_{22} , R_{31} і R_{32} мають таке саме визначення, як наведено вище, у присутності H_2SO_4 з використанням 2-метилтетрагідрофурану (2-МТГФ) в якості розчинника.

18. Спосіб за п. 17, де альдегід являє собою парамформальдегід.

19. Спосіб за п. 17 або 18, який включає стадії

а) отримання композиції, що містить D-ксилозу або D-глюкозу, альдегід і 2-метилтетрагідрофуран (2-МТГФ),

б) додавання H_2SO_4 до суміші, отриманої на стадії а)

с) нагрівання композиції, отриманої на стадії б), переважно до температури від 60 до 120 °C.

20. Спосіб за щонайменше одним із пп. 17-19, який включає стадії

д) екстрагування сполуки за загальною формулою (I), (II), (III) (VI), (V) або (VI) з використанням щонайменше одного екстракційного розчинника та

е) дистиляцію продукту з екстрагованого органічного залишку,

де екстракційний розчинник являє собою етилацетат або цикlopентиловий метиловий ефір (CPME).

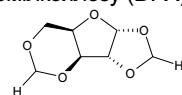
21. Спосіб за щонайменше одним із пп. 17-20, де сполуку вибирають з групи, що складається з

| | | | |
|---|--|----|--|
| 1 | | 13 | |
| 2 | | 14 | |
| 3 | | 15 | |
| 4 | | 16 | |
| 5 | | 17 | |
| 6 | | 18 | |
| 7 | | 19 | |
| 8 | | 20 | |

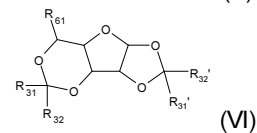
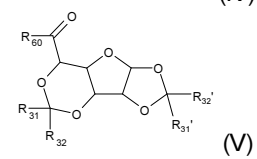
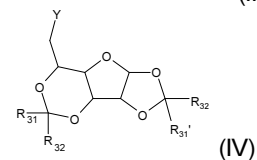
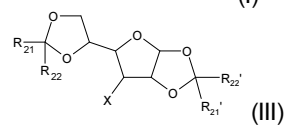
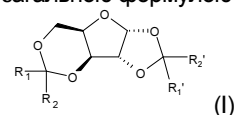
| | | | |
|----|--|----|--|
| 9 | | 21 | |
| 10 | | 22 | |
| 11 | | 23 | |
| 12 | | 24 | |
| 25 | | 26 | |
| 27 | | 28 | |
| 29 | | 30 | |
| 31 | | 32 | |
| 33 | | 34 | |
| 35 | | 36 | |
| 37 | | 38 | |
| 39 | | 40 | |
| 41 | | 42 | |
| 43 | | 44 | |
| 45 | | 46 | |
| 47 | | 48 | |
| 49 | | 50 | |
| 51 | | 52 | |
| 53 | | 54 | |
| 55 | | 56 | |
| 57 | | 58 | |
| 59 | | 60 | |
| 61 | | 62 | |

| | | | |
|----|--|----|--|
| 63 | | 64 | |
| 65 | | 66 | |
| 67 | | 68 | |
| 69 | | 70 | |
| 71 | | 72 | |
| 73 | | 74 | |
| 75 | | 76 | |
| 77 | | 78 | |
| 79 | | 80 | |
| 81 | | 82 | |

22. Спосіб за будь-яким із пп. 17-21, де сполука являє собою диформілілсилозу (DFX)



23. Сполука за загальною формулою (I), (III) або (VI)



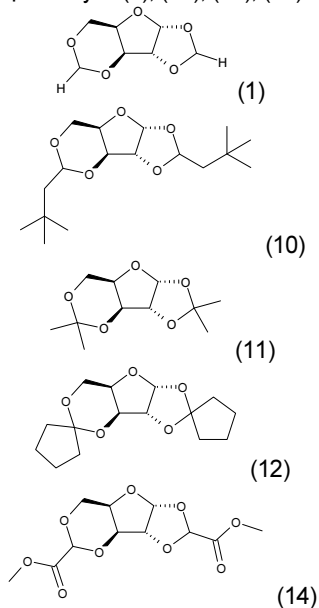
де R_1 і R_1' , R_{21} і R_{21}' , R_{31} і R_{31}' є однаковими й являють собою лінійний або розгалужений від C_1 до C_{18} алкіл, лінійний або розгалужений від C_2 до C_{18} алкеніл, лінійний або розгалужений від C_1 до C_{10} алкокси, лінійний або розгалужений від C_1 до C_9 алкоксикарбоніл, амінокарбоніл, гідроксикарбоніл, лінійний або розгалужений від C_1 до C_9 алкоксіалкіл, незаміщений циклоалкіл, лінійний або розгалужений від C_1 до C_6 алкіл заміщений циклоалкілом, переважно незаміщений циклогексил, незаміщений від C_6 до C_{12} арил, лінійний або розгалужений від C_1 до C_4 алкіл заміщений від C_6 до C_{12} арилом, або від C_7 до C_{12} аралкіл, R_2 і R_2' , R_{22} і R_{22}' , R_{32} і R_{32}' є однаковими й являють собою водень, лінійний або розгалужений від C_1 до C_{18} алкіл, лінійний або розгалужений від C_1 до C_9 алкоксіалкіл, або R_2 і R_2' утворюють разом з R_1 і R_1' відповідно, R_{22} і R_{22}' утворюють разом з R_{21} і R_{21}' відповідно, R_{32} і R_{32}' утворюють разом з R_1 і R_1' відповідно, 5- або 6- членне ненасичене або насичене карбоциклічне кільце, яке необов'язково включає 1 або 2 атоми кисню,

X вибраний з групи, що складається з водню, фтору, хлору, бром, йоду, алкоксикарбонілу, амінокарбонілу, гідроксикарбонілу, лінійного або розгалуженого від C_1 до C_{18} алкілу, від C_1 до C_{18} алкенілу, лінійного або розгалуженого від C_2 до C_{10} алкенілу, сульфонату та OR_{50} , де R_{50} вибраний з групи, що складається з водню, лінійного або розгалуженого від C_1 до C_{18} алкілу та лінійного або розгалуженого від C_1 до C_9 алкілкарбонілу, та

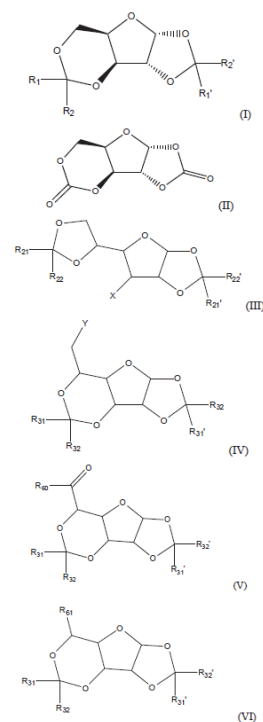
Y вибраний з групи, що складається з водню, фтору, хлору, бром, йоду, лінійного або розгалуженого від C_1 до C_{18} алкілу, від C_1 до C_{18} алкенілу, лінійного або розгалуженого від C_2 до C_{10} алкенілу, сульфонату та OR_{50} , де R_{50} являє собою водень, лінійний або розгалужений від C_1 до C_{18} алкіл і лінійний або розгалужений від C_1 до C_9 алкілкарбоніл,

R_{60} вибраний з групи, що складається з водню, гідрокси і від C_1 до C_{18} алкокси, і

R_{61} вибраний з групи, що складається з водню, гідрокси, від C_1 до C_{10} алкілсульфонілу, від C_1 до C_5 , алкілсульфонілаленілу та від C_1 до C_{18} алкілу із застереженням, що сполуки (1), (10), (11), (12) і (14)



виключені.



C 08

(21) а 2023 05897

(22) 26.05.2021

(51) МПК (2024.01)

C08G 12/12 (2006.01)

B32B 21/00

C08G 12/40 (2006.01)

C09J 161/24 (2006.01)

C09J 161/30 (2006.01)

(85) 22.12.2023

(86) РСТ/ЕР2021/064092, 26.05.2021

(71) ЛІГНУМ ТЕКНОЛОДЖІЗ АГ (СН)

(72) Дункі Манфред (АТ), Олачеа Луйс Мігель (СН), Майер Інг'о (СН), Фрей Рето (СН)

(54) МОДИФІКОВАНА АМІНОПЛАСТИЧНА КЛЕЙКА СМОЛА, СПОСІБ ЇЇ ПРИГОТУВАННЯ ТА КОМПОЗИТНІ МАТЕРІАЛИ, ВИГОТОВЛЕНІ З ВИКОРИСТАННЯМ ЦІЄЇ МОДИФІКОВАНОЇ АМІНОПЛАСТИЧНОЇ КЛЕЙКОЇ СМОЛИ

(57) 1. Термоотверджувана смола, отримана шляхом (полі)конденсації принаймні однієї хімічної речовини, що утворює амінопласт, з 5-гідроксиметилфурфуралом (5-HMF), його олігомерами та/або ізомерами та щонайменше однією другою (полі)конденсовуваною хімічною речовиною в умовах реакції, при яких зазначена щонайменше одна хімічна речовина, що утворює амінопласт, 5-гідроксиметилфурфурал (5-HMF), його олігомери та/або ізомери та щонайменше одна друга (полі)конденсовувана хімічна речовина (полі)конденсуються до термоотверджуваної смоли.

2. Смола за п. 1, яка відрізняється тим, що щонайменше одна друга (полі)конденсовувана хімічна речовина є щонайменше одним альдегідом, відмінним від 5-гідроксиметилфурфуралу, його олігомерів або ізомерів.

3. Смола за одним з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що щонайменше одна друга (полі)конденсовувана хімічна речовина є гліюксалем.

4. Смола за будь-яким з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що щонайменше одну хімічну речовину, що утворює амінопласт, вибирають з групи, що складається з сечовини, меламіну, заміщеного меламіну, заміщеної сечовини, ацетилендісечовини, гуанідину, тіосечовини, похідних тіосечовини, діаміноалкану або діамідоалкану або їх сумішей.

5. Смола за будь-яким з попередніх пунктів, яка **відрізняється** тим, що при (полі)конденсації молярне співвідношення (a:b:c) (a) сукупності щонайменше однієї хімічної речовини, що утворює амінопласт до (b) сукупності 5-гідроксиметилфурфуралу (5-HMF), його олігомерів та/або його ізомерів до (c) сукупності щонайменше однієї другої (полі)конденсовуваної хімічної речовини адаптована до 1:0,1 до 1,0:0,05 до 0,5, переважно 1:0,2 до 0,4:0,1 до 0,3, особливо переважно 1:0,3 до 0,4:0,15 до 0,25.

6. Смола за будь-яким з попередніх пунктів, яка **відрізняється** вмістом твердої речовини 60-85 мас. %, переважно 65-80 мас. %, причому всі вмісти твердої речовини визначені шляхом випаровування вмісту води в реакційному розчині після його приготування під вакуумом, поки не буде досягнута постійна маса.

7. Смола за будь-яким з попередніх пунктів, яка **відрізняється** в'язкістю 150-1000 мПа*с, переважно 200-600 мПа*с, особливо переважно 200-400 мПа*с, причому усі в'язкості вимірені застосовуючи ротаційний віскозиметр при 20 °C відповідно до інструкцій ISO 3219:1994 (ISO 3219:1994).

8. Спосіб виробництва термоотверджуваної смоли шляхом (полі)конденсації щонайменше однієї хімічної речовини, що утворює амінопласт, з 5-гідроксиметилфурфуралом (5-HMF), його олігомерами та/або ізомерами, та щонайменше однією другою (полі)конденсовуваною хімічною речовиною в умовах реакції, за яких зазначену щонайменше одну хімічну речовину, що утворює амінопласт, 5-гідроксиметилфурфурал (5-HMF), його олігомери та/або ізомери та щонайменше одну другу (полі)конденсовувану хімічну речовину (полі)конденсують до термоотверджуваної смоли.

9. Спосіб за п. 8, який **відрізняється** тим, що (полі)конденсацію проводять при температурах в діапазоні від 10 до 90 °C, переважно в діапазоні від 20 до 60 °C, особливо переважно в діапазоні від 20 °C. до 50 °C.

10. Спосіб за п. 8 або 9, який **відрізняється** тим, що (полі)конденсацію проводять у розчині, доки розчин не досягне заданої в'язкості, або поки реакція не завершиться.

11. Спосіб виробництва композиційних матеріалів, що включає наступні операції:

забезпечення термоотверджуваної смоли згідно з одним із пунктів 1-5,

приведення в контакт термоотверджуваної смоли з матеріалом, що містить лігноцелюлозу або нелігноцелюлозу, або їх суміш,

приготування отверджуваної маси, і
твердіння отверджуваної маси при формуванні композиційного матеріалу, причому зазначене твердіння здійснюється за допомогою підвищеної температури і тиску.

12. Спосіб за п. 11, який **відрізняється** тим, що матеріали, що містять лігноцелюлозу, або матеріали, що

містять нелігноцелюлозу, вибирають з групи, що складається з деревної щепи, деревних волокон, рослинних волокон, деревних стружок, деревних крупномірних стружок, деревних частинок, деревних смужок, суміші різних лігноцелюлозних матеріалів, неорганічних волокон, нарізки неорганічних волокнистих килимів та їх сумішей.

13. Спосіб за п. 11 або 12, який **відрізняється** тим, що матеріал, що містить лігноцелюлозу або містить нелігноцелюлозу, змішують із кількістю від 2 % за вагою до 20 % за вагою, переважно з кількістю від 5 % за вагою до 15 % за вагою термоотверджуваної смоли в розрахунку на вагу сухого матеріалу, що містить лігноцелюлозу, або матеріалу, що містить нелігноцелюлозу.

14. Спосіб за одним із пп.11-13, який **відрізняється** тим, що операцію приготування отверджувальної маси здійснюють у пресі, пресі з плоскими плитами, пресі безперервної дії або формувальному пресі.

15. Спосіб за одним з пп.11-14, який **відрізняється** тим, що твердіння смоли здійснюють у пресі при температурі від 160 до 250 °C.

16. Композитний матеріал, отриманий способом за одним з пп. 11-15, переважно композитні плити на основі деревних або неорганічних матеріалів, зокрема у формі деревностружкових плит, деревноволокнистих плит, панелей з OSB, панелей з HDF або MDF, фанери та/або столярних плит, для таких застосувань, як, наприклад, панелі для підлоги, стін або стелі.

C 12

(21) а 2023 05914

(22) 25.05.2022

(51) МПК (2024.01)

C12M 1/00

C12M 1/40 (2006.01)

C12M 1/36 (2006.01)

(31) 10 2021 113 678.4

(32) 27.05.2021

(33) DE

(85) 07.12.2023

(86) PCT/EP2022/064189, 25.05.2022

(71) ЕЛЕКТРОХАЕА ГМБХ (DE)

(72) Хафенбрадль Доріс (DE), Кочіанчіч Маттео (DE)

(54) РЕАКТОРНА УСТАНОВКА ТА СПОСІБ КЕРУВАННЯ ПРОДУКТИВНІСТЮ

(57) 1. Реакторна установка, яка містить два або більше реакторів, з'єднаних паралельно один з одним, причому два або більше реакторів містять чутливий до навантаження каталізатор;

причому кожен реактор має оптимальну навантажувальну здатність, де сума оптимальних навантажувальних здатностей двох або більше реакторів відповідає оптимальній навантажувальній здатності реакторної установки;

причому реакторна установка виконана для роботи з робочим навантаженням, причому робоче навантаження реакторної установки є оптимальною навантажувальною здатністю установки або зниженням робочим навантаженням;

і причому кожен реактор виконаний з можливістю роботи з робочим навантаженням, причому сумар-

не робоче навантаження двох або більше реакторів дорівнює робочому навантаженню реакторної установки,

яка **відрізняється** тим, що

під час роботи реакторної установки зі зниженим робочим навантаженням

два або більше реакторів виконані з можливістю періодичного перерозподілу своїх відповідних робочих навантажень залежно від метаболічних характеристик каталізатора,

причому навантаження охоплює енергію та субстрат(и) разом і/або окремо, необхідні для підтримання та протікання реакції каталізатора.

2. Установка за п. 1, в якій оптимальна навантажувальна здатність установки рівномірно розподілена між двома або більше реакторами.

3. Установка за будь-яким із попередніх пунктів, в якій два або більше реакторів є комірками реактора в головному реакторі.

4. Установка за будь-яким із попередніх пунктів, в якій перерозподіл навантажень базується на вхідних параметрах, отриманих через датчики навколишнього середовища ззовні та/або всередині установки, при цьому датчики навколишнього середовища вимірюють параметри навколишнього середовища, від яких залежить майбутнє робоче навантаження установки.

5. Установка за будь-яким із попередніх пунктів, яка додатково містить блок управління та регулювання, виконаний з можливістю отримання сукупності даних щодо мінімального передбачуваного навантаження та/або інших даних про навколишнє середовище і для управління робочим навантаженням двох або більше реакторів та графіком їх перерозподілу.

6. Установка за будь-яким із пп. 2-5, в якій, якщо знижене робоче навантаження установки налаштовано таким чином, що воно щонайменше дорівнює або перевищує оптимальну навантажувальну здатність кожного реактора, два або більше реакторів виконані таким чином, щоб мати робоче навантаження, як показано нижче:

при $i = \text{OLR}_1 = \text{OLC}_r$ (1)

і при $i > 1$

$$\text{OLR}_i = \begin{cases} \text{OLC}_r & \text{якщо } \left(\text{OL}_{\text{зменшене}} - \sum_{i=1}^{i-1} \text{OLR}_i \right) > \text{OLC}_r \\ 0 & \text{якщо } \left(\text{OL}_{\text{зменшене}} - \sum_{i=1}^{i-1} \text{OLR}_i \right) = 0 \\ \text{OL}_{\text{зменшене}} \bmod (\text{OLC}_r) & \text{інакше} \end{cases} \quad (2),$$

де

N - кількість реакторів у реакторній установці;

$i = \{1, 2, \dots, N\}$ - індекс;

OLR_i - робоче навантаження i -го реактора;

$\text{OL}_{\text{зменшене}}$ - зменшене робоче навантаження реакторної установки; i

OLC_r - оптимальна навантажувальна здатність кожного реактора.

7. Установка за будь-яким із попередніх пунктів, в якій періодичний перерозподіл одного або більше реакторів описаний наступним чином:

$$\begin{pmatrix} \text{OLR}_1 & \text{OLR}_2 & \text{OLR}_3 & \dots & \text{OLR}_N \\ \text{OLR}_N & \text{OLR}_1 & \text{OLR}_2 & \dots & \text{OLR}_{N-1} \\ \text{OLR}_{N-1} & \text{OLR}_N & \text{OLR}_1 & \text{OLR}_2 & \dots \\ \vdots & \vdots & \vdots & \ddots & \vdots \\ \text{OLR}_2 & \text{OLR}_3 & \dots & \text{OLR}_{N-1} & \text{OLR}_1 \end{pmatrix},$$

де кожен стовпець відповідає одному реактору, а кожен рядок представляє розподіл робочого навантаження в різні часові інтервали.

8. Спосіб регулювання роботи двох або більше реакторів, що входять до складу реакторної установки за будь-яким із пунктів 1-7, протягом періоду експлуатації при зниженому робочому навантаженні установки, причому спосіб включає наступні етапи:

а) встановлення зниженого робочого навантаження для реакторної установки;

б) експлуатація реакторної установки на визначеному зниженому робочому навантаженні шляхом експлуатації двох або більше реакторів з відповідним робочим навантаженням таким чином, щоб сума робочого навантаження двох або більше реакторів дорівнювала зниженому робочому навантаженню, встановленому на етапі а); та

с) безперервний перерозподіл робочого навантаження двох або більше реакторів протягом періодично повторюваних часових інтервалів, причому часові інтервали відповідають визначеному і адаптованому графіку перерозподілу в залежності від метаболічних характеристик каталізатора, що використовується в двох або більше реакторах.

9. Спосіб за п. 8, в якому етап б) включає експлуатацію, необов'язково, щонайменше одного реактора при його оптимальній навантажувальній здатності.

10. Спосіб за будь-яким із пп. 8-9, в якому експлуатація двох або більше реакторів з відповідним робочим навантаженням включає встановлення робочого навантаження двох або більше реакторів наступним чином:

при $i = 1$

$\text{OLR}_1 = \text{OLC}_r$ (1)

і при $i > 1$

$$\text{OLR}_i = \begin{cases} \text{OLC}_r & \text{якщо } \left(\text{OL}_{\text{зменшене}} - \sum_{i=1}^{i-1} \text{OLR}_i \right) > \text{OLC}_r \\ 0 & \text{якщо } \left(\text{OL}_{\text{зменшене}} - \sum_{i=1}^{i-1} \text{OLR}_i \right) = 0 \\ \text{OL}_{\text{зменшене}} \bmod (\text{OLC}_r) & \text{інакше} \end{cases} \quad (2),$$

де

N - кількість реакторів у реакторній установці;

$i = \{1, 2, \dots, N\}$ - індекс;

OLR_i - робоче навантаження i -го реактора;

$\text{OL}_{\text{зменшене}}$ - зменшене робоче навантаження реакторної установки; i

OLC_r - оптимальна навантажувальна здатність кожного реактора.

11. Виконуваний за допомогою комп'ютера спосіб регулювання робочого навантаження енергетичної установки, яка містить два або більше паралельно з'єднаних реакторів, кожен з яких містить чутливий до навантаження каталізатор:

причому реакторна установка має оптимальну навантажувальну здатність, що дорівнює сумі оптимальних навантажувальних здатностей двох або більше реакторів,

причому спосіб включає наступні етапи:

а) визначення зменшеного робочого навантаження для установки на заданий період на основі набору даних про навколишнє середовище, отриманих за допомогою одного або більше датчиків навколишнього середовища, розташованих всередині та/або зовні установки;

- b) визначення розподілу робочого навантаження двох або більше реакторів установки на основі зниженого робочого навантаження для установки;
- c) експлуатацію двох або більше реакторів відповідно до розподілу робочого навантаження; і
- d) періодичний перерозподіл робочого навантаження двох або більше реакторів на основі команди перерозподілу.

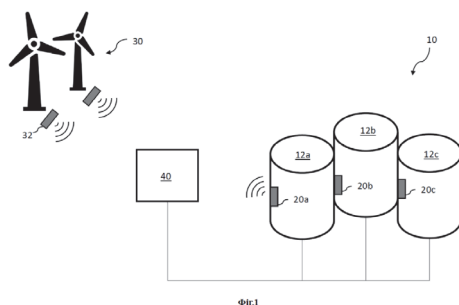
12. Виконуваний за допомогою комп'ютера спосіб за п. 11, який включає після етапу c) наступні етапи:

c1) безперервний моніторинг параметрів каталізатора в реакторах за допомогою вхідних даних, отриманих за допомогою вимірювань; і

c2) генерування команди перерозподілу, коли каталізатор щонайменше в одному реакторі наближається до адаптації до низького навантаження, на основі параметрів каталізатора.

13. Комп'ютерна програма, що містить інструкції, які, коли програма виконується комп'ютером, змушують комп'ютер виконувати спосіб за п. 11 або 12.

14. Машинозчитуваний носій, що містить інструкції, які при виконанні комп'ютером змушують комп'ютер виконувати спосіб за п. 11 або 12.



(21) а 2023 05449

(22) 27.05.2022

(51) МПК

C12N 15/113 (2010.01)

A61K 31/713 (2006.01)

(31) 63/194,395

(32) 28.05.2021

(33) US

(31) 21183860.2

(32) 06.07.2021

(33) EP

(85) 12.12.2023

(86) РСТ/EP2022/064408, 27.05.2022

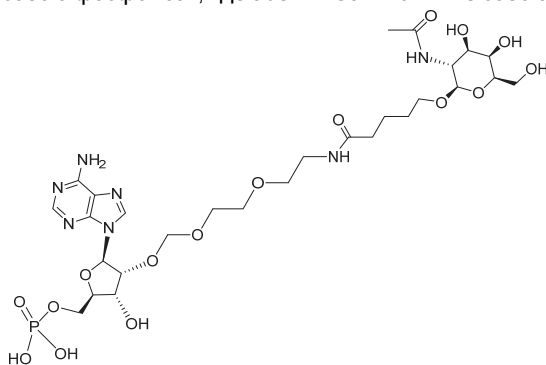
(71) НОВО НОРДСК А/С (DK), ДИСЕРНА ФАРМАСЬО-ТИКАЛЗ, ІНК. (US)

(72) Дудек Генрик (US), Хань Вень (US), Перселл Наталі Вейн (US), Лай Ченжун (US), Хайнес Вільям Джеффрі (GB), Дін Чжихао (CN)

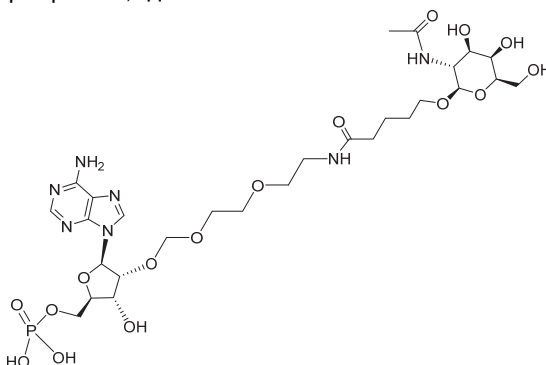
(54) КОМПОЗИЦІЇ Й СПОСОБИ ДЛЯ ІНГІБУВАННЯ ЕКСПРЕСІЇ МІТОХОНДРІАЛЬНОГО КОМПОНЕНТА 1, ЩО ВІДНОВЛЮЄ АМІДОКСИМ (MARC1)

(57) 1. Двонитковий олігонуклеотид для RNAi (dsRNAi) для інгібування експресії MARC1, де вказаний dsRNAi містить сенсову нитку й антисенсову нитку, де сенсова нитка містить послідовність і всі модифікації з 5'-mGs-mG-mC-mU-mA-mG-mA-fG-fA-fG-mA-mA-mG-mU-mU-mA-mA-mG-mC-mA-mG-mC-mC-mG-[ademA-GalNAc]-[ademA-GalNAc]-[ademA-GalNAc]-

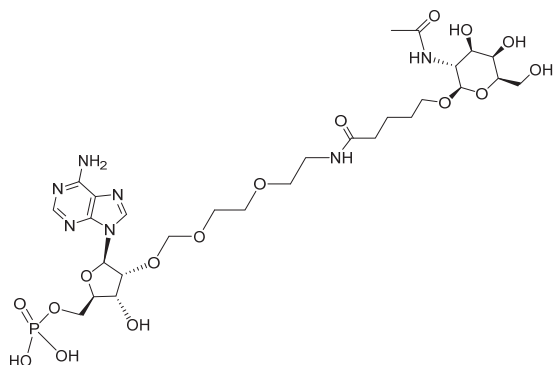
mG-mG-mC-mU-mG-mC-3' (SEQ ID NO: 1615), і де антисенсова нитка містить послідовність і всі модифікації з 5'-Me-фосфонат-4O-mUs-fUs-fUs-fA-fA-mC-fU-mU-mU-fC-mU-mU-mC-fU-mC-mU-mA-mG-mC-mCs-mGs-mG-3' (SEQ ID NO: 1651), де mC, mA, mG і mU являють собою 2'-OMe-рибонуклеозиди; fA, fC, fG і fU являють собою 2'-F-рибонуклеозиди; s являє собою фосфотіоат, і де ademA-GalNAc являє собою



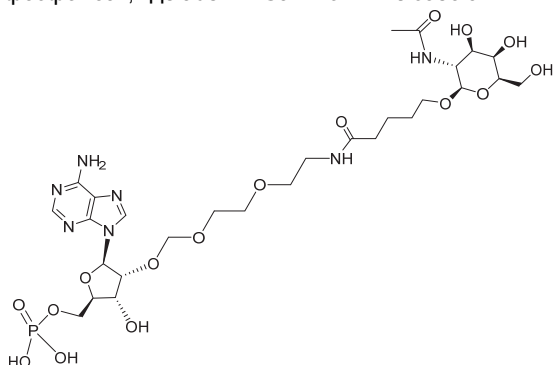
2. Двонитковий олігонуклеотид для RNAi (dsRNAi) для інгібування експресії MARC1, де вказаний dsRNAi містить сенсову нитку й антисенсову нитку, де сенсова нитка містить послідовність і всі модифікації з 5'-mAs-mG-mA-mA-mC-mG-mA-fA-fA-fG-fU-mU-mA-mU-mA-mU-mG-mG-mA-mA-mG-mC-mA-mG-mC-mC-mG-mG-mG-mC-mU-mG-mC-3' (SEQ ID NO: 1632), і де антисенсова нитка містить послідовність і всі модифікації з 5'-Me-фосфонат-4O-mUs-fUs-fCs-fC-fA-mU-fA-mU-mA-fA-mC-mU-mU-fU-mC-mG-mU-mU-mC-mUs-mGs-mG-3' (SEQ ID NO: 1668), де mC, mA, mG і mU являють собою 2'-OMe-рибонуклеозиди; fA, fC, fG і fU являють собою 2'-F-рибонуклеозиди; s являє собою фосфотіоат, і де ademA-GalNAc являє собою



3. Двонитковий олігонуклеотид для RNAi (dsRNAi) для інгібування експресії MARC1, де вказаний dsRNAi містить сенсову нитку й антисенсову нитку, де сенсова нитка містить послідовність і всі модифікації з 5'-mAs-mA-mG-mU-mU-mG-mA-fC-fU-fA-fA-mA-mC-mU-mU-mG-mA-mA-mA-mG-mC-mA-mG-mC-mC-mG-[ademA-GalNAc]-[ademA-GalNAc]-[ademA-GalNAc]-mG-mG-mC-mU-mG-mC-3' (SEQ ID NO: 1640), і де антисенсова нитка містить послідовність і всі модифікації з 5'-Me-фосфонат-4O-mUs-fUs-fUs-fU-fC-mA-fA-mG-mU-fU-mU-mA-mG-fU-mC-mA-mA-mC-mU-mUs-mGs-mG-3' (SEQ ID NO: 1676), де mC, mA, mG і mU являють собою 2'-OMe-рибонуклеозиди; fA, fC, fG і fU являють собою 2'-F-рибонуклеозиди; s являє собою фосфотіоат, і де ademA-GalNAc являє собою.



4. Двонитковий олігонуклеотид для RNAi (dsRNAi) для інгібування експресії MARC1, де вказаний dsRNAi містить сенсову нитку й антисенсову нитку, де сенсова нитка містить послідовність і всі модифікації з 5'-mUs-mG-mU-mG-mA-mA-mU-fA-fA-fU-mG-mG-mA-mA-mG-mC-mU-mA-mA-mG-mC-mA-mG-mC-mC-mG-[ademA-GalNAc]-[ademA-GalNAc]-[ademA-GalNAc]-mG-mG-mC-mU-mG-mC-3' (SEQ ID NO: 1625), і де антисенсова нитка містить послідовність і всі модифікації з 5'-Me-фосфонат-4O-mUs-fUs-fAs-fG-fC-mU-fU-mC-mC-fA-mU-mU-mU-fA-mU-mU-mC-mA-mC-mAs-mGs-mG-3' (SEQ ID NO: 1661), де mC, mA, mG і mU являють собою 2'-OMe-рибонуклеозиди; fA, fC, fG і fU являють собою 2'-F-рибонуклеозиди; s являє собою фосфотіоат, і де ademA-GalNAc являє собою



5. Олігонуклеотид для RNAi для зниження експресії MARC1, при цьому олігонуклеотид містить сенсову нитку й антисенсову нитку, де сенсова нитка й антисенсова нитка утворюють дуплексну ділянку, де антисенсова нитка містить ділянку комплементарності щодо послідовності-мішені мРНК MARC1 під будь-яким із SEQ ID NO: 1-384, і де ділянка комплементарності має довжину щонайменше 15 суміжних нуклеотидів, що відрізняються не більше ніж 3 нуклеотидами від послідовності-мішені мРНК MARC1.

6. Олігонуклеотид для RNAi за п. 5, що містить:

- (i) антисенсову нитку довжиною 19-30 нуклеотидів, де антисенсова нитка містить нуклеотидну послідовність, що містить ділянку комплементарності щодо послідовності-мішені мРНК MARC1, де ділянка комплементарності вибрана з SEQ ID NO: 385-768, і
- (ii) сенсову нитку довжиною 19-50 нуклеотидів, що містить ділянку комплементарності щодо антисенсової нитки, де антисенсова й сенсова нитки являють собою окремі нитки, які утворюють асиметричну дуплексну ділянку, що має виступ з 1-4 нуклеотидів на 3'-кінці антисенсової нитки.

7. Олігонуклеотид для RNAi за п. 5, де:

(i) сенсова нитка має довжину від 15 до 50 або від 18 до 36 нуклеотидів, необов'язково має довжину 36 нуклеотидів; необов'язково

(ii) антисенсова нитка має довжину від 15 до 30 нуклеотидів, необов'язково має довжину 22 нуклеотиди; і необов'язково

(iii) дуплексна ділянка має довжину щонайменше 19 нуклеотидів або щонайменше 20 нуклеотидів.

8. Олігонуклеотид для RNAi за будь-яким із пп. 5-7, де 3'-кінець сенсової нитки містить структуру стебло-петля, представлену у вигляді S1-L-S2, де

(i) S1 комплементарне S2, де необов'язково кожне з S1 і S2 має довжину 1-10 нуклеотидів, і вони мають однакову довжину, де необов'язково кожне з S1 і S2 має довжину 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 або 10 нуклеотидів, де додатково необов'язково S1 і S2 мають довжину 6 нуклеотидів; і

(ii) L утворює петлю між S1 і S2 довжиною 3-5 нуклеотидів, де необов'язково L являє собою трипетлю або тетрапетлю, де необов'язково тетрапетля містить послідовність 5'-GAAA-3', де необов'язково структура стебло-петля містить послідовність 5'-GCAGCCGA AAGGCGC-3' (SEQ ID NO: 1681).

9. Олігонуклеотид для RNAi за будь-яким із пп. 5-8, де щонайменше один нуклеотид олігонуклеотиду кон'югований з одним або більше націлювальними лігандами, де необов'язково:

(a) кожний націлювальний ліганд містить вуглевод, аміноцукор, холестерин, поліпептид або ліпід;

(b) структура стебло-петля містить один або більше націлювальних лігандів, кон'югованих з одним або більше нуклеотидами структури стебло-петля;

(c) один або більше націлювальних лігандів кон'юговані з одним або більше нуклеотидами петлі, де необов'язково петля містить 4 нуклеотиди, пронумеровані як 1-4 у напрямку 5'-3', де кожний із нуклеотидів у положеннях 2, 3 і 4 містить один або більше націлювальних лігандів, де націлювальні ліганди є однаковими або різними;

(d) націлювальний ліганд являє собою ліганд, що націлюється на гепатоцити, і кожний націлювальний ліганд містить N-ацетилгалактозаміновий фрагмент (GalNAc), де необов'язково GalNAc-фрагмент являє собою моновалентний GalNAc-фрагмент, бівалентний GalNAc-фрагмент, тривалентний GalNAc-фрагмент або тетравалентний GalNAc-фрагмент; і/або

(e) націлювальний ліганд являє собою ліганд, що націлюється на гепатоцити, і кожний із аж до 4 нуклеотидів L структури стебло-петля кон'югований з моновалентним GalNAc-фрагментом.

10. Олігонуклеотид для RNAi за будь-яким із пп. 5-9, де:

(i) олігонуклеотид містить щонайменше один модифікований нуклеотид, де необов'язково модифікований нуклеотид містить 2'-модифікацію, де необов'язково:

(a) 2'-модифікація являє собою модифікацію, вибрану з 2'-аміноетилю, 2'-фтору, 2'-О-метилу, 2'-О-метоксиетилю і 2'-дезоксид-2'-фтор-β-d-арабінонуклеїнової кислоти, де необов'язково модифікація вибрана з 2'-фтору і 2'-О-метилу, де необов'язково усі нуклеотиди олігонуклеотиду є модифікованими, де модифікація являє собою 2'-фтор і 2'-О-метил;

(b) приблизно 10-15 %, 10 %, 11 %, 12 %, 13 %, 14 % або 15 % нуклеотидів сенсової нитки містять 2'-фтор-модифікацію;

(с) приблизно 25-35 %, 25 %, 26 %, 27 %, 28 %, 29 %, 30 %, 31 %, 32 %, 33 %, 34 % або 35 % нуклеотидів антисенсової нитки містять 2'-фтор-модифікацію;

(d) приблизно 25-35 %, 25 %, 26 %, 27 %, 28 %, 29 %, 30 %, 31 %, 32 %, 33 %, 34 % або 35 % нуклеотидів олігонуклеотиду містять 2'-фтор-модифікацію;

(е) сенсова нитка містить 36 нуклеотидів із положеннями 1-36 у напрямку 5'-3', де у положеннях 8-11 міститься 2'-фтор-модифікація;

(f) антисенсова нитка містить 22 нуклеотиди з положеннями 1-22 у напрямку 5'-3', і де в положеннях 2, 3, 4, 5, 7, 10 і 14 міститься 2'-фтор-модифікація; і/або

(g) решта нуклеотидів містять 2'-О-метил-модифікацію, і/або

(ii) олігонуклеотид містить щонайменше один модифікований міжнуклеотидний зв'язок, де необов'язково щонайменше один модифікований міжнуклеотидний зв'язок являє собою фосфотіоатний зв'язок, де необов'язково:

(a) антисенсова нитка містить фосфотіоатний зв'язок

(i) між положеннями 1 і 2 і між положеннями 2 і 3 або (ii) між положеннями 1 і 2, між положеннями 2 і 3 і між положеннями 3 і 4, де положення пронумеровані як 1-4 у напрямку 5'-3'; і/або

(b) антисенсова нитка має довжину 22 нуклеотиди, і де антисенсова нитка містить фосфотіоатний зв'язок між положеннями 20 і 21 і між положеннями 21 і 22, де положення пронумеровані як 1-22 у напрямку 5'-3'; і/або

(iii) антисенсова нитка містить фосфорильований нуклеотид на 5'-кінці, де фосфорильований нуклеотид вибраний із уридину й аденозину, де необов'язково фосфорильований нуклеотид являє собою уридин, і/або

(iv) 4'-атом вуглецю цукру 5'-нуклеотиду антисенсової нитки містить аналог фосфату, де необов'язково аналог фосфату являє собою оксиметилфосфонат, вінілфосфонат або малонілфосфонат, де необов'язково аналог фосфату являє собою 4'-аналог фосфату, що передбачає 5'-метоксифосфонат-4'-окси, і/або

(v) антисенсова нитка містить послідовність виступу довжиною один або більше нуклеотидів на 3'-кінці, де необов'язково виступ містить пуринові нуклеотиди, де необов'язково послідовність виступу має довжину 2 нуклеотиди, де необов'язково виступ вибраний із AA, GG, AG і GA, де необов'язково виступ являє собою GG.

11. Олігонуклеотид для RNAi за будь-яким із пп. 5-10, де сенсова нитка й антисенсова нитка містять нуклеотидні послідовності, вибрані з групи, що складається з:

(a) SEQ ID NO: 1537 і 1573 відповідно;

(b) SEQ ID NO: 1538 і 1574 відповідно;

(c) SEQ ID NO: 1539 і 1575 відповідно;

(d) SEQ ID NO: 1540 і 1576 відповідно;

(e) SEQ ID NO: 1541 і 1577 відповідно;

(f) SEQ ID NO: 1542 і 1578 відповідно;

(g) SEQ ID NO: 1543 і 1579 відповідно;

(h) SEQ ID NO: 1544 і 1580 відповідно;

(i) SEQ ID NO: 1545 і 1581 відповідно;

(j) SEQ ID NO: 1546 і 1582 відповідно;

(k) SEQ ID NO: 1547 і 1583 відповідно;

(l) SEQ ID NO: 1548 і 1584 відповідно;

(m) SEQ ID NO: 1549 і 1585 відповідно;

(n) SEQ ID NO: 1550 і 1586 відповідно;

(o) SEQ ID NO: 1551 і 1587 відповідно;

(p) SEQ ID NO: 1552 і 1588 відповідно;

(q) SEQ ID NO: 1553 і 1589 відповідно;

(r) SEQ ID NO: 1554 і 1590 відповідно;

(s) SEQ ID NO: 1555 і 1591 відповідно;

(t) SEQ ID NO: 1556 і 1592 відповідно;

(u) SEQ ID NO: 1557 і 1593 відповідно;

(v) SEQ ID NO: 1558 і 1594 відповідно;

(w) SEQ ID NO: 1559 і 1595 відповідно;

(x) SEQ ID NO: 1560 і 1596 відповідно;

(y) SEQ ID NO: 1561 і 1597 відповідно;

(z) SEQ ID NO: 1562 і 1598 відповідно;

(aa) SEQ ID NO: 1563 і 1599 відповідно;

(bb) SEQ ID NO: 1564 і 1600 відповідно;

(cc) SEQ ID NO: 1565 і 1601 відповідно;

(dd) SEQ ID NO: 1566 і 1602 відповідно;

(ee) SEQ ID NO: 1567 і 1603 відповідно;

(ff) SEQ ID NO: 1568 і 1604 відповідно;

(gg) SEQ ID NO: 1569 і 1605 відповідно й

(hh) SEQ ID NO: 1570 і 1606 відповідно; або

де сенсова й антисенсова нитки містять нуклеотидні послідовності, вибрані із групи, що складається з:

(a) SEQ ID NO: 1609 і 1645 відповідно;

(b) SEQ ID NO: 1610 і 1646 відповідно;

(c) SEQ ID NO: 1611 і 1647 відповідно;

(d) SEQ ID NO: 1612 і 1648 відповідно;

(e) SEQ ID NO: 1613 і 1649 відповідно;

(f) SEQ ID NO: 1614 і 1650 відповідно;

(g) SEQ ID NO: 1615 і 1651 відповідно;

(h) SEQ ID NO: 1616 і 1652 відповідно;

(i) SEQ ID NO: 1617 і 1653 відповідно;

(j) SEQ ID NO: 1618 і 1654 відповідно;

(k) SEQ ID NO: 1619 і 1655 відповідно;

(l) SEQ ID NO: 1620 і 1656 відповідно;

(m) SEQ ID NO: 1621 і 1657 відповідно;

(n) SEQ ID NO: 1622 і 1658 відповідно;

(o) SEQ ID NO: 1623 і 1659 відповідно;

(p) SEQ ID NO: 1624 і 1660 відповідно;

(q) SEQ ID NO: 1625 і 1661 відповідно;

(r) SEQ ID NO: 1626 і 1662 відповідно;

(s) SEQ ID NO: 1627 і 1663 відповідно;

(t) SEQ ID NO: 1628 і 1664 відповідно;

(u) SEQ ID NO: 1628 і 1665 відповідно;

(v) SEQ ID NO: 1630 і 1666 відповідно;

(w) SEQ ID NO: 1631 і 1667 відповідно;

(x) SEQ ID NO: 1632 і 1668 відповідно;

(y) SEQ ID NO: 1633 і 1669 відповідно;

(z) SEQ ID NO: 1634 і 1670 відповідно;

(aa) SEQ ID NO: 1635 і 1671 відповідно;

(bb) SEQ ID NO: 1636 і 1672 відповідно;

(cc) SEQ ID NO: 1637 і 1673 відповідно;

(dd) SEQ ID NO: 1638 і 1674 відповідно;

(ee) SEQ ID NO: 1639 і 1675 відповідно;

(ff) SEQ ID NO: 1640 і 1676 відповідно;

(gg) SEQ ID NO: 1641 і 1677 відповідно й

(hh) SEQ ID NO: 1642 і 1678 відповідно.

12. Двонитковий олігонуклеотид для RNAi (dsRNAi) для інгібування експресії MARC1, де указаний dsRNAi містить сенсову нитку й антисенсову нитку, де сенсова нитка й антисенсова нитка утворюють дуплексну ділянку, і де

(i) сенсова й антисенсова нитки містять нуклеотидні послідовності, представлені під SEQ ID NO: 1615 і 1651 відповідно;

(ii) сенсова й антисенсова нитки містять нуклеотидні послідовності, представлені під SEQ ID NO: 1632 і 1668 відповідно;

(iii) сенсова й антисенсова нитки містять нуклеотидні послідовності, представлені під SEQ ID NO: 1640 і 1676 відповідно; або

(iv) сенсова й антисенсова нитки містять нуклеотидні послідовності, представлені під SEQ ID NO: 1625 і 1661 відповідно.

13. Фармацевтична композиція, що містить олігонуклеотид для RNAi за будь-яким із пп. 1-12 і фармацевтично прийнятний носій, засіб доставки або допоміжну речовину.

14. Застосування олігонуклеотиду для RNAi за будь-яким із пп. 1-12 або фармацевтичної композиції за п. 13 як лікарського препарату для лікування захворювання, порушення або стану, асоційованих з експресією MARC1, необов'язково для лікування захворювання або стану, асоційованих з експресією MARC1 у гепатоцитах.

15. Застосування олігонуклеотиду для RNAi за п. 14 як лікарського препарату для лікування захворювання, вибраного із групи, що складається з неалкогольної жирової хвороби печінки (NAFLD), неалкогольного стеатогепатиту (NASH) і алкогольного стеатогепатиту (ASH).

(21) а 2023 05860
(22) 10.05.2022

(51) МПК
C12P 7/64 (2022.01)
C12P 7/04 (2006.01)
C12P 7/24 (2006.01)
C12P 7/62 (2022.01)
C12N 9/02 (2006.01)
A01N 31/02 (2006.01)
C12N 15/82 (2006.01)

(31) 21173017.1

(32) 10.05.2021

(33) EP

(85) 15.12.2023

(86) РСТ/EP2022/062641, 10.05.2022

(71) ЕФЕМСІ ЕГРІКАЛЧУРЕЛ СОЛЮШНС А/С (DK)

(72) Бородіна Іріна (DK), Голкенбрінк Каріна (DK), Кільдегард Канчана Руксомтавін (DK), Пяткявічус Кароліс (DK), Веннінґ Леоні (DK)

(54) УДОСКОНАЛЕНІ СПОСОБИ ТА КЛІТИНИ ДЛЯ ЗБІЛЬШЕННЯ ФЕРМЕНТАТИВНОЇ АКТИВНОСТІ ТА ПРОДУКЦІЇ ФЕРОМОНІВ КОМАХ

(57) 1. Клітина, яка експресує:

i) перший фермент або групу ферментів, здатних перетворювати ацил-КоА жирних кислот на сполуку, вибрану з ненасиченого жирного спирту, насиченого жирного спирту, ацетату ненасиченого жирного спирту й ацил-КоА ненасиченої жирної кислоти; і

ii) гетерологічну НАД(Ф)Н цитохром-b5 оксидоредуктазу (Ncb5or);

завдяки чому клітина здатна продукувати цю сполуку з вищими титром і/або чистотою порівняно з клітиною, яка експресує першу групу ферментів, але не гетерологічну Ncb5or у разі культивування в тих самих умовах,

переважно при цьому клітина є дріжджовою клітиною, наприклад олійною дріжджовою клітиною або рослинною клітиною.

2. Клітина за п. 1, в якій перші фермент або група ферментів включають або складаються з:

а) однієї або більше десатураз, здатних перетворювати ацил-КоА жирних кислот на ацил-КоА ненасичених жирних кислот, завдяки чому клітина здатна продукувати ацил-КоА ненасичених жирних кислот з вищими титром і/або чистотою порівняно з клітиною, що експресує зазначену одну або більше десатураз, але не містить гетерологічної Ncb5or у разі культивування в тих самих умовах;

б) однієї або більше редуктаз жирних кислот (FAR), здатних перетворювати ацил-КоА жирних кислот на жирний спирт; завдяки чому клітина здатна продукувати жирний спирт із вищими титром і/або чистотою порівняно з клітиною, що експресує зазначену одну або більше FAR, але не містить гетерологічної Ncb5or у разі культивування в тих самих умовах; або

с) однієї або більше FAR і однієї або більше десатураз, здатних перетворювати ацил-КоА жирних кислот на ненасичений жирний спирт; завдяки чому клітина здатна продукувати ненасичений жирний спирт із вищими титром і/або чистотою порівняно з клітиною, що експресує зазначену одну або більше FAR і зазначену одну або більше десатураз, але не містить гетерологічної Ncb5or у разі культивування в тих самих умовах.

3. Клітина за будь-яким з попередніх пунктів, у якій Ncb5or є нативною для рослини, комахи, або ссавця, наприклад Homo sapiens, причому переважно Ncb5or є нативною для комахи, наприклад комахи роду Agrotis, Amyeloid, Aphantopus, Arctia, Bicyclus, Bombyx, Chilo, Cydia, Danaus, Drosophila, Eumeta, Galleria, Helicoverpa, Heliiothis, Hyposmocoma, Leptidea, Lobesia, Manduca, Operophtera, Ostrinia, Papilio, Papilio, Papilio, Pieris, Plutella, Spodoptera, Trichoplusia і Vanessa, наприклад при цьому Ncb5or є нативною для комахи, вибраної з Agrotis segetum, Amyeloid transitella, Aphantopus hyperantus, Arctia plantaginis, Bicyclus anynana, Bombyx terrestris, Bombyx mandarina, Bombyx mori, Chilo suppressalis, Cydia pomonella, Danaus plexippus, Drosophila grimshawi, Drosophila melanogaster, Eumeta japonica, Galleria mellonella, Helicoverpa armigera, Heliiothis virescens, Hyposmocoma kahamanoa, Leptidea sinapis, Lobesia botrana, Manduca sexta, Operophtera brumata, Ostrinia furnacalis, Papilio machaon, Papilio polytes, Papilio xuthus, Pieris rapae, Plutella xylostella, Spodoptera frugiperda, Spodoptera litura, Trichoplusia ni та Vanessa tameamea.

4. Клітина за будь-яким з попередніх пунктів, у якій Ncb5or є вибраною з групи Ncb5or, показаних у SEQ ID NO: 111-114, SEQ ID NO: 124 і SEQ ID NO: 182-185, або варіантів, що мають щонайменше 70 % ідентичності з ними, наприклад щонайменше 75 % ідентичності, наприклад щонайменше 80 % ідентичності, наприклад щонайменше 85 % ідентичності, наприклад щонайменше 90 % ідентичності, наприклад щонайменше 95 % ідентичності з ними.

5. Клітина за будь-яким з попередніх пунктів, у якій десатураза є нативною для рослини, такої як Ricinus communis або Pelargonium hortorum, або комахи, такої як Diptera, Coleoptera, або ряду Lepidoptera, наприклад роду Agrotis, Antheraea, Argyrotaenia, Amyeloid, Bombyx, Cadra, Chauliognathus, Chilo, Choristoneura, Cydia, Dendrophilus, Diatraea, Drosophila, Ephestia, Epiphyas, Grapholita, Helicoverpa, Lampronia,

Lobesia, Manducta, Ostrinia, Pectinophora, Plodia, Plutella, Thalassiosira, Thaumetopoea, Tribolium, Trichoplusia, Spodoptera або Yponomeuta, наприклад *Agrotis segetum*, *Antheraea pernyi*, *Argyrotaenia velutiana*, *Amyelois transitella*, *Bombus lapidarius*, *Bombyx mori*, *Cadra cautella*, *Chauliognathus lugubris*, *Chilo suppressalis*, *Choristoneura parallela*, *Choristoneura rosaceana*, *Cydia pomonella*, *Dendrophilus punctatus*, *Diatraea saccharalis*, *Drosophila ananassae*, *Drosophila melanogaster*, *Drosophila virilis*, *Drosophila yakuba*, *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epiphyas postvittana*, *Grapholita molesta*, *Helicoverpa assulta*, *Helicoverpa zea*, *Lamproloma capitella*, *Lobesia botrana*, *Manducta sexta*, *Ostrinia furnacalis*, *Ostrinia nubilalis*, *Pectinophora gossypiella*, *Plodia interpunctella*, *Plutella xylostella*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thalassiosira pseudonana*, *Thaumetopoea pityocampa*, *Tribolium castaneum*, *Trichoplusia ni* або *Yponomeuta padella*.

6. Клітина за будь-яким з попередніх пунктів, у якій десатураза є вибраною з групи, що складається з Δ3-десатурази, Δ5-десатурази, Δ6-десатурази, Δ7-десатурази, Δ8-десатурази, Δ9-десатурази, Δ10-десатурази, Δ11-десатурази, Δ12-десатурази, Δ13-десатурази та Δ14-десатурази, переважно в якій десатураза є Δ9-десатуразою або Δ11-десатуразою, та/або в якій десатураза є вибраною з групи десатураз, показаних у SEQ ID NO: 1-38 і SEQ ID NO: 126-139, або варіантів, що мають щонайменше 70 % ідентичності з ними, наприклад щонайменше 75 % ідентичності, наприклад щонайменше 80 % ідентичності, наприклад щонайменше 85 % ідентичності, наприклад щонайменше 90 % ідентичності, наприклад щонайменше 95 % ідентичності.

7. Клітина за будь-яким з попередніх пунктів, у якій FAR переважно є нативною для до комах, наприклад комах ряду *Lepidoptera*, наприклад роду *Agrotis*, *Amyelois*, *Bicyclus*, *Bombus*, *Chilo*, *Chrysodeixis*, *Cydia*, *Helicoverpa*, *Heliothis*, *Manducta*, *Ostrinia*, *Plodia*, *Plutella*, *Spodoptera*, *Trichoplusia*, *Tyta* або *Yponomeuta*, або в якій FAR є нативною для бактерії, наприклад роду *Marinobacter*, переважно в якій FAR являє собою ацилредуктазу жирних кислот, нативну для *Agrotis segetum*, *Amyelois transitella*, *Bicyclus anynana*, *Bombus lapidaries*, *Chilo suppressalis*, *Chrysodeixis includes*, *Cydia pomonella*, *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa assulta*, *Heliothis virescens*, *Heliothis subflexa*, *Manducta sexta*, *Marinobacter algicola*, *Ostrinia furnacalis*, *Plodia interpunctella*, *Plutella xylostella*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Trichoplusia ni*, *Tyta alba* або *Yponomeuta rorellus*, або її функціональний варіант, який має щонайменше 80 % ідентичності.

8. Клітина за будь-яким з попередніх пунктів, у якій FAR є вибраною з групи FAR, показаних у SEQ ID NO: 77-93 і SEQ ID NO: 154-167, або варіантів, що мають щонайменше 70 % ідентичності з ними, наприклад щонайменше 75 % ідентичності, наприклад щонайменше 80 % ідентичності, наприклад щонайменше 85 % ідентичності, наприклад щонайменше 90 % ідентичності, наприклад щонайменше 95 % ідентичності.

9. Спосіб збільшення активності щонайменше одного ферменту, вибраного з групи, що складається з десатураз і ацил-КоА-редуктаз жирних кислот (FAR), причому зазначений спосіб включає такі стадії як:

a. представлення десатурази, здатної вводити щонайменше один подвійний зв'язок в ацил-КоА жирної кислоти, перетворюючи таким чином принаймні частину зазначеного ацил-КоА жирної кислоти на ацил-КоА ненасиченої жирної кислоти; та/або

b. представлення FAR, здатної перетворювати принаймні частину зазначеного ацил-КоА ненасиченої жирної кислоти в ненасичений жирний спирт, утворюючи таким чином зазначений ненасичений жирний спирт; і

c. приведення до контакту зазначеної десатурази та/або FAR з Ncb50g, тим самим підвищуючи активність зазначеної десатурази та/або FAR порівняно з активністю зазначеної десатурази та/або FAR за відсутності зазначеної Ncb50g, при цьому активність вимірюють за однакових умов;

при цьому збільшення активності вимірюють шляхом вимірювання концентрації та/або чистоти продукту, утвореного десатуразою та/або FAR, переважно при цьому зазначена клітина є клітиною за будь-яким з попередніх пунктів.

10. Спосіб отримання сполуки, вибраної з ненасиченого жирного спирту, насиченого жирного спирту, ацетату ненасиченого жирного спирту й ацил-КоА ненасичених жирних кислот у клітині, причому зазначений спосіб включає такі стадії як:

a. представлення клітини й інкубації цієї клітини в середовищі; та

b. експресування в зазначеній клітині першого ферменту або групи ферментів, здатних перетворювати ацил-КоА жирної кислоти на зазначену сполуку, тим самим перетворюючи принаймні частину зазначеного ацил-КоА жирної кислоти на зазначену сполуку; і

c. експресія в цій клітині Ncb50g;

d. необов'язково, виділення зазначеної сполуки, переважно при цьому зазначена клітина є клітиною за будь-яким з пунктів 1-8.

11. Спосіб збільшення титру та/або чистоти сполуки, вибраної з ненасиченого жирного спирту, насиченого жирного спирту, ацетату ненасиченого жирного спирту й ацил-КоА ненасичених жирних кислот, продукуюваних у клітині, здатній синтезувати один або більше ацил-КоА жирних кислот і/або здатній імпортувати ацил-КоА жирних кислот зі свого оточення, причому зазначений спосіб включає такі стадії як:

a. експресування в зазначеній клітині першого ферменту або групи ферментів, здатних перетворювати ацил-КоА жирної кислоти на зазначену сполуку, тим самим перетворюючи принаймні частину зазначеного ацил-КоА жирної кислоти на зазначену сполуку; і

b. експресування в зазначеній клітині Ncb50g, тим самим підвищуючи титр та/або чистоту зазначеної сполуки порівняно з титром та/або чистотою сполуки, отриманої з клітини, яка не експресує зазначену Ncb50g у тих самих умовах;

c. необов'язково, виділення зазначеної сполуки, переважно при цьому зазначена клітина є клітиною за будь-яким з пунктів 1-8.

12. Сполука за п. 11, у якій

перші фермент або група ферментів складаються з:

a) однієї або більше десатураз, здатних перетворювати ацил-КоА жирних кислот на ацил-КоА ненасичених жирних кислот, і при цьому зазначена сполука являє собою ацил-КоА ненасичених жирних кислот; та/або

b) однієї або більше FAR, здатних перетворювати ацил-КоА жирних кислот на насичені жирні спирти, і

при цьому зазначена сполука являє собою насичений жирний спирт; або

с) однієї або більше FAR і однієї або більше десатураз, здатних перетворювати ацил-КоА жирних кислот на ненасичені жирні спирти, і при цьому зазначена сполука являє собою ненасичений жирний спирт; і/або при цьому

титр і/або чистота ненасичених жирних спиртів і/або ацетатів жирних спиртів, титр і/або чистота насичених жирних спиртів і/або ацетатів жирних спиртів і/або загальний титр насичених жирних спиртів і/або ацетатів жирних спиртів є збільшеними на щонайменше 3 % порівняно з титром і/або чистотою, отриманими від клітини, яка не експресує зазначену Ncb5or, наприклад на щонайменше 4 %, наприклад щонайменше 5 %, наприклад щонайменше 10 %, наприклад щонайменше 15 %, наприклад щонайменше 20 %, наприклад щонайменше 25 %, наприклад щонайменше 30 %, наприклад щонайменше 35 %, наприклад щонайменше 40 %, наприклад щонайменше 45 %, наприклад щонайменше 50 %, наприклад щонайменше 55 %, наприклад щонайменше 60 %, наприклад щонайменше 70 %, наприклад щонайменше 80 %, наприклад щонайменше 90 %, наприклад щонайменше 100 %, наприклад щонайменше 150 %, наприклад щонайменше 200 %, наприклад щонайменше 250 %.

13. Система конструкцій нуклеїнових кислот, яка містить нуклеїнові кислоти, що кодують Ncb5or і:

а. десатуразу, здатну вводити щонайменше один подвійний зв'язок в ацил-КоА жирної кислоти; та/або

б. ацил-КоА редуктазу жирних кислот, здатну перетворювати принаймні частину ацил-КоА ненасичених жирних кислот на ненасичений жирний спирт.

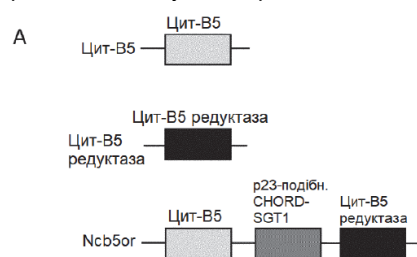
14. Використання Ncb5or у способі збільшення активності одного або більше ферментів, переважно при цьому один або більше ферментів є одним або більше мембранозв'язаними ферментами та/або при цьому один або більше ферментів є вибраними з групи, що складається з десатураз і ацилредуктаз жирних кислот, необов'язково при цьому збільшення активності зазначеного одного або більше ферментів є щонайменше 1,2-кратним для десатурази та/або FAR, наприклад щонайменше 1,3-кратним, наприклад щонайменше 1,4-кратним, наприклад щонайменше 1,5-кратним, наприклад щонайменше 1,6-кратним, наприклад щонайменше 1,7-кратним, наприклад щонайменше 1,8-кратним, наприклад щонайменше 1,9-кратним, наприклад щонайменше 2-кратним, наприклад щонайменше 3-кратним, наприклад щонайменше 4-кратним, наприклад щонайменше 5-кратним, наприклад щонайменше 6-кратним, наприклад щонайменше 7-кратним, наприклад щонайменше 8-кратним, наприклад щонайменше 9-кратним, наприклад щонайменше 10-кратним, наприклад щонайменше 15-кратним, наприклад щонайменше 20-кратним, наприклад щонайменше 30-кратним, наприклад щонайменше 40-кратним, наприклад щонайменше 50-кратним; причому збільшення активності зазначеного одного або більше ферментів порівнюють з активністю зазначеного одного або більше ферментів за відсутності зазначеної Ncb5or, при цьому активність вимірюють за однакових умов, при цьому збільшення вимірюють шляхом вимірювання концентрації продукту, утвореного одним або більше ферментами.

15. Спосіб моніторингу присутності шкідника або перешкоджання спарюванню шкідників, який включає такі стадії як:

а. отримання ненасиченого жирного спирту та, необов'язково, ацетату ненасиченого жирного спирту та/або ненасиченого жирного альдегіду відповідно до способу за будь-яким з пп. 9-12; і

б. приготування зазначеного ненасиченого жирного спирту та, необов'язково, зазначеного ацетату ненасиченого жирного спирту та/або зазначеного ненасиченого жирного альдегіду у вигляді феромонної композиції; та

с. використання зазначеної феромонної композиції як інтегрованого засобу для боротьби зі шкідниками.



Фігура 1А



Фігура 1Б

C 21

(21) а 2023 06209
(22) 26.05.2021

(51) МПК (2024.01)
C21B 7/00
C21B 13/00
C21B 13/02 (2006.01)
B01D 53/14 (2006.01)

(85) 20.12.2023

(86) РСТ/ІВ2021/054581, 26.05.2021

(71) АРСЕЛОРМІТТАЛ (LU)

(72) Цвік Джордж (US), Буланов Дмитрі (US), Рейес Родріґес Джон (ES), Керье Оділь (FR), Саламе Сара (FR), Баррос Лоренцо Хосе (FR), Андраде Марсело (US), Лу Денніс (US)

(54) СПОСІБ ЕКСПЛУАТАЦІЇ МЕРЕЖІ УСТАНОВОК

(57) 1. Спосіб експлуатації мережі установок, яка має:

- доменну піч, яка виробляє гарячий метал і колошниковий газ доменної печі,
- піч прямого відновлення, в яку завантажують окиснене залізо, яке підлягає відновленню відновним газом для одержання заліза прямого відновлення, при цьому зазначена піч прямого відновлення має зону відновлення, перехідну зону і зону охолодження,

- установку конверсії CO_2 , в якій здійснюють стадію конверсії CO_2 колошникового газу доменної печі для одержання рідкого вуглецевмісного продукту, в якому зазначений рідкий вуглецевмісний продукт впорскують в піч прямого відновлення.

2. Спосіб за п. 1, в якому рідкий вуглецевмісний продукт впорскують, щонайменше, в перехідну зону печі прямого відновлення.

3. Спосіб за п. 1, в якому рідкий вуглецевмісний продукт впорскують щонайменше в зону охолодження печі прямого відновлення.

4. Спосіб за будь-яким з пп. 1-3, в якому рідкий вуглецевмісний продукт впорскують в перехідну зону і зону охолодження печі прямого відновлення.

5. Спосіб за будь-яким з пп. 1-4, в якому рідкий вуглецевмісний продукт є біопаливом.

6. Спосіб за будь-яким з пп. 1-5, в якому рідкий вуглецевмісний продукт є рідким спиртом.

7. Спосіб за будь-яким з пп. 1-5, в якому рідкий вуглецевмісний продукт є рідким вуглеводнем.

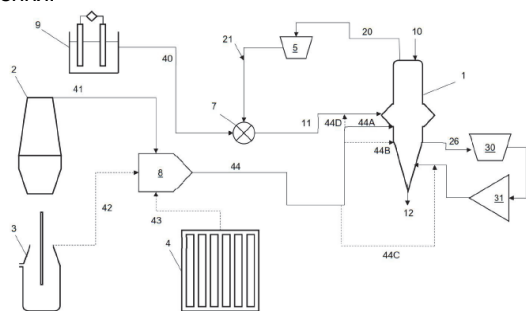
8. Спосіб за будь-яким з пп. 1-7, в якому відновний газ містить більше 50 % об. водню.

9. Спосіб за будь-яким з пп. 1-8, в якому відновний газ містить більше 99 % об. водню.

10. Спосіб за будь-яким з пп. 1-9, в якому мережа установок додатково має коксову піч, яка виробляє кокс і газ коксової печі, при цьому зазначений газ коксової печі змішують з газом доменної печі для перетворення на рідкий вуглецевмісний продукт.

11. Спосіб за будь-яким з пп. 1-10, в якому мережа установок додатково має сталеливарну установку, яка виробляє рідку сталь і газ сталеливарного виробництва, при цьому зазначений газ сталеливарного виробництва змішують з доменним газом печі для перетворення на рідкий вуглецевмісний продукт.

12. Спосіб за будь-яким з пп. 1-11, в якому стадія конверсії CO_2 включає стадію біологічного перетворення.



Фіг. 1

(21) а 2022 02943 (51) МПК
(22) 15.08.2022 C21D 9/36 (2006.01)

(71) ДЕРЖАВНИЙ ВИЩИЙ НАВЧАЛЬНИЙ ЗАКЛАД
"ПРИАЗОВСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІ-
ВЕРСИТЕТ" ДВНЗ "ПДТУ" (UA)

(72) Зурнаджи Вадим Іванович (UA), Єфременко Василь
Георгійович (UA), Чабак Юлія Геннадіївна (UA), Єф-
ременко Богдан Васильович (UA), Зайчук Наталя
Петрівна (UA)

(54) СПОСІБ ЗМІЦНЮВАЛЬНОЇ ТЕРМІЧНОЇ ОБРОБКИ
СТАЛІ

(57) Спосіб зміцнювальної термічної обробки низьколего-
ваної зварювальної сталі, що включає нагрів, охоло-
дження до температури ізотермічної витримки, ізоте-
рмічну витримку та остаточне охолодження на пові-
трі, який **відрізняється** тим, що нагрів виконують при
температурі двохфазного інтервалу з отриманням 5-
15 % фериту, а витримку проводять при температурі
(t) в інтервалі $M_n - 20^\circ\text{C} \leq t < M_n + 10^\circ\text{C}$, де M_n - тем-
пература початку мартенситного перетворення сталі.

C 22

(21) а 2023 04672 (51) МПК (2024.01)
(22) 04.10.2023 C22C 14/00
C22C 29/02 (2006.01)

(66) а 2021 02580, 17.05.2021

(71) ІНСТИТУТ ТЕХНІЧНОЇ ТЕПЛОФІЗИКИ НАН УКРАЇ-
НИ (UA)

(72) Щепетов Віталій Володимирович (UA), Фіалко Ната-
лія Михайлівна (UA), Меранова Наталія Олегівна (UA)

(54) ЗНОСОСТІЙКИЙ ВИСОКОТЕМПЕРАТУРНИЙ МА-
ТЕРІАЛ НА ОСНОВІ ТИТАНУ

(57) Зносостійкий високотемпературний матеріал на ос-
нові титану, що містить титан, який **відрізняється**
тим, що до його складу додатково входять також ле-
говані домішки, якими є ніобій, тантал, гафній, крем-
ній, карбон, карбід магнію у такому співвідношенні
компонентів, мас. %:

| | |
|------------------|--------|
| Nb | 4-8 |
| Ta | 2-5 |
| Hf | 5-8 |
| Si | 4-7 |
| C | 1-2 |
| MgC ₂ | 15-22 |
| Ti | решта. |

(21) а 2023 03237 (51) МПК (2024.01)
(22) 03.07.2023 C22C 38/00
C22C 37/10 (2006.01)

(71) ІНСТИТУТ ЧОРНОЇ МЕТАЛУРГІЇ ІМ. З.І. НЕКРАСОВА
НАН УКРАЇНИ (UA)

(72) Філоненко Наталія Юріївна (UA), Бабаченко Олек-
сандр Іванович (UA), Кононенко Ганна Андріївна (UA),
Молчанов Лавр Сергійович (UA), Вакульчук Володи-
мир Вікторович (UA), Дудченко Сергій Олександро-
вич (UA), Сафронова Олена Анатоліївна (UA)

(54) СПОСІБ ОТРИМАННЯ ТА ОБРОБКИ СТАЛІ

(57) Спосіб отримання та обробки сталі включає заванта-
ження в піч шихти, що складається зі сталевого бру-
хту, проплавлення її під основним шлакоутворюю-
чим матеріалом, коригування хімічного складу розп-
лаву, перегрів розплаву до заданої температури, ска-
чування шлаку, введення алюмінію та наведення но-
вого шару шлаку, термовитримку, вторинне скачува-
ння шлаку, введення легуючих матеріалів та випуск

металу, відрізняється тим, що перегрів расплава проводять при температурі на 145-155 °С вище ліквідусу заданої марки сталі без примусового окислення з послідовним введенням розкислювачів та легуючих матеріалів з термовитримками після введення кожної групи протягом 5-10 % часу від загальної тривалості розплавлення, при цьому для розкислення вводять алюміній в кількості 0,5-0,6 кг/т, після витримки вводять феромарганець і силікомарганець для коригування хімічного складу за вмістом марганцю, після наступної витримки вводять феросиліцій для коригування вмісту кремнію, а потім додають вуглецевовмісну добавку для досягнення заданого вмісту вуглецю, крім того перед випуском металу здійснюють додаткове розкислення алюмінієм і вводять в розплав примусовим зануренням азотовмісний силікомарганець з вмістом азоту 7-8 % зі щільністю в межах 4,5-6,5 г/см³.

C 23

(21) а 2023 05027
(22) 21.03.2022

(51) МПК (2024.01)
C23C 14/00
C23C 14/02 (2006.01)
C23C 14/06 (2006.01)
C23C 14/16 (2006.01)
C23C 14/34 (2006.01)
C23C 14/35 (2006.01)
C23C 14/54 (2006.01)
G21C 3/07 (2006.01)
G21C 21/02 (2006.01)
H01J 37/32 (2006.01)
H01J 37/34 (2006.01)

(31) FR2105207
(32) 19.05.2021
(33) FR

(85) 26.10.2023
(86) PCT/FR2022/050517, 21.03.2022

(71) ІДРОМЕКАНІК Е ФРОТМАН (FR)

(72) О Крістоф (FR), Віллар Максим (FR)

(54) СПОСІБ ОСАДЖЕННЯ ЩІЛЬНОГО ХРОМУ НА СУБСТРАТ

(57) 1. Спосіб осаджування матеріалу (М) на основі хрому з мішені на металевий субстрат (S) за допомогою безперервного магнетронного розпилення з використанням плазми (P), утвореної в газі, який відрізняється тим, що:

- співвідношення між потоком (φ_i) газових іонів, спрямованих в напрямку до субстрату (S), і потоком (φ_n) нейтральних атомів хрому, спрямованих в напрямку до субстрату, регулюють від 0,5 до 1,7; і

- до субстрату прикладають напругу зміщення від -50 В до -100 В.

2. Спосіб за п. 1, який відрізняється тим, що субстрат (S) містить цирконієвий сплав, а матеріал (М) на основі хрому осаджують на вказаний цирконієвий сплав і в контакт з ним.

3. Спосіб за п. 1 або п. 2, який відрізняється тим, що співвідношення між потоком (φ_i) газових іонів і потоком (φ_n) нейтральних атомів хрому становить від 0,7 до 1,5.

4. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що субстрат (S) піддають впливу напруги зміщення від -50 В до -80 В.

5. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що матеріал (М), осаджений на субстрат (S), утворює шар, що називають тонким шаром, який має товщину від 4 мкм до 20 мкм, переважно від 11 мкм до 17 мкм.

6. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що плазму (P) утворюють за допомогою мікрохвиль.

7. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що газ включає азот або азот і аргон, а матеріал (М) включає нітрид хрому.

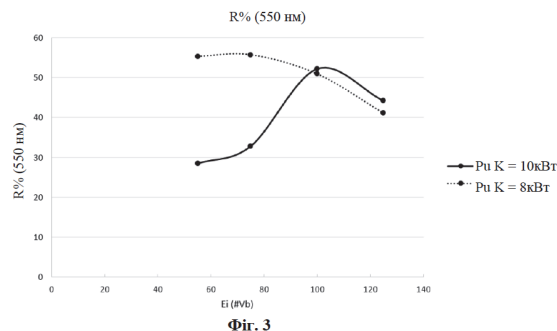
8. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що осадження виконують на декількох субстратах (S), при цьому субстрати (S) рухаються під час осадження в першому обертанні (r1), і переважно в двох комбінованих обертаннях (r1, r2) з паралельними осями, і ще більш переважно в трьох комбінованих обертаннях (r1, r2, r3) з паралельними осями.

9. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що субстрат (S) має довжину, яка в десять разів перевищує його ширину чи його висоту, або субстрат (S) має довжину, яка в десять разів перевищує його діаметр.

10. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що субстрат (S) являє собою трубку із зовнішнім діаметром менше ніж 40 мм і довжиною більше ніж 1 м.

11. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що включає попередній етап осаджування на субстрат (S) першого шару, який містить вольфрам, тантал, молібден, ванадій або гафній, призначеного для формування бар'єрного шару між субстратом (S) і матеріалом (М) на основі хрому.

12. Спосіб виготовлення оболонки ядерних тепловідільних елементів, яка містить металевий субстрат (S), покритий шаром, який містить матеріал (М) на основі хрому, який відрізняється тим, що спосіб включає етап осаджування вказаного матеріалу (М) на основі хрому з мішені на вказаний металевий субстрат (S) за допомогою безперервного магнетронного розпилення за будь-яким із пп. 1-11.



C 25

(21) а 2023 05837
(22) 24.01.2022

(51) МПК
C25C 3/08 (2006.01)

(31) 00522/21

(32) 10.05.2021

(33) CH

(85) 19.12.2023

(86) РСТ/ІВ2022/050595, 24.01.2022

(71) НОВАЛУМ С.А. (CH), ТОКАЙ КОБЕКС ГМБХ (DE)

(72) Спінетті Гуальтьєро (IT), фон Кенель Рене (CH),
Пфедфер Маркус (DE), Вера Гарсія Оскар (DE),
Мінкіна Маріуш (PL), Мельнік Северин (PL)**(54) КАТОДНИЙ СТРУМОПРИЙМАЛЬНИЙ СТРИЖЕНЬ
КОМІРКИ ДЛЯ ВИРОБНИЦТВА АЛЮМІНІЮ**

(57) 1. Комірка для виробництва алюмінію, що містить подовжений катодний струмоприймальний стрижень, що контактує із вуглецевим катодом, причому подовжений катодний струмоприймальний стрижень виготовлений із більш високо електропровідної міді або мідного сплаву, покритих на зверненій до катода поверхні або зі всіх сторін захисним сталевим шаром, який є більш механічно і хімічно стійким, ніж мідь або мідний сплав:

яка відрізняється тим, що

захисний сталевий шар є тонким, і його товщина відповідає мінімальній товщині шару, яка є достатньою для формування ефективного бар'єру дифузії для захисту міді або мідного сплаву від дифузії продуктів реакції, що утворюються на вуглецевому катоді під час роботи, причому:

об'ємне співвідношення міді або мідного сплаву до тонкого сталевого захисного шару становить принаймні 200 %, і переважно принаймні 300 % або більш переважно принаймні 400 %, тонкий захисний сталевий шар має товщину від 0,15 мм до 4 мм, і

тонкий захисний сталевий шар знаходиться у прямому або опосередкованому контакті із вуглецевим катодом.

2. Комірка за пунктом 1, причому тонкий захисний сталевий шар отриманий із вуглецевої сталі або легированої сталі.

3. Комірка за пунктом 2, причому тонкий захисний шар отриманий із низьковуглецевої сталі, сталі на основі хрому, сталі на основі нікелю або сталі на основі хрому та нікелю.

4. Комірка за одним із попередніх пунктів, причому товщина тонкого сталевого захисного шару становить від 1,5 мм до 3 мм.

5. Комірка за одним із попередніх пунктів, причому катодний струмоприймальний стрижень має циліндричним сердцевину із міді або мідного сплаву, і захисний тонкий сталевий шар являє собою трубку, яка притиснута до сердцевини із міді або мідного сплаву таким чином, що сердцевина із міді або мідного сплаву знаходиться у повному контакті із захисним ша-

ром для досягнення рівномірного тиску катодного струмоприймального стрижня на вугільний катод під час роботи.

6. Комірка за одним із попередніх пунктів, причому спочатку між міддю або мідним сплавом і захисним тонким сталевим шаром існує зазор, причому вказаний зазор є меншим, ніж теплове розширення сердцевини із міді або мідного сплаву.

7. Комірка за одним із пунктів 1-4, причому мідь або мідний сплав має вигляд стрижня прямокутного поперечного перерізу, який захищений на одній стороні, зверненій до катода, захисним тонким сталевим шаром.

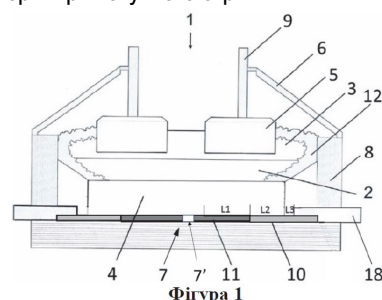
8. Комірка за одним із попередніх пунктів, причому захисний тонкий сталевий шар або необов'язкове попередньо нанесене більш тонке електропровідне верхнє або нижнє покриття, що не містить заліза, на захисному сталевому шарі знаходиться у прямому контакті із стінками гнізда у вуглецевому катоді.

9. Комірка за пунктом 8, причому захисний тонкий сталевий шар покритий додатковим верхнім шаром та/або нижнім шаром міді, нікелю та/або хрому та/або графітової фарби або шаром фольги.

10. Комірка за пунктом 9, причому додатковий верхній шар та/або нижній шар має товщину, що становить від 1 мкм до 1 мм.

11. Комірка за одним із пунктів 1-7, причому захисний тонкий сталевий шар, який необов'язково містить попередньо нанесене більш тонке електропровідне верхнє або нижнє покриття, що не містить заліза, знаходиться у контакті із вуглецевим катодом через електропровідний шар набивної подової маси, чавуну або клею.

12. Комірка за пунктом 1, 2, 3 або 4, причому мідь або мідний сплав має вигляд прямокутного стрижня, причому захисний тонкий сталевий шар нанесений на всі сторони прямокутного стрижня або на одну сторону прямокутного стрижня а, з боку, суміжного з покритою стороною, принаймні частково, вздовж двох інших сторін прямокутного стрижня.



Фігура 1

Розділ Е:

Будівництво

Е 04

(21) а 2023 04220 (51) МПК (2024.01)
 (22) 06.09.2023 E04B 1/00
 E04B 1/02 (2006.01)
 E04B 1/348 (2006.01)
 E04C 2/00
 E04H 1/00

(71) ОЗЕЙЧУК АНДРІЙ ЮРІЙОВИЧ (UA)

(72) Озейчук Андрій Юрійович (UA)

(54) БЕЗКАРКАСНИЙ БУДИНОК З СЕНДВІЧ-ПАНЕЛЕЙ

(57) 1. Безкаркасний будинок з сендвіч-панелей, який включає виконані з сендвіч-панелей щонайменше покрівлю і стіни, причому стіни з'єднані під кутом між собою, із підлогою, із покрівлею через кутові елементи, який **відрізняється** тим, що на стиках між кутовими елементами та сендвіч-панелями щонайменше з однієї сторони кутового елемента встановлено ущільнювальні засоби з пружного полімерного матеріалу, виконані з металу зовнішні стінки сендвіч-панелей з'єднані наповнювачем та мають товщину 0,3-0,8 мм або більше.
 2. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що підлога виконана з сендвіч-панелі.
 3. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що ущільнювальні засоби з пружного полімерного матеріалу виконані гідроізоляційними.
 4. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що ущільнювальні засоби з пружного полімерного матеріалу виконані гідроізоляційними та паронепроникними.
 5. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що ущільнювальні засоби з пружного полімерного матеріалу виконані як бутилкаучукова стрічка із клейовою основою.
 6. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що наповнювачем сендвіч-панелей, з яких виконані щонайменше стіни та підлога, є спінений матеріал, такий як пінополіуретан або пінополіізоціанурат.
 7. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що наповнювачем сендвіч-панелей, з яких виконані щонайменше стіни та підлога, є мінеральна вата.
 8. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що стіни з'єднані під кутом між собою, із підлогою, із стельовим перекриттям через зовнішні та внутрішні кутові елементи, які встановлені з зовнішньої та внутрішньої сторони відповідно кожної з щонайменше двох стін.
 9. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що щонайменше одна стіна виконана з щонайменше двох сендвіч-панелей, на стику між якими встановлено щонайменше один ущільнювальний засіб.
 10. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що сендвіч-панелі виконані із робочою частиною та замковою частиною для з'єднання сендвіч-панелей у одній площині, при цьому замкові частини виконані у вигляді попарно з'єднаних западин та виступів, між якими розташовані ущільнювальні засоби.

11. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що щонайменше одна зовнішня стінка щонайменше однієї сендвіч-панелі виконана профільованою.

12. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що включає стельове перекриття, виконане з щонайменше однієї сендвіч-панелі.

13. Безкаркасний житловий будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що включає щонайменше одну перегородку, виконану з щонайменше однієї сендвіч-панелі.

14. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що торцеві частини сендвіч-панелей, що стикаються під кутом, ззовні будинку закриті щонайменше зовнішнім захисним елементом.

15. Безкаркасний житловий будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що торцеві частини сендвіч-панелей, що стикаються під кутом у верху стін, ззовні будинку закриті внутрішнім захисним елементом у вигляді внутрішнього оцинкованого профілю та зовнішнім захисним елементом у вигляді зовнішнього профілю.

16. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що стіни унизу ззовні будинку закриті щонайменше зовнішнім захисним елементом у вигляді зовнішнього профілю із охопленням місця з'єднання стін із поверхнею, на якій встановлений будинок, такою, як поверхня фундаменту.

17. Безкаркасний житловий будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що крайові частини сендвіч-панелей, що стикаються під кутом, стягнуті кріпильними елементами, такими як болти та/або самонарізаючі гвинти, та/або шпильки, що пропущені від однієї до іншої зовнішньої стінки крізь наповнювач.

18. Безкаркасний житловий будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що крайові частини сендвіч-панелей, що стикаються під кутом, стягнуті кріпильними елементами, такими як болти та/або самонарізаючі гвинти, та/або шпильки, що пропущені від однієї до іншої зовнішньої стінки крізь встановлені на стику сендвіч-панелей ззовні та з внутрішньої сторони зовнішній та внутрішній кутові елементи відповідно та крізь наповнювач.

19. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що у місцях встановлення кріпильних елементів на сендвіч-панелі встановлені ущільнювальні засоби з пружного полімерного матеріалу.

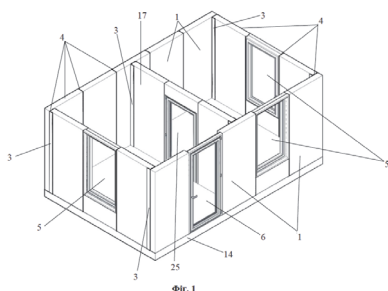
20. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що при виконанні покрівлі похилою між стінами та з'єднаними із ними ділянками покрівлі та/або з'єднаними протилежними похилими ділянками покрівлі наявний додатковий проміжний елемент, виконаний з теплоізоляційного матеріалу.

21. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що зовнішня сторона покрівлі вкрита покрівельною мембраною.

22. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що сендвіч-панелі виконані із робочою частиною та замковою частиною для з'єднання сендвіч-панелей у одній площині, при цьому замкові частини виконані у вигляді попарно з'єднаних западин та виступів, між якими розташовані ущільнювальні засоби, а через щонайменше одну замкову частину пропущено різьбовий засіб, верхня частина якого скрита виступом відповідної замкової частини.

23. Безкаркасний будинок по п. 1, який **відрізняється** тим, що всередині будинку сендвіч-панелі, що утворюють підлогу та/або стіну, та/або покрівлю мають

додаткове утеплювальне та/або ізолююче покриття та/або оздоблення.



Фиг. 1

(21) а 2022 04099
(22) 30.04.2021

(51) МПК (2024.01)
E04F 15/02 (2006.01)
E04F 21/00
E04F 21/18 (2006.01)
E04F 21/22 (2006.01)

(31) 102020000009568

(32) 30.04.2020

(33) IT

(85) 30.11.2022

(86) РСТ/IB2021/053609, 30.04.2021

(71) ДАКОТА ГРУП С.А.С. ДІ ЦЕНО ЧІПРІАНІ ЕНД К. (IT)

(72) Чіпріані Цено (IT)

(54) ВИРІВНЮВАЧ ПЛИТОК

(57) 1. Вирівнювач (10), придатний для використання користувачем для укладання та вирівнювання щонайменше двох суміжних плиток на підлозі, причому зазначений вирівнювач містить опору (12), яка виконана з можливістю обмеження під плитками, та притискне тіло (14), що розташоване над плитками та виконане з можливістю обмеження руху відносно опори (12) та з можливістю упору та притиснення упорною поверхнею щонайменше до однієї з щонайменше двох плиток; зазначена опора (12) містить основу (16), виконану з можливістю розміщення під щонайменше двома суміжними плитками, і різьбовий штифт (20), що проходить перпендикулярно основі, й який має різьблення; притискне тіло (14) містить елемент (22; 122) захвату та пристрій (26) вивільнення, розміщений в наскрізному отворі (42; 142), утвореному в елементі (26) захвату; елемент (22; 122) захвату має поздовжню центральну вісь та зовнішню бічну поверхню, яку користувач може захопити; пристрій (26) вивільнення містить перший елемент (28) взаємодії та другий елемент (28') взаємодії; перший елемент (28) взаємодії містить перше упорне тіло (68) та першу різьбову ділянку (76); другий елемент (28') взаємодії містить друге упорне тіло (68') та другу різьбову ділянку (76'); при цьому пристрій (26) вивільнення виконаний відповідно до першої конфігурації, в якій перша різьбова ділянка (76) та друга різьбова ділянка (76') звернені одна до одної, утворюючи єдину гайку з кроком, що відповідає кроку різьблення різьбового штифта (20), й у відповідності з другою конфігурацією, в якій при натисканні на перше упорне тіло (68) та друге упорне

тіло (68') перша різьбова ділянка (76) та друга різьбова ділянка (76') рознесені одна від одної; який відрізняється тим, що

перший елемент (28) взаємодії містить першу еластичну планку (78), а другий елемент (28') взаємодії містить другу еластичну планку (78'), причому у першій конфігурації перша еластична планка (78) впирається у перше упорне тіло (68), а друга еластична планка (78') впирається в друге упорне тіло (68'), і в другій конфігурації перша еластична планка (78) зігнута та натискає на друге упорне тіло (68'), а друга еластична планка (78') зігнута та натискає на перше упорне тіло (68).

2. Вирівнювач (10) за попереднім пунктом, у якому притискне тіло (14) містить гумове кільцеподібне тіло (30).

3. Вирівнювач (10) за одним із попередніх пунктів, у якому перший елемент (28) взаємодії містить перший язичок (80) з першим зубцем (82), а другий елемент (28') взаємодії містить другий язичок (80) з другим зубцем (82);

перший язичок (80) і другий язичок (80'), виконані з можливістю спиратися на площину (82) всередині наскрізного отвору (42; 142), перший зубець (82) та другий зубець (82') виконані з можливістю розміщення в гнізді, утвореному у площині (82) таким чином, щоб запобігти виходу пристрою (26) вивільнення з наскрізного отвору (42).

4. Вирівнювач (10) за одним із попередніх пунктів, у якому перше упорне тіло (68) та друге упорне тіло (68') мають ділянку, що має ту ж форму, що й ділянка наскрізного отвору (42; 142), в якому розміщений пристрій (26) вивільнення, так що перший елемент (28) взаємодії та другий елемент (28') взаємодії здатні виконати поступальне переміщення тільки всередині наскрізного отвору (42; 142).

5. Вирівнювач (10) за одним із попередніх пунктів, у якому перший елемент (28) взаємодії та/або другий елемент (28') взаємодії містять диск (72, 72'), що має ту ж форму перерізу, що й наскрізний отвір (42; 142).

6. Вирівнювач (10) за одним із попередніх пунктів, у якому притискне тіло (14) містить стаканчиковий елемент (24; 124), у якому елемент (22; 122) захвату містить перший з'єднувальний засіб (32; 132), а стаканчиковий елемент (24; 124) містить другий з'єднувальний засіб (50, 52; 152), так що за допомогою першого з'єднувального засобу (32; 132) та другого з'єднувального засобу (50, 52; 152) стаканчиковий елемент (24; 124) може бути з'єднаний під елементом (22; 122) захвату та може обертатися відносно елемента (22; 122) захвату.

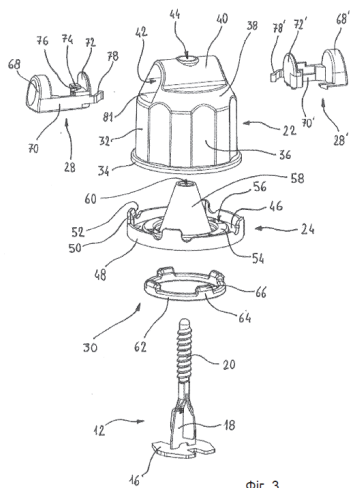
7. Вирівнювач (10) за попереднім пунктом, у якому гумове кільцеподібне тіло (30) з'єднане під стаканчиковим елементом (24).

8. Вирівнювач (10) за попереднім пунктом, у якому в стаканчиковому елементі (24) утворений щонайменше один наскрізний отвір (56), а кільцеподібне тіло (30) містить щонайменше один виступ (64) з V-подібним шліцом (66), так що виступ (64) може проходити через отвір (56), а V-подібний шліц (66), розташований за межами отвору (56), фіксує кільцеподібне тіло (30) на стаканчиковому елементі (24).

9. Вирівнювач (10) по одним із пп. 6-8, у якому стаканчиковий елемент (24; 124) містить у центрі порожнисте усичене конусоподібне тіло (58; 158), в якому зверху

утворений центральний отвір (60; 160), через який може проходити різьбовий штифт (20).

10. Вирівнювач по одним із пп. 6-9, у якому щонайменше один перший отвір (133, 135) утворений в елементі (122) захвату та щонайменше один паз (157) утворений у стаканчиковому елементі (124), так що через щонайменше один перший отвір (133, 135) і щонайменше один паз (157) можна бачити нижче стаканчиковий елемент (124) й елемент (122) захвату.



Фиг. 3

- (21) а 2023 04606 (51) МПК
(22) 24.02.2022 E04H 9/02 (2006.01)
- (31) 102021000004928
(32) 03.03.2021
(33) IT
(85) 02.10.2023
(86) РСТ/IB2022/051621, 24.02.2022
(71) АНТИСЕЙСМІКАМ СОЧЬЕТА А РЕСПОНСАБІЛІТА ЛІ-
МІТАТА (IT)
- (72) Борнето Алесандро (IT), Борнето Альберто (IT), Фог-
летта Стефано (IT), Борнето Андреа (IT)
- (54) СИСТЕМА ТА СПОСІБ ПОКРАЩЕННЯ АНТИСЕЙ-
СМІЧНИХ ТА ЕНЕРГЕТИЧНИХ ПОКАЗНИКІВ ІСНУ-
ЮЧИХ БУДІВЕЛЬ З КАРКАСНОЮ КОНСТРУКЦІЄЮ
ІЗ ЗАЛІЗОБЕТОНУ
- (57) 1. Система для поліпшення антисейсмічних та енер-
гетичних характеристик існуючої будівлі, що має карка-
сну конструкцію (10) із залізобетону з множиною пе-
риметральних колон (12) та множиною периметраль-
них балок (14), що перетинають одне одне у вузлових
периметральних ділянках (16), яка містить
- арматурну конструкцію (24, 26), що має сталеві арма-
турні пластини (24), розташовані з можливістю кріп-
лення на зовнішній поверхні зазначених вузлових пери-
метральних ділянок (16), та арматурні елементи (26),
виконані у вигляді елементів сталеві фермової ба-
лки, розташованих з можливістю кріплення на зовніш-
ній поверхні зазначених периметральних колон (12)
та зазначених периметральних балок (14), і
- зовнішню ізоляційну та оздоблювальну систему, що
має опорний каркас (52, 54), який несе вказана арма-
турна конструкція (24, 26) і утворена множиною верти-
кальних стійок (52) і множиною горизонтальних про-

філів (54), і множиною ізоляційних панелей (22), вста-
новлених на вказаному опорному каркасі (52, 54).

2. Система за п. 1, яка **відрізняється** тим, що кожна
з вказаних арматурних пластин (24) має отвори (24а),
розподілені по всій її поверхні, переважно відповідно
до розташування, симетричного щодо щонайменше
однієї осі, більш переважно відповідно до розташування,
симетричного відносно пари ортогональних осей, для
забезпечення можливості вставлення кріпильних еле-
ментів (28) для кріплення арматурної пластини (24) до
відповідної вузлової периметральної ділянки (16).

3. Система за п. 1 або п. 2, яка **відрізняється** тим,
що вказані арматурні пластини (24) мають прямокутну
форму і/або хрестоподібну форму і/або Т-подібну форму.

4. Система за будь-яким із попередніх пунктів, яка **від-
різняється** тим, що кожен із зазначених арматурних
елементів (26) містить перший поздовжній елемент
(36), що проходить уздовж по суті прямого напрямку,
другий поздовжній елемент (38), що проходить вздовж
по суті прямого напрямку, паралельного вказаному
першому поздовжньому елементу (36), та пару фігур-
них стрижнів (40), які проходять вздовж хвилеподібно-
го шляху, зокрема по суті синусоїдного шляху, зміще-
них відносно один одного, і кожен з яких з'єднаний як із
зазначеним першим поздовжнім елементом (36), так і
із зазначеним другим поздовжнім елементом (38) у ві-
дповідних протилежних пікових точках.

5. Система за п. 4, яка **відрізняється** тим, що кожен
із зазначених арматурних елементів (26) додатково
містить, щонайменше на одному зі своїх протилежних
поздовжніх кінців, торцеву пластину (34, 42), що має
отвори (34а, 42а) для вставлення анкерних кріпиль-
них елементів (28) для кріплення торцевої пластини
(34, 42) до однієї із зазначених периметральних ко-
лон (12) або однієї із зазначених периметральних
балок (14).

6. Система за п. 4 або п. 5, яка **відрізняється** тим, що
кожен із зазначених арматурних елементів (26) до-
датково містить множину втулкоподібних елементів (44),
розташованих у з'єднувальних ділянках між зазначе-
ним першим поздовжнім елементом (36) та зазначе-
ними фасонними стрижнями (40) і/або у з'єднувальних
ділянках між зазначеним другим поздовжнім елемен-
том (38) та зазначеними фасонними стрижнями (40)
для вставлення анкерних фіксуючих елементів (28)
для кріплення арматурного елемента (26) до однієї із
зазначених периметральних колон (12) або однієї із
зазначених периметральних балок (14).

7. Система за будь-яким із попередніх пунктів, яка **від-
різняється** тим, що вертикальні стійки (52) вказаної
опорної рами (52, 54) з'єднані з арматурними елеме-
нтами (26) вказаної арматурної конструкції (24, 26), і
в якій горизонтальні профілі (54) вказаної опорної ра-
ми (52, 54) з'єднані з вказаними вертикальними стій-
ками (52).

8. Система за будь-яким із попередніх пунктів, яка **від-
різняється** тим, що кожен з горизонтальних профілів
(54) вказаної опорної рами (52, 54) має бічну вертика-
льну стінку (54а), і в якій ізоляційні панелі (22) мають
щілини (60) на відповідних верхній і нижній сторонах для
вставлення вказаних бічних вертикальних стін (54а)
горизонтальних профілів (54).

9. Спосіб поліпшення антисейсмічних та енергетичних
характеристик існуючої будівлі, що має каркасну кон-
струкцію (10) із залізобетону з множиною периметра-

льних колон (12) та множиною периметральних балок (14), що перетинаються одне з одним у вузлових периметральних ділянках (16), який включає етапи:

а) приєднання сталевих арматурних пластин (24) до зовнішніх граней вузлових периметральних ділянок (16) вказаної каркасної конструкції (10) та приєднання арматурних елементів (26), виконаних у вигляді сталевих фермових балок, до зовнішніх граней периметральних колон (12) та периметральних балок (14) вказаної каркасної конструкції (10), вказані арматурні пластини (24) та вказані арматурні елементи (26) утворюють арматурну конструкцію (24, 26), призначену для підвищення антисейсмічної стійкості вказаної каркасної конструкції (10),

б) встановлення на вказаній арматурній конструкції (24, 26) опорної рами (52, 54), утвореної множиною вертикальних стоек (52) і множиною горизонтальних профілів (54), і

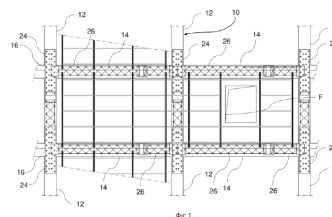
с) встановлення на вказаній опорній рамі (52, 54) множини ізоляційних панелей (22) для формування зовнішньої ізоляційної та оздоблювальної системи.

10. Спосіб за п. 9, який **відрізняється** тим, що арматурні пластини (24) та арматурні елементи (26) вказаної арматурної конструкції (24, 26) кріпляться на зовнішніх гранях вузлових периметральних ділянок (16) вказаної каркасної конструкції (10) та на зовнішніх гранях периметральних колон (12) та периметральних балок (14) вказаної каркасної конструкції (10) відповідно

за допомогою хімічних або механічних кріпильних елементів (28) анкерного типу.

11. Спосіб за п. 10, який **відрізняється** тим, що вертикальні стійки (52) вказаної опорної рами (52, 54) з'єднані з арматурними елементами (26) вказаної арматурної конструкції (24, 26) за допомогою тих самих анкерних кріпильних елементів (28), які використовуються для кріплення вказаних арматурних елементів (26) до периметральних балок (24) вказаної каркасної конструкції (10).

12. Спосіб за п. 10 або п. 11, який **відрізняється** тим, що ізоляційні панелі (22) встановлюють між парами вертикально суміжних горизонтальних профілів (54) вказаної опорної рами (52, 54) і з'єднують із вказаними горизонтальними профілями (54) шляхом вставлення бічних вертикальних стінок (54а) вказаних горизонтальних профілів (54) у щілини (60), передбачені на верхній та нижній сторонах ізоляційних панелей (22).



Розділ F:

**Машинобудування.
Освітлювання. Опалювання.
Зброя. Підrivні роботи**

F 04

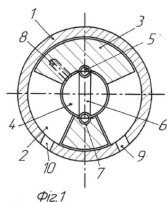
(21) а 2022 02954 (51) МПК (2024.01)
(22) 15.08.2022 F04C 3/00

(71) ІЗМАЛКОВ ГЕРМАН ІВАНОВИЧ (UA)

(72) Ізмалков Герман Іванович (UA)

(54) СФЕРИЧНА РОТОРНА МАШИНА

(57) Сферична роторна машина, що містить корпус у двох кільцевих робочих об'ємах якого знаходяться з можливістю ковзання деталі у вигляді частини кільця, які виконані на двох дисках, які жорстко зв'язані з валами, що знаходяться з можливістю обертання в корпусі по дузі 180° у кількості чотирьох з довжиною їхньої дуги $22,5^\circ$ з відстанями між ними по довжині дуги $22,5^\circ$ і при цьому одна крайня деталь знаходиться в початку цих 180° , а друга крайня деталь - на відстані до іншого краю цих 180° по тій довжині дуги $22,5^\circ$, вали жорстко зв'язані з однаковими зубчастими колесами, що знаходяться у зовнішньому зубчастому зчепленні, корпус має циліндричні виступи, які утворюють робочі об'єми і які мають вирізи з внутрішньою циліндричною поверхнею, в яких деталі у вигляді частини кільця мають можливість ковзання, ці деталі жорстко з'єднані платівкою, яка має можливість ковзання по циліндричній поверхні цього виступу, в корпусі є отвори, що всмоктують і нагнітають, в корпусі між цими дисками і зубчастими колесами є герметична перегородка, в якій вали мають можливість обертання, яка відрізняється тим, що додатково містить сферичний корпус, у двох кільцевих однакових з кутом 90° між їх основними площинами, що проходять по діаметру сферичної поверхні, робочих об'ємах знаходяться з можливістю ковзання поршневі деталі у вигляді частини кільця по дузі $70-140^\circ$, які зв'язані з кулею з центром у центрі сферичної поверхні кульками, які знаходяться з можливістю кочення в екваторіальній канавці кулі та з можливістю ковзання заглиблень посередині внутрішньої сферичної поверхні поршневих деталей, з можливістю обертання в корпусі радіально знаходиться вал в екваторіальній площині посередині між площинами робочих об'ємів і він жорстко зв'язаний з кулею, канавка на кулі має кут нахилу до осі валу $30-60^\circ$, робочі об'єми мають кут по радіусу між бічними поверхнями, що дорівнює $10-60^\circ$, в корпусі з робочих об'ємів є входні та вихідні отвори.



Фиг.1

F 16

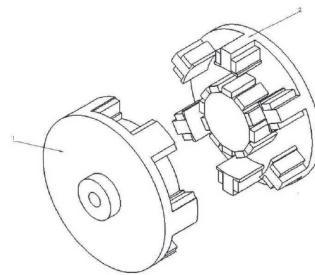
(21) а 2023 04581 (51) МПК (2024.01)
(22) 28.09.2023 F16D 27/00
F16D 29/00

(71) НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ "ЧЕРНІГІВСЬКА ПОЛІТЕХНІКА" (UA)

(72) Космач Олександр Павлович (UA), Ступак Олексій Валерійович (UA), Ковтун Іван Юрійович (UA), Степенко Сергій Анатолійович (UA)

(54) ЕНЕРГОЕФЕКТИВНА БЕЗКОНТАКТНА МУФТА ОБЕРТАННЯ

(57) Енергоефективна безконтактна муфта обертання, що складається з ведучої та веденої напівмуфт, які взаємодіють через попарно розташовані магніти в зовнішньому та внутрішньому контурах відрізняється тим, що встановлені додаткові магніти стандартного типу на зовнішньому та внутрішньому контурі, які збільшують передавальний момент обертання, а також наявні торцеві бурти в зовнішньому контурі пазів, що дозволяє додатково підвищити безконтактну взаємодію тим самим мінімізувати втрати на можливе механічне тертя та контакт, як наслідок збільшити енергоефективність передачі обертального руху.



Фиг.1

F 21

(21) а 2022 02992 (51) МПК (2024.01)
(22) 17.08.2022 F21S 10/00
F21S 10/06 (2006.01)
F21S 2/00
F21V 23/06 (2006.01)

(71) БІЛОУС НАЗАР БОРИСОВИЧ (UA)

(72) Білоус Назар Борисович (UA)

(54) ОСВІТЛЮВАЛЬНИЙ ПРИСТРІЙ

(57) 1. Освітлювальний пристрій, що містить раму зі світлонепроникними стінками, які утворюють щонайменше дві ізолювані одна від одної зони, щонайменше одне джерело освітлення, встановлене в щонайменше одній із ізолюваних зон, світлорозсіювальну плівку, що покриває верхню частину рами, і кришку, що покриває світлорозсіювальну плівку і виконана з можливістю щонайменше часткового пропускання світла від джерел освітлення, який відрізняється тим, що кришка з внутрішнього боку забезпечена виступами, у плівці виконані відповідні виступам отвори,

в стінках рами з боку їх верхніх граней виконані відповідні виступам заглиблення, при цьому виступи проходять крізь отвори у плівці у заглиблення у стінках рами, та щонайменше один з виступів з'єднаний зі стінкою рами.

2. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що заглиблення виконані на перетині стінок рами.

3. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що з'єднання між виступами та стінками рами забезпечене за допомогою ультразвукового зварювання.

4. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що щонайменше одне джерело освітлення встановлене в кожній із ізольованих зон.

5. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що виступи, які з'єднані зі стінками рами, розташовані у центральній частині кришки.

6. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що виступи, які з'єднані зі стінками рами, мають форму циліндрів, або паралелепіпедів, або конусів, або голчасту форму, при цьому отвори у плівці мають форму поперечних перерізів виступів.

7. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що щонайменше один з виступів, який не з'єднується з рамою,

має напівсферичну форму, при цьому отвори у плівці мають форму поперечних перерізів виступів.

8. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що виступи виконані різної форми.

9. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що виступи виконані різної ширини.

10. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що виступи виконані різної висоти.

11. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що виступи виконані однакової ширини.

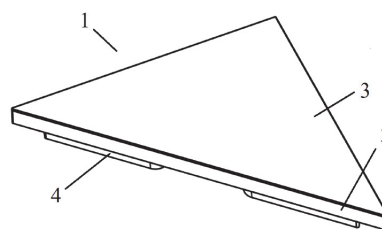


Fig. 1

Розділ G:

Фізика

G 01

(21) а 2023 04739 (51) МПК
(22) 10.03.2021 G01N 21/71 (2006.01)
G01J 3/443 (2006.01)
G01N 33/205 (2019.01)
G01N 33/202 (2019.01)

(85) 09.10.2023

(86) РСТ/ІВ2021/051976, 10.03.2021

(71) АРСЕЛОРМИТТАЛ (LU)

(72) Пікон Арцай (ES), Альварес Гіла Айтор (ES), Вісенте Рохо Асьєр (ES)

(54) СИСТЕМА ТА СПОСІБ ВИЗНАЧЕННЯ ХІМІЧНОГО СКЛАДУ РІДКИХ МЕТАЛУРГІЙНИХ ПРОДУКТІВ

(57) 1. Пристрій для визначення хімічного складу рідкого металургійного продукту (2), який випромінює електромагнітне випромінювання, причому цей пристрій містить, щонайменше:

- зонд (3) вибірки, виконаний з можливістю уловлювання електромагнітного випромінювання, яке випромінюється металургійним продуктом (2) в заданому діапазоні довжин хвиль $\Delta\lambda$,

- спектроскопічні інструментальні засоби (8), сполучені з зондом (3) вибірки і виконані з можливістю формування спектрального сигналу зазначеного захопленого електромагнітного випромінювання,

- засоби обробки даних, виконані з можливістю обчислення спостережуваної інтенсивності випромінювання $L_{\text{obs}}(\lambda, T_{\text{est}})$ на основі зазначеного сформованого спектрального сигналу, а також з можливістю оцінки температури T_{est} і спектральної випромінювальної здатності $\epsilon_{\text{est}}(\lambda, T_{\text{est}})$, металургійного продукту (2) в заданому діапазоні довжин хвиль $\Delta\lambda$ на основі зазначеної обчисленої спостережуваної інтенсивності випромінювання $L_{\text{obs}}(\lambda, T_{\text{est}})$,

при цьому зазначені засоби обробки даних містять базу даних з еталонною інтенсивністю випромінювання $L_{\text{ref}, i}(\lambda, T_{\text{ref}, n})$ від X зразків i , де i становить від 1 до X , в заданому діапазоні довжин хвиль $\Delta\lambda$ і Z еталонних температур $T_{\text{ref}, n}$, де n становить від 1 до Z , причому для кожного еталона інтенсивності випромінювання база даних містить:

- еталонні спектральні випромінювальні здатності $\epsilon_{\text{ref}, i}(\lambda, T_{\text{ref}, n})$ асоційовані з еталонними температурами $T_{\text{ref}, n}$ в зазначеному заданому діапазоні довжин хвиль $\Delta\lambda$ і

- хімічний склад зазначених зразків,

причому засоби обробки даних виконані з можливістю порівняння оціненої спектральної випромінювальної здатності $\epsilon_{\text{est}}(\lambda, T_{\text{est}})$ і оціненої температури T_{est} з еталонними температурами $T_{\text{ref}, n}$ і еталонною спектральною випромінювальною здатністю $\epsilon_{\text{ref}, i}(\lambda, T_{\text{ref}, n})$ в заданому діапазоні довжин хвиль $\Delta\lambda$ і при оціненій температурі T_{est} , включеній в зазначену базу даних, визначати еталонну інтенсивність випромінювання $L_{\text{bf}}(\lambda, T_{\text{ref}})$, яка найбільше узгоджується із спостереженою інтенсивністю випромінювання $L_{\text{obs}}(\lambda, T_{\text{est}})$,

і з можливістю визначення хімічного складу рідкого металургійного продукту (2) на основі зазначених певних еталонів інтенсивності випромінювання, яка найкраще узгоджується з еталонною інтенсивністю $L_{\text{bf}}(\lambda, T_{\text{ref}})$.

2. Пристрій (1) за п. 1, в якому спектроскопічні інструментальні засоби (8) містять сукупність спектрометрів (9, 10, 11), кожен з яких сполучений із зондом (3) вибірки і виконаний з можливістю формування частини спектрального сигналу на певному інтервалі заданого діапазону довжин хвиль $\Delta\lambda$.

3. Пристрій (1) за пп. 1-2, в якому спектроскопічні інструментальні засоби (8) виконані з можливістю формування спектрального сигналу в спектральному діапазоні від 200 до 12000 нм, який відповідає заданому діапазону довжин хвиль $\Delta\lambda$.

4. Пристрій (1) за будь-яким з пп. 1-4, в якому засоби обробки даних виконані також з можливістю коригування кожної частини спектрального сигналу, щонайменше, з допомогою калібрувальної константи, яка обчислюється з використанням зазначених засобів обробки даних і асоційована з розглядуваним спектрометром (9, 10, 11).

5. Спосіб визначення хімічного складу рідкого металургійного продукту (2), який випромінює електромагнітне випромінювання, з використанням пристрою (1) за будь-яким з пп. 1-4, який включає стадії, на яких:

i. уловлюють (E1) електромагнітне випромінювання, яке випромінюється металургійним продуктом (2) в заданому діапазоні довжин хвиль $\Delta\lambda$;

ii. формують спектральний сигнал (E2) шляхом розділення і вимірювання спектральних компонентів зазначеного електромагнітного випромінювання, яке випромінюється металургійним продуктом (2);

iii. формують спостережувану інтенсивність випромінювання $L_{\text{obs}}(\lambda, T_{\text{est}})$ (E3) металургійного продукту (2) на основі зазначеного спектрального сигналу;

iv. оцінюють (E4) температуру T_{est} і спектральну випромінювальну здатність, $\epsilon_{\text{est}}(\lambda, T_{\text{est}})$ в зазначеному заданому діапазоні довжин хвиль металургійного продукту (2) на основі зазначеної спостережуваної інтенсивності випромінювання $L_{\text{obs}}(\lambda, T_{\text{est}})$;

v. порівнюють (E5) зазначену оцінену спектральну випромінювальну здатність, $\epsilon_{\text{est}}(\lambda, T_{\text{est}})$ і температуру T_{est} з еталонною спектральною випромінювальною здатністю $\epsilon_{\text{ref}, i}(\lambda, T_{\text{ref}})$ і еталонною температурою T_{ref} кожного еталона інтенсивності випромінювання $L_{\text{ref}, i}(\lambda, T_{\text{ref}})$ з бази даних;

vi. визначають еталонну інтенсивність випромінювання $L_{\text{bf}}(\lambda, T_{\text{ref}})$ (E6), яка найкраще узгоджується з спостережуваною інтенсивністю випромінювання $L_{\text{obs}}(\lambda, T_{\text{est}})$; і

vii. визначають хімічний склад (E7) зазначеного випромінюючого металургійного продукту (2).

6. Спосіб за п. 5, в якому на стадії iv (E4) також оцінюють коефіцієнт послаблення атмосфери виходячи з інтенсивності спостережуваного випромінювання при цьому зазначена спостережувана інтенсивність випромінювання корелює із зазначеним коефіцієнтом послаблення.

7. Спосіб за пп. 5-6, в якому на стадії iii (E3) виконують підстадії, на яких:

- перетворюють спектральний сигнал на ідеальну інтенсивність випромінювання абсолютно чорного тіла, $L_{\text{BB}}(\lambda, T)$;

- коригують зазначену ідеальну інтенсивність випромінювання $L_{\text{вв}}(\lambda, T)$, щонайменше, з допомогою калібрувальної константи, обчисленої з використанням засобів обробки даних і асоційованої із спектроскопічними інструментальними засобами (8), при цьому зазначену калібрувальну константу обчислюють з використанням калібрувальної лампи з відомою температурою випромінювання і відомою випромінювальною здатністю в зазначеному діапазоні довжин хвиль.

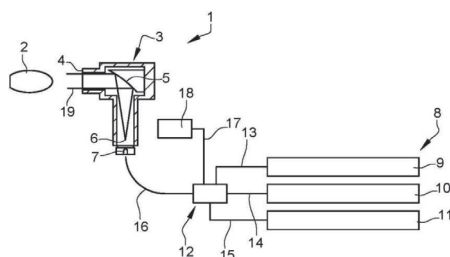
8. Спосіб за п. 7, в якому на стадії iv (E4) виконують підстадії, на яких:

- визначають вектор, координати якого є випадково обраними змінними, які представляють щонайменше температуру випромінювання і випромінювальну здатність в зазначеному діапазоні довжин хвиль;
- обчислюють очікувану інтенсивність випромінювання $L_{\text{exp}}(\lambda, T)$ на основі вибраних змінних;
- підбирають імовірнісну модель виведення шляхом порівняння спостережуваної інтенсивності випромінювання і очікуваної інтенсивності випромінювання, щоб змінювати випадковим чином очікувану дисперсію, за допомоги випадкової зміни зазначених вибраних змінних до досягнення збіжності очікуваної інтенсивності випромінювання $L_{\text{exp}}(\lambda, T)$ до зазначеної інтенсивності спостережуваного випромінювання $L_{\text{obs}}(\lambda, T_{\text{est}})$;
- оцінюють температуру випромінювання T_{est} і спектральну випромінювальну здатність $\epsilon_{\text{est}}(\lambda, T_{\text{est}})$ в зазначеному діапазоні довжин хвиль $\Delta\lambda$ рідкого металургійного продукту (2) з використанням зазначеної підбраної імовірнісної моделі виведення.

9. Спосіб за п. 8, в якому одна з координат зазначеного вектора представляє коефіцієнт послаблення атмосфери, причому зазначений коефіцієнт послаблення оцінюють також з використанням підбраної імовірнісної моделі виведення.

10. Спосіб за пп. 8-9, в якому на стадії iv (E4) використовують скорочений набір довжин хвиль, які визначають, виходячи із зазначеного діапазону довжин хвиль із застосуванням трикутної передавальної функції.

11. Спосіб за будь-яким з пп. 5-10, в якому на стадіях v-vii (E5-E7) використовують багатшаровий перцептрон, який реалізується за допомоги засобів обробки даних.



Фіг. 1

G 06

(21) а 2022 03018
(22) 19.08.2022

(51) МПК (2024.01)
G06Q 20/18 (2012.01)
G06Q 40/02 (2023.01)
G07F 11/00
G07F 19/00

(71) МОНАШОВ СЕРГІЙ ЄВГЕНОВИЧ (UA), ЯКІБЧУК МИРОСЛАВ ІЛЛІЧ (UA), МОЗЛІ ФРЕД М. (US), ПАНОВ МИХАЙЛО ВІКТОРОВИЧ (UA)

(72) Монашов Сергій Євгенович (UA), Якібчук Мирослав Ілліч (UA), Мозлі Фред М. (US), Панов Михайло Вікторович (UA)

(54) МОДУЛЬ РЕАЛІЗАЦІЇ ДОРОГОЦІННИХ МЕТАЛІВ ТА СПОСІБ ПРОДАЖУ ДОРОГОЦІННИХ МЕТАЛІВ ЗА ДОПОМОГОЮ МОДУЛЯ

(57) 1. Модуль реалізації дорогоцінних металів який складається:

з апаратного блоку С, який оснащений диспенсером зберігання та видачі сертифікованих зливків, першого програмного блоку А з вбудованою комунікаційною шиною даних Plug&Play з підтримкою MDB, виконаною з можливістю підключення апаратного блоку до пристрою самообслуговування, який інтегрований з омніканальною системою надання фінансових та/або банківських послуг, яка містить засоби автоматичної ідентифікації клієнта, з'єднані з базами даних провайдерів фінансових та/або банківських послуг, та єдину інтеграційну платформу підключення до щонайменше двох провайдерів фінансових та/або банківських послуг з можливістю вибору та активації серед них ліцензованих на продаж дорогоцінного металу, другого програмного блоку В взаємодії пристрою самообслуговування через протокол REST API з єдиною інтеграційною платформою омніканальної системи, з утворенням каналу сервісу продажу дорогоцінного металу через протокол ISO 8583 з процесинговим центром провайдера фінансових та/або банківських та/або через запит до автоматизованої банківської системи (АБС) провайдера фінансових та/або банківських послуг по захищеному каналу зв'язку або через API протокол;

та третього програмного блоку Д, монолітне ядро якого містить компоненти забезпечення взаємодії між програмними блоками та апаратним блоком в єдиному адресному просторі, з можливістю здійснення фінансової транзакції з обраного джерела оплати.

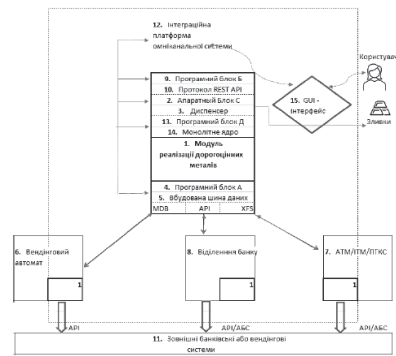
2. Спосіб реалізації дорогоцінних металів за допомогою модуля, який інтегрований з омніканальною системою надання фінансових та/або банківських послуг, який включає

етап запити наявності сертифікованого зливка в диспенсері апаратного блоку С від третього програмного блоку Д за допомогою першого програмного блоку А по комунікаційній шині до апаратного блоку С, встановленого в апараті самообслуговування, ідентифікацію користувача шляхом безконтактного зчитування (NFC) та/або зчитування банківської карти та/або введення номеру телефону (MSISDN) через інтерфейс апарату самообслуговування;

етап підтвердження можливості покупки шляхом обробки персональних даних користувача та відправки запиту від третього програмного блоку Д через другий програмний блок В до інтеграційної платформи омніканальної системи через протокол ISO 8583 до процесингового центру та/або через запит до автоматизованої банківської системи (АБС) провайдера фінансових та/або банківських послуг по захищеному каналу зв'язку або через API протокол;

етап здійснення в омніканальній системі перевірки доступності провайдерів фінансових та/або банківських послуг, вибору серед них ліцензованих на продаж

дорогоцінного металу, отримання відповіді від зовнішніх банківських систем та надсилання до третього програмного блоку Д запиту на формування транзакційного коду через другий програмний блок В; етап формування третім програмним блоком Д коду авторизації на продаж після отримання підтвердження транзакційних даних користувача з особового рахунку або внесенням готівкових грошей або проведенням онлайн транзакції картою платіжних систем, і направлення його в омніканальну систему через другий програмний блок В; етап виклику третім програмним блоком Д через перший програмний блок А в апаратному блоці С процедури видачі сертифікованого зливка шляхом передачі після отримання від омніканальної системи коду підтвердження транзакції.



Фіг. 1

Розділ Н:

Електрика

Н 02

(21) а 2023 05058 (51) МПК (2024.01)
 (22) 25.02.2022 H02J 7/00
 A24F 40/40 (2020.01)
 A24F 40/50 (2020.01)
 A24F 40/65 (2020.01)

(31) 2021-079893
 (32) 10.05.2021
 (33) JP
 (85) 01.02.2024
 (86) РСТ/JP2022/007916, 25.02.2022
 (71) ДЖАПАН ТОБАККО ІНК. (JP)

(72) Аояма Тацунарі (JP), Каванаґо Хіросі (JP), Наґахама Тору (JP), Фудзікі Такасі (JP), Йосіда Ріо (JP)

(54) БЛОК ДЖЕРЕЛА ЖИВЛЕННЯ ПРИСТРОЮ ГЕНЕРУВАННЯ АЕРОЗОЛЮ

(57) 1. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолю, що містить:
 джерело живлення;
 конектор нагрівача, до якого підключений нагрівач, сконфігурований з можливістю нагрівання джерела аерозолю шляхом споживання енергії, що подається від джерела живлення;
 перший датчик, розташований поблизу нагрівача або джерела живлення і сконфігурований з можливістю виведення значення, пов'язаного з температурою нагрівача, або значення, пов'язаного з температурою джерела живлення; та
 другий датчик, розташований у положенні, відокремленому від першого датчика, і сконфігурований з можливістю виведення значення, пов'язаного з температурою в даному положенні, при цьому
 коли принаймні одне з вихідного значення першого датчика та вихідного значення другого датчика є аномальним, принаймні одне або обидва із заряджання джерела живлення та розряджання джерела живлення нагрівача тимчасово заборонені.
 2. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолю за п. 1, який додатково містить:
 мікроконтролер (MCU), сконфігурований з можливістю керування поданням енергії від джерела живлення до нагрівача, причому
 коли вихідне значення першого датчика є аномальним, перше керування захистом для заборони одного або обох заряджання та розряджання забезпечено без використання MCU, і
 коли вихідне значення другого датчика є аномальним, друге керування захистом для заборони одного або обох заряджання та розряджання забезпечено без використання MCU.
 3. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолю за п. 2, в якому
 перезапуск MCU є необхідним для припинення першого керування захистом, і
 перезапуск MCU є необхідним для припинення другого керування захистом.

4. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолю за п. 2 або 3, в якому
 блок джерела живлення має декілька режимів, і
 у режимі, в якому одне із першого керування захистом та другого керування захистом не є задіяним серед множини режимів, а є задіяним інший режим, ніж перше керування захистом та друге керування захистом.
 5. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолю за п. 4, який додатково містить:
 корпус, що утворює поверхню блоку джерела живлення, в якому
 перший датчик, який розташований поблизу джерела живлення та сконфігурований з можливістю виведення значення, пов'язаного з температурою джерела живлення,
 другий датчик розташований поблизу корпусу та сконфігурований з можливістю виведення значення, пов'язаного з температурою корпусу, і
 у режимі, в якому друге керування захистом не є задіяним серед множини режимів, перше керування захистом є задіяним.
 6. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолю за п. 5,
 в якому перше керування захистом є задіяним у всіх режимах.
 7. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолю за будь-яким одним із пп. 1-6, який додатково містить:
 MCU, сконфігурований з можливістю керування подачею енергії від джерела живлення до нагрівача, в якому MCU сконфігурований з можливістю:
 коли вихідне значення першого датчика є аномальним, виконувати третє керування захистом для заборони одного або обох заряджання та розряджання; і
 коли вихідне значення другого датчика є аномальним, виконувати четверте керування захистом для заборони однієї або обох операцій заряджання та розряджання.
 8. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолю за п. 7, який відрізняється тим, що, MCU сконфігурований з можливістю:
 коли вихідне значення першого датчика є нормальним, припиняти третє керування захистом; і
 коли вихідне значення другого датчика є нормальним, припиняти четверте керування захистом.
 9. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолю за будь-яким одним із пп. 1-6, який додатково містить:
 корпус, що утворює поверхню блоку джерела живлення; і
 MCU, сконфігурований з можливістю керування подачею енергії від джерела живлення до нагрівача, в якому перший датчик розташований поблизу джерела живлення та сконфігурований з можливістю виведення значення, пов'язаного з температурою джерела живлення,
 другий датчик розташований поблизу корпусу та сконфігурований з можливістю виведення значення, пов'язаного з температурою корпусу,
 MCU сконфігурований з можливістю:
 отримання температури джерела живлення на основі вихідного значення першого датчика;
 отримання температури корпусу на основі вихідного значення другого датчика;

коли температура джерела живлення дорівнює або перевищує перше порогове значення, визначення, що вихідне значення першого датчика є аномальним, і виконання третього керування захистом для заборони однієї або обох операцій заряджання та розряджання; та

коли температура корпусу дорівнює або перевищує друге порогове значення, визначення, що вихідне значення другого датчика є аномальним, і виконання четвертого керування захистом для заборони однієї або обох операцій заряджання та розряджання, причому перше порогове значення відрізняється від другого порогового значення.

10. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолі за п. 9, в якому перше порогове значення перевищує друге порогове значення.

11. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолі за будь-яким одним із пп. 1-6, який додатково містить:

корпус, що утворює поверхню блоку живлення; та MCU, сконфігурований з можливістю керування подачею енергії від джерела живлення до нагрівача, при цьому

перший датчик розташований поблизу джерела живлення та сконфігурований з можливістю виведення значення, пов'язаного з температурою джерела живлення, другий датчик розташований поблизу корпусу та сконфігурований з можливістю виведення значення, пов'язаного з температурою корпусу, MCU сконфігурований з можливістю:

отримання температури джерела живлення на основі вихідного значення першого датчика;

отримання температури корпусу на основі вихідного значення другого датчика;

коли температура джерела живлення дорівнює або перевищує перше порогове значення, визначення, що вихідне значення першого датчика є аномальним, і виконання третього керування захистом для заборони одного або обох операцій заряджання та розряджання;

коли температура джерела живлення дорівнює або нижче, ніж друге порогове значення, яке є меншим, ніж перше порогове значення, після виконання третього контролю захистом, визначення, що вихідне значення першого датчика є нормальним, і припинення третього керування захистом;

коли температура корпусу дорівнює або перевищує третє порогове значення, визначення, що вихідне значення другого датчика є аномальним, і виконання четвертого керування захистом для заборони одного або обох операцій заряджання та розряджання; та

коли температура корпусу стає рівною або нижчою за четверте порогове значення, яке є меншим за третє порогове значення після виконання четвертого контролю захистом, визначення, що вихідне значення другого датчика є нормальним, і припинення четвертого керування захистом, і значення, отримане відніманням другого порогового значення від першого порогового значення, відрізняється від значення, отриманого відніманням четвертого порогового значення від третього порогового значення.

12. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолі за п. 11, в якому значення, отримане від-

німанням другого порогового значення від першого порогового значення, більше, ніж значення, отримане відніманням четвертого порогового значення від третього порогового значення.

13. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолі за будь-яким одним із пп. 1-12, який додатково містить:

корпус, що утворює поверхню блоку живлення; та MCU, сконфігурований з можливістю керування подачею енергії від джерела живлення до нагрівача, при цьому

перший датчик розташований поблизу джерела живлення та сконфігурований з можливістю виведення значення, пов'язаного з температурою нагрівача, другий датчик розташований поблизу корпусу та сконфігурований з можливістю виведення значення, пов'язаного з температурою корпусу,

коли вихідне значення першого датчика є аномальним, п'яте керування захисту для заборони одного або обох заряджання та розряджання здійснено без використання MCU,

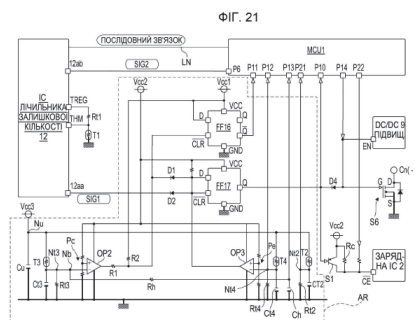
MCU сконфігурований з можливістю виконання шостого керування захистом для заборони одного або обох заряджання та розряджання, коли вихідне значення другого датчика є аномальним, блок джерела живлення виконаний з можливістю функціонування в декількох режимах, і

у режимі, в якому шосте керування захистом не є задіяним серед множини режимів, задіяно п'яте керування захистом.

14. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолі за п. 13, в якому

множина режимів включає режим нагрівання, в якому енергія подається від джерела живлення до нагрівача, сплячий режим та режим попереднього нагрівання для переходу зі сплячого режиму в режим нагрівання, та

шосте керування захистом є задіяним лише в режимі попереднього нагрівання серед режиму нагрівання та режиму попереднього нагрівання.



(21) а 2023 05086
(22) 01.03.2022

(51) МПК (2024.01)
H02J 7/00
A24F 40/40 (2020.01)

(31) 2021-079911
(32) 10.05.2021
(33) JP

(85) 26.01.2024
(86) PCT/JP2022/008591, 01.03.2022
(71) ДЖАПАН ТОБАККО ИНК. (JP)

(72) Аояма Тацунарі (JP), Каванаґо Хіросі (JP), Наґахама Тору (JP), Фудзікі Такасі (JP), Йосіда Ріо (JP)

(54) БЛОК ДЖЕРЕЛА ЖИВЛЕННЯ ПРИСТРОЮ ГЕНЕРУВАННЯ АЕРОЗОЛЮ

(57) 1. Блок джерела живлення пристрою генерування аерозолю, нагрівальний блок якого виконаний з можливістю приєднання або від'єднання від цього пристрою, що містить вторинну батарею; корпус, що утворює поверхню блоку джерела живлення; шасі, розміщене у внутрішньому просторі корпусу і виготовлене з ізоляційної смоли; множину магнітів, що закріплені на шасі із зазором між ними; внутрішній елемент, що примикає до бокової поверхні шасі; та зовнішній елемент, що примикає до зовнішньої поверхні внутрішнього елемента, при цьому внутрішній елемент включає в себе множину наскрізних отворів, які налаштовані для проходження в них множини магнітів, а зовнішній елемент виконаний з можливістю знімного встановлення з допомогою множини магнітів, що проходять через множину наскрізних отворів.

2. Блок джерела живлення за п. 1, в якому нагрівальний блок сконфігурований для забезпечення взаємодії індукційної нагрівальної котушки та токоприймача, вбудованого в приєднаний стік.

3. Блок джерела живлення за п. 1, в якому шасі включає в себе основний корпус шасі, який утримує множину магнітів, і пластинчасту перегородку, яка розташована перпендикулярно до основного корпусу шасі та виконана простягнутою у подовженому напрямку основного корпусу шасі, а вторинну батарею розміщено в зоні розміщення джерела живлення, визначеній корпусом і перегородкою.

4. Блок джерела живлення за п. 3, який додатково містить:

зону розміщення нагрівального блоку, визначену на стороні, протилежній зоні розміщення джерела живлення з перегородкою, причому нагрівальний блок роз'ємно встановлений у зоні розміщення нагрівального блоку.

5. Блок джерела живлення за п. 3 або 4, який додатково містить:

блок мікроконтролера (MCU); монтажну плату, на якій встановлений MCU; і зону розміщення плати, визначену на стороні, протилежній зоні розміщення джерела живлення з перегородкою, причому

монтажну плату, на якій встановлено MCU, розміщено в зоні розміщення плати.

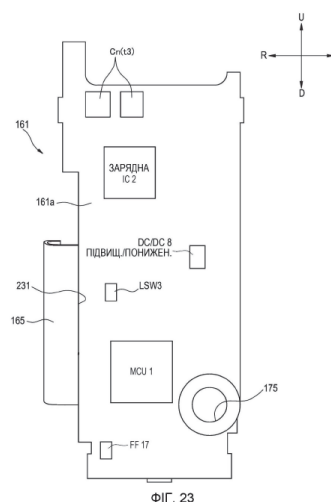
6. Блок джерела живлення за п. 5, який додатково містить:

зарядний блок, сконфігурований з можливістю отримання енергії від зовнішнього джерела живлення для заряджання вторинної батареї; і монтажну плату із зарядним блоком, яка відокремлена від монтажної плати, на якій встановлено MCU, і на якій встановлено зарядний блок.

7. Блок джерела живлення за п. 6, який додатково містить:

операційний перемикач, керований користувачем; множину світлодіодів; і монтажну плату зі світлодіодами, яка відокремлена від монтажної плати, на якій встановлено MCU та від монтажної плати із зарядним блоком, і на якій встановлено операційний перемикач і множину світлодіодів.

8. Блок джерела живлення за п. 7, в якому один кінець операційного перемикача з'єднаний із заземленням на монтажній платі зі світлодіодами.



(21) а 2023 05371
(22) 10.11.2023

(51) МПК (2024.01)
H02M 7/00
H02M 7/162 (2006.01)

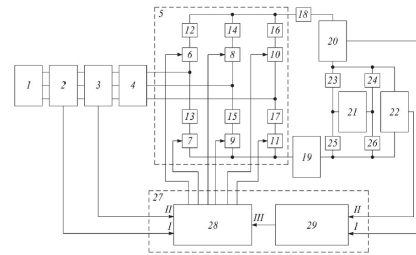
(71) УКРАЇНСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ УНІВЕРСИТЕТ ЗАЛІЗНИЧНОГО ТРАНСПОРТУ (UA)

(72) Нерубацький Володимир Павлович (UA), Плахтій Олександр Андрійович (UA), Гордієнко Денис Анатолійович (UA)

(54) ТРИФАЗНИЙ ДВОНАПРАВЛЕНИЙ ПЕРЕТВОРЮВАЧ ЗАРЯДУ-РОЗРЯДУ ПОТУЖНИХ ЛІТІЙ-ІОННИХ НАКОПИЧУВАЧІВ З РЕЖЕКТОРНИМ ФІЛЬТРОМ

(57) Трифазний двонаправлений перетворювач заряду-розряду потужних літій-іонних накопичувачів з режекторним фільтром, який живиться від трифазного джерела живлення та відрізняється тим, що складається з датчика трифазної вхідної напруги, датчика трифазних вхідних струмів, вхідного фільтра, до складу якого входять три вхідні дроселі і три конденсатори, трифазного мостового інвертора струму, зібраного на шести IGBT- або MOSFET-транзисторах та шести послідовних діодах, вихідного буферного реактора випрямляча, режекторного фільтра, до складу якого входять дросель та конденсатор, датчика вихідного струму, накопичувача, датчика вихідної напруги, чотирьох контакторів зміни полярності та системи керування, до складу якої входять контролер керування ключами та регулятор струму та напруги заряду батареї, при цьому вихідний сигнал датчика трифазної вхідної напруги подається на перший вхід контролера керування ключами, вихідний сигнал датчика

трифазних вхідних струмів подається на другий вхід контролера керування ключами, вихідний сигнал датчика вихідного струму подається на перший вхід регулятора струму та напруги заряду батареї, вихідний сигнал датчика вихідної напруги подається на другий вхід регулятора струму та напруги заряду батареї, вихідний сигнал регулятора струму та напруги заряду батареї подається на третій вхід контролера керування ключами, вихідні сигнали контролера керування ключами подано до трифазного мостового інвертора струму та керують шістьма силовими транзисторами.



Фіг. 2

ВІДОМОСТІ ПРО ДЕРЖАВНУ РЕЄСТРАЦІЮ ВИНАХОДІВ

Розділ А:

Життєві потреби людини

A 01

(11) 127948 (51) МПК
A01C 5/06 (2006.01)
A01C 7/20 (2006.01)

(21) а 2020 06462 (22) 06.03.2019
(24) 22.02.2024
(31) 1852063
(32) 09.03.2018
(33) FR
(86) РСТ/EP2019/055580, 06.03.2019
(72) Андре Крістоф (FR)
(73) КЮН САС
4, Impasse des Fabriques, 67700 Saverne, France (FR)

(54) ВИСІВНИЙ АПАРАТ, ЯКИЙ МІСТИТЬ РЕГУЛЬОВАНИЙ УЩІЛЬНЮВАЛЬНИЙ ОРГАН, І ВІДПОВІДНА СІВАЛКА

(57) 1. Висівний апарат сільськогосподарської машини, який містить раму (19), на якій встановлені орган розподілу насіння (23) і ущільнювальний пристрій (29), при цьому ущільнювальний пристрій (29) розташований позаду виходу (25) органа розподілу насіння (23) і знаходиться на одній лінії з ним у напрямку руху посівного апарата під час роботи, при цьому ущільнювальний пристрій (29) містить регулювальний пристрій (30) і ущільнювальний орган (33), причому ущільнювальний орган (33) містить колісну стійку (36) і ущільнююче колесо (330), що пересувається по дну борозни (4), виконаний з можливістю діяти на дно борозни ущільнювальною силою (F_{RD}, F_{RN}, F_{RL}) щонайменше в одному робочому положенні регульовального пристрою (30), який відрізняється тим, що зазначене щонайменше одне робоче положення регульовального пристрою (30) є положенням розвантаження, в якому регулювальний пристрій (30) діє на ущільнювальний орган (33) розвантажувальним зусиллям (F_D), протилежним вазі (P) ущільнювального органа (33), при цьому регулювальний пристрій (30) містить важіль (35) керування, причому нижня частина важеля (35) керування встановлена на поворотній осі (42) колісної стійки (36) ущільнюючого органа (33), а верхня частина важеля керування (35) містить щонайменше один штифт (41), виконаний з можливістю заходження щонайменше в один отвір (51-55), утворений в пластині (32), жорстко встановленій на рамі (19).

2. Висівний апарат за п. 1, в якому регулювальний пристрій (30) містить пружний з'єднувальний орган (37), виконаний з можливістю діяти розвантажувальним зусиллям (F_D) на ущільнювальний орган (33) в положенні розвантаження.

3. Висівний апарат за п. 1 або 2, в якому положення важеля (35) керування визначає розвантажувальне зусилля (F_D), яким пружний з'єднувальний орган (37) діє на ущільнювальний орган (33) в положенні розвантаження.

4. Висівний апарат за п. 1, в якому щонайменше один отвір (51-55) і щонайменше один штифт (41) виконані з можливістю утримання з'єднання один з одним в положенні розвантаження ущільнювального пристрою (30).

5. Висівний апарат за п. 1, в якому щонайменше один штифт (41) відповідає за формою вказаному щонайменше одному отвору (51-55).

6. Висівний апарат за будь-яким з пп. 2-4, в якому пружний з'єднувальний орган (37) містить торсіонну трубу, пружину розтягування, пружину стискування або торсіонну пружину.

7. Висівний апарат за будь-яким з пп. 1-6, в якому регулювальний пристрій (30) виконаний з можливістю займати кілька робочих положень, при цьому одне з робочих положень є зазначеним положенням розвантаження.

8. Висівний апарат за п. 6, в якому регулювальний пристрій (30) виконаний з можливістю займати положення ущільнення, в якому щонайменше одна сила ущільнення ущільнювального органа (33) є результатом застосування вертикального зусилля до ущільнювального органа (33) пружним з'єднувальним органом (37), і/або регулювальний пристрій (30) виконаний з можливістю займати нейтральне положення ущільнення, в якому сила нейтрального ущільнення ущільнювального органа (33) є виключно результатом дії власної ваги ущільнювального органа (33).

9. Висівний апарат за п. 6, в якому регулювальний пристрій (30) виконаний з можливістю займати прибране положення, в якому ущільнювальний орган (33) не входить в контакт з ґрунтом.

10. Сівалка, яка містить висівний апарат (5) за будь-яким з пп. 1-9.

(11) 127956 (51) МПК (2024.01)
A01M 7/00
A01C 23/04 (2006.01)

(21) а 2021 02016 (22) 18.10.2019
(24) 22.02.2024
(31) 10 2018 126 585.9
(32) 25.10.2018

(33) DE

(86) PCT/EP2019/078356, 18.10.2019

(72) Клеманн Тімо (DE), Кіфер Штефан (DE)

(73) АМАЗОНЕН-ВЕРКЕ Х. ДРАЙСР ГМБХ & КО. КГ
Am Amazonenwerk 9-13, 49205 Hasbergen, Germany (DE)

(54) СПОСІБ ТА ПРИСТРІЙ ДЛЯ НАНЕСЕННЯ РОЗПИЛЮВАНОЇ РІДИНИ

(57) 1. Спосіб нанесення розпилюваної рідини за допомогою сільськогосподарського обприскувача (10), який включає етапи:

- нанесення розпилюваної рідини на сільськогосподарську площу (18) за допомогою множини елементів розпилення (14a-14g, 16a-16g), які розміщені на штанзі розпилювача (12) сільськогосподарського обприскувача (10), та

- виявлення рядків рослин на сільськогосподарській площі (18) під час нанесення розпилюваної рідини; який **відрізняється** тим, що розпилювану рідину наносять на рядкових ділянках (20a-20p) сільськогосподарської площі (18) з рядками рослин, що проходять, по суті, паралельно напрямку руху сільськогосподарського обприскувача, за допомогою щонайменше одного елемента розпилення (14a-14g, 16a-16g) з першим режимом розпилення (M1), а на безрядкових ділянках (22a-22d) сільськогосподарської площі (18), вільної від рядків рослин, що проходять, по суті, паралельно напрямку руху сільськогосподарського обприскувача, застосовують щонайменше один елемент розпилення (14a-14g, 16a-16g) з другим режимом розпилення (M2).

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що нанесення розпилюваної рідини на рядкових ділянках (20a-20p) здійснюють за допомогою першої групи елементів розпилення (14a-14g), а нанесення розпилюваної рідини на безрядкові ділянки (22a-22d) здійснюють за допомогою другої групи елементів розпилення (16a-16g).

3. Спосіб за п. 1 або 2, який **відрізняється** тим, що він включає щонайменше один із таких етапів:

- автоматична зміна режиму обприскування (M1, M2) в зоні нанесення під штангою розпилювача (12) при виявленні початку рядка рослин;
- автоматична зміна режиму обприскування (M1, M2) в зоні нанесення під штангою розпилювача (12) при виявленні кінця рядка рослин.

4. Спосіб за п. 3, який **відрізняється** тим, що зміна режиму розпилення (M1, M2) в зоні нанесення під штангою розпилювача (12) при виявленні початку рядка рослин включає щонайменше один із таких етапів:

- деактивація щонайменше одного елемента розпилення (16a-16g) з другої групи елементів розпилення (16a-16g), призначеної для зони нанесення;
- активація щонайменше одного елемента розпилення (14a-14g) з першої групи елементів розпилення (14a-14g), призначеної для зони нанесення.

5. Спосіб за п. 3 або 4, який **відрізняється** тим, що зміна режиму розпилення (M1, M2) в зоні нанесення під штангою розпилювача (12) при виявленні кінця рядка рослин включає щонайменше один із таких етапів:

- деактивація щонайменше одного елемента розпилення (14a-14g) з першої групи елементів розпилення (14a-14g), призначеної для зони нанесення;

- активація щонайменше одного елемента розпилення (16a-16g) з другої групи елементів розпилення (16a-16g), призначеної для зони нанесення.

6. Спосіб за одним із пп. 3-5, який **відрізняється** тим, що зміна режиму розпилення (M1, M2) в зоні нанесення під штангою розпилювача (12) при виявленні початку рядка рослин та/або кінця рядка рослин включає такий етап:

- зміна режиму розпилення (M1, M2) щонайменше одного елемента розпилення, призначеного для зони нанесення.

7. Спосіб за одним із попередніх пунктів, який **відрізняється** тим, що перший режим розпилення (M1) та другий режим розпилення (M2) відрізняються шириною розпилення (B1, B2) та/або кутами розпилення (α , β).

8. Спосіб за одним із попередніх пунктів, який **відрізняється** тим, що перший режим розпилення (M1) і другий режим розпилення (M2) потребують різної кількості розпилюваної рідини та/або різної швидкості нанесення розпилюваної рідини.

9. Спосіб за одним із попередніх пунктів, який **відрізняється** тим, що використовують різні активні речовини та/або різні концентрації активних речовин при нанесенні розпилюваної рідини в першому режимі розпилення (M1) і при нанесенні розпилюваної рідини в другому режимі розпилення (M2).

10. Спосіб за одним із попередніх пунктів, який **відрізняється** тим, що виявлення рядків рослин на сільськогосподарській площі (18) здійснюють за допомогою одного або множини сенсорних пристроїв та/або однієї або множини камер (24a-24f) сільськогосподарського обприскувача (10).

11. Сільськогосподарський обприскувач (10), зокрема польовий обприскувач, який містить:

- множину елементів розпилення (14a-14g, 16a-16g), які розміщені на штанзі розпилювача (12) та налаштовані для нанесення розпилюваної рідини на сільськогосподарську площу (18);

- пристрій виявлення, пристосований для виявлення рядків рослин на сільськогосподарській площі (18) під час нанесення розпилюваної рідини; і

- пристрій керування, призначений для контролювання нанесення розпилюваної рідини через елементи розпилення (14a-14g, 16a-16g);

який **відрізняється** тим, що пристрій керування налаштований на спонукання щонайменше одного елемента розпилення (14a-14g, 16a-16g), призначеного для використання на рядкових ділянках (20a-20p) сільськогосподарської площі (18), які мають рядки рослин, що проходять, по суті, паралельно напрямку руху сільськогосподарського обприскувача, наносити розпилювану рідину в першому режимі розпилення (M1), а на безрядкових ділянках (22a-22d) сільськогосподарської площі (18), які не мають рядків рослин, що проходять, по суті, паралельно напрямку руху сільськогосподарського обприскувача, на спонукання щонайменше одного елемента розпилення (14a-14g, 16a-16g) наносити розпилювану рідину в другому режимі розпилення (M2).

12. Сільськогосподарський обприскувач (10) за п. 11, який **відрізняється** тим, що сільськогосподарський обприскувач (10) призначений для здійснення способу за одним з пп. 1-10.

A 24

- (11) **127946** (51) МПК (2024.01)
A24F 47/00
- (21) а 2020 06192 (22) 20.03.2019
(24) 22.02.2024
(31) 15/935,105
(32) 26.03.2018
(33) US
(86) PCT/IB2019/052279, 20.03.2019
(72) Хеджазі Вахід (US)
(73) PAI СТРЕТЕДЖІК ХОЛДІНГС, ІНК.
401 North Main Street, Winston-Salem, North Carolina 27101, United States of America (US)
- (54) ПРИСТРІЙ ДОСТАВКИ АЕРОЗОЛЮ, ЩО ЗАБЕЗПЕЧУЄ КЕРУВАННЯ СМАКОАРОМАТИЧНИМИ ДОБАВКАМИ
- (57) 1. Картридж для використання у пристрої доставки аерозолю, що містить:
- канал потоку повітря, що проходить через картридж;
- резервуар, виконаний з можливістю вміщення композиції попередника аерозолю;
- розпилювач, виконаний з можливістю випаровування композиції попередника аерозолю з утворенням пари, що захоплюється у повітря, що проходить через канал потоку повітря; і
- вузол додавання смакоароматичної речовини, що містить множину окремих камер, оточених зовнішньою оболонкою, причому щонайменше одна із зазначеної множини окремих камер містить смакоароматичну речовину, яка оточує внутрішній канал через зазначену щонайменше одну із зазначеної множини окремих камер, причому внутрішній канал розміщений у каналі потоку повітря, при цьому внутрішній канал заданий пористою трубкою, яка придатна для транспортування смакоароматичної речовини до внутрішнього каналу, так що смакоароматична речовина захоплюється у повітря, що проходить через внутрішній канал.
2. Картридж за п. 1, що додатково містить щонайменше одну маску, яка виконана переміщуваною з вузлом додавання смакоароматичної речовини з можливістю вибіркового та попереминого пропускання повітря через внутрішній канал зазначеної щонайменше однієї із зазначеної множини окремих камер.
3. Картридж за п. 1, на якому виконане візуальне маркування для позначення зазначеної множини окремих камер резервуара.
4. Картридж за п. 1, який додатково містить живильник для східчастого подавання смакоароматичної речовини.
5. Картридж за п. 4, який додатково містить виконавчий механізм для вибіркового вивільнення смакоароматичної речовини з живильника.
6. Картридж за п. 5, у якому смакоароматична речовина розміщена в множині капсул.
7. Картридж за п. 6, у якому виконавчий механізм виконаний з можливістю руйнування щонайменше однієї з капсул для вивільнення смакоароматичної речовини.
8. Картридж за п. 7, в якому виконавчий механізм містить пару шестерень,

причому зубці шестерень взаємодіють таким чином, що обертання шестерень відбувається з можливістю вивільнення щонайменше однієї капсули з живильника та вивільнення смакоароматичної речовини з капсули,
причому смакоароматична речовина потім захоплюється потоком повітря.
9. Картридж за п. 5, у якому запуск виконавчого механізму забезпечений за допомогою механічної кнопки.
10. Картридж за п. 4, що містить віконце в живильнику, яке забезпечує можливість визначення кількості смакоароматичної речовини, що залишається в живильнику.
11. Картридж за п. 1, в якому вузол додавання смакоароматичної речовини містить щонайменше три камери, що містять смакоароматичну речовину, і щонайменше одну камеру, що не містить смакоароматичної речовини.
12. Картридж за п. 1, в якому пориста трубка є нанопористою або мікропористою.
13. Картридж за п. 1, у якому пориста трубка транспортує смакоароматичну речовину за рахунок дії капілярних сил.
14. Картридж за п. 2, в якому маска здатна пропускати повітря тільки через одну із зазначеної множини окремих камер в один момент часу.
15. Пристрій доставки аерозолю, який містить: керуючий корпус і картридж, що містить:
- канал потоку повітря, що проходить через картридж;
- резервуар, виконаний з можливістю вмісту композиції попередника аерозолю;
- розпилювач, виконаний з можливістю випаровування композиції попередника аерозолю з утворенням пари, що захоплюється у повітря, що проходить через канал потоку повітря; і
- вузол додавання смакоароматичної речовини, що містить множину окремих камер, оточених зовнішньою оболонкою, причому щонайменше одна із зазначеної множини окремих камер містить смакоароматичну речовину, яка оточує внутрішній канал через зазначену щонайменше одну із зазначеної множини окремих камер, причому внутрішній канал виконаний розміщеним у каналі потоку повітря, при цьому внутрішній канал заданий пористою трубкою, яка придатна для транспортування смакоароматичної речовини до внутрішнього каналу, так що смакоароматична речовина захоплюється у повітря, що проходить через внутрішній канал.
16. Пристрій доставки аерозолю за п. 15, в якому картридж додатково містить щонайменше одну маску, яка виконана переміщуваною з вузлом додавання смакоароматичної речовини з можливістю вибіркового та попереминого пропускання повітря через внутрішній канал зазначеної щонайменше однієї із зазначеної множини окремих камер.
17. Пристрій доставки аерозолю за п. 15, в якому щонайменше на одному з картриджа та керуючого корпусу виконане візуальне маркування для позначення зазначеної множини окремих камер резервуара.
18. Пристрій доставки аерозолю за п. 15, який додатково містить живильник для східчастого подавання смакоароматичної речовини.
19. Пристрій доставки аерозолю за п. 18, який додатково містить виконавчий механізм для вибірко-

го вивільнення смакоароматичної речовини з живильника.

20. Пристрій доставки аерозолю за п. 19, в якому смакоароматична речовина розміщена в множині капсул.

21. Пристрій доставки аерозолю за п. 20, в якому виконавчий механізм виконаний з можливістю руйнування щонайменше однієї з множини капсул для вивільнення смакоароматичної речовини.

22. Пристрій доставки аерозолю за п. 21, в якому виконавчий механізм містить пару шестерень, причому зубці шестерень взаємодіють таким чином, що обертання шестерень відбувається з можливістю вивільнення щонайменше однієї капсули з живильника та вивільнення смакоароматичної речовини з капсули, причому смакоароматична речовина потім захоплюється потоком повітря.

23. Пристрій доставки аерозолю за п. 19, в якому запуск виконавчого механізму забезпечений за допомогою механічної кнопки.

24. Пристрій доставки аерозолю за п. 18, в якому картридж містить віконце в живильнику, яке забезпечує можливість визначення кількості смакоароматичної речовини, що залишається в камері.

A 47

- (11) **127957** (51) МПК (2024.01)
A47J 37/00
A47J 37/06 (2006.01)
- (21) а 2021 02068 (22) 08.08.2019
(24) 22.02.2024
(31) 62/733,739
(32) 20.09.2018
(33) US
(86) PCT/US2019/045707, 08.08.2019
(72) Пауелл Олін (US), Картер Адам (US), Террел Роберт Бі. (US), Мерсер Деніел Джон (US)
(73) **МАСТЕРБІЛТ МАНУФЕКЧЕРІНГ, ЕЛЕЛСІ**
1 Masterbuilt Court, Columbus, GA 31907, United States of America (US)
- (54) **ПРИСТРІЙ ДЛЯ ПРИГОТУВАННЯ ТА КОПЧЕННЯ ХАРЧОВИХ ПРОДУКТІВ З ГРАВІТАЦІЙНИМ ПОДАВАННЯМ**
- (57) 1. Пристрій для приготування та копчення харчових продуктів, що включає:
а) камеру, що включає:
і) кришку доступу;
іі) щонайменше одну решітку для приготування харчових продуктів, розташовану у камері для розміщення харчових продуктів, що готуються; а також
ііі) вхідний димовий отвір для введення диму і тепла у камеру;
б) димову трубу, розташовану ззовні камери, труба містить отвір і додатково включає:
і) топку, розташовану під отвором, що включає:
(а) колосникову решітку; а також
(б) вихідний димовий отвір топки, що з'єднаний з камерою та дозволяє вводити дим і тепло у камеру через вхідний димовий отвір;

іі) бункер для палива, розміщений над топкою для гравітаційного подавання палива у топку; а також
с) вентилятор для подачі повітря у топку.

2. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що димова труба включає внутрішню стінку димової труби та зовнішню стінку димової труби з охолоджувальним простором між внутрішньою стінкою димової труби та зовнішньою стінкою димової труби.

3. Пристрій за п. 2, який **відрізняється** тим, що зовнішня стінка димової труби має ряд отворів, сконфігурованих для забезпечення вільного руху повітря в охолоджувальному просторі.

4. Пристрій за п. 3, який **відрізняється** тим, що отвори у зовнішній стінці забезпечують рівень її відкритості від 40 до 75 %.

5. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що вихідний отвір топки включає регульовану димову заслінку для контролю об'єму диму, що утворюється у топці та проходить через вихідний отвір топки.

6. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що вихідний отвір топки включає кутову решітку для захоплення вуглинок або частин палива і запобігання потраплянню таких вуглинок або частин палива у вхідний димовий отвір.

7. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що додатково містить вентиляторний канал із вихідним отвором вентилятора, який сконфігурований для подачі повітря від вентилятора у топку, та де вентиляторний канал додатково містить контрольну заслінку.

8. Пристрій за п. 7, який **відрізняється** тим, що вихідний отвір вентилятора включає повітряну заслінку, сконфігуровану для регулювання кількості повітря, що подається у топку від вентилятора.

9. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що кількість повітря, яке подається вентилятором до топки, частково контролюється регулюванням швидкості обертання вентилятора.

10. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що кількість повітря, яке подається вентилятором до топки, частково контролюється за допомогою циклічного увімкнення та вимкнення вентилятора.

11. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що камера додатково включає димохід, що з'єднаний із вхідним димовим отвором.

12. Пристрій для приготування та копчення харчових продуктів, що включає:

а) камеру, що включає вхідний димовий отвір; та
б) димову трубу, розташовану ззовні камери, що включає:

і) топку, що включає вихідний отвір топки, з'єднаний з камерою, причому топка сконфігурована з можливістю подачі диму через вихідний отвір топки до вхідного димового отвору камери;

іі) бункер для палива, розміщений над топкою, що включає отвір для прийому палива, при цьому бункер для палива сконфігурований з можливістю гравітаційного подавання палива у топку.

13. Пристрій за п. 12, який **відрізняється** тим, що додатково містить вентилятор, сконфігурований для подачі повітря в топку.

14. Пристрій за п. 13, який **відрізняється** тим, що вентилятор додатково містить вихідний отвір вентилятора.

15. Пристрій за п. 14, який **відрізняється** тим, що додатково містить контрольну заслінку.

16. Пристрій за п. 13, який **відрізняється** тим, що додатково містить контролер, оперативно з'єднаний з вентилятором і сконфігурований для контролю температури всередині камери.

17. Пристрій за п. 12, який **відрізняється** тим, що топка додатково містить колосникову решітку, розташовану в нижній частині топки.

18. Пристрій за п. 17, який **відрізняється** тим, що додатково містить зольник, розташований під колосниковою решіткою.

19. Пристрій за п. 17, який **відрізняється** тим, що топка додатково містить кутову решітку, розташовану між вихідним отвором топки та топкою.

20. Пристрій за п. 12, який **відрізняється** тим, що додатково містить димовий канал, розташований усередині камери, причому димовий канал містить вхідний димовий отвір.

Розділ В:**Виконання операцій.
Транспортування****В 07**

(11) **127945** (51) МПК (2024.01)
B07B 1/46 (2006.01)
B01D 25/00

(21) а 2019 04533 (22) 13.03.2013

(24) 22.02.2024

(31) 61/652,039

(32) 25.05.2012

(33) US

(31) 61/714,882

(32) 17.10.2012

(33) US

(62) а 2014 13842, 23.12.2014

(72) Войцеховські Кейт Ф. (US)

(73) **ДЕРРІК КОРПОРЕЙШН**
590 Duke Road, Buffalo, NY 14225, USA (US)

(54) **ВУЗОЛ СИТА (ВАРІАНТИ)**

(57) 1. Вузол сита, що містить:
термопластичний просіювальний модуль, який містить просіювальну поверхню просіювального модуля з набором отворів сита; і
ґрати, які містять численні довгасті конструктивні елементи, що утворюють ґратчасту раму з отворами ґрат; причому термопластичний просіювальний модуль перекриває щонайменше один отвір ґрат і прикріплений до верхньої поверхні ґрат,
декілька окремих ґрат безпосередньо скріплені одні з одними та утворюють вузол сита, причому вузол сита є окремою конструкцією, виконаною з можливістю знімного прикріплення до вібраційно-грохотної машини,
вузол сита має неперервну просіювальну поверхню вузла сита, що містить численні просіювальні поверхні просіювальних модулів,
термопластичний просіювальний модуль містить паралельні торцеві сегменти і паралельні бічні сегменти, перпендикулярні торцевим сегментам,
термопластичний просіювальний модуль містить також перший опорний сегмент просіювального модуля і другий опорний сегмент просіювального модуля, ортогональний першому опорному сегменту просіювального модуля, причому перший опорний сегмент просіювального модуля проходить між торцевими сегментами і паралельний бічним сегментам, а другий опорний сегмент просіювального модуля проходить між бічними сегментами і паралельний торцевим сегментам,
термопластичний просіювальний модуль містить першу послідовність підсилювачів, паралельних бічним сегментам, і другу послідовність підсилювачів, паралельних торцевим сегментам,
причому просіювальна поверхня просіювального модуля містить елементи поверхні сита, що формують отвори сита,

причому торцеві сегменти, бічні сегменти, перший і другий опорні сегменти, перша і друга послідовності підсилювачів виконані таким чином, щоб надавати конструктивної стійкості елементам поверхні сита і отворах сита,

причому термопластичний просіювальний модуль є єдиною деталлю, виконаною інжекційним формуванням з термопласту, і

отвори сита утворені між гранями елементів поверхні сита, і відстань між першою гранню першого елемента поверхні сита і другою гранню другого елемента поверхні сита сусіднього з першим елементом поверхні сита мають значення в діапазоні від 70 до 180 мікрон.

2. Вузол сита за п. 1, який **відрізняється** тим, що елементи поверхні сита проходять паралельно торцевим сегментам, причому отвори сита містять довгасті прорізи.

3. Вузол сита за п. 1, який **відрізняється** тим, що елементи поверхні сита проходять паралельно торцевим сегментам, отвори сита містять довгасті прорізи, що мають рівномірну ширину і довжину, при цьому рівномірна ширина має значення в діапазоні від 0,070 до 0,180 мм, а довжина має значення в діапазоні від 0,088 до 60 мм.

4. Вузол сита за п. 1, який **відрізняється** тим, що ґрати є другою литою деталлю, виконаною інжекційним формуванням з термопласту.

5. Вузол сита за п. 1, який **відрізняється** тим, що перші ґрати містять першу основу з першим кріпильним елементом, що зачіпляється з другим кріпильним елементом другої основи других ґрат, за рахунок чого перший кріпильний елемент і другий кріпильний елемент скріплюють разом перші ґрати і другі ґрати.

6. Вузол сита за п. 5, який **відрізняється** тим, що перший кріпильний елемент є клямкою, а другий кріпильний елемент є прорізом клямки, причому клямка фіксується в прорізі клямки і постійно скріплює разом перші ґрати і другі ґрати.

7. Вузол сита за п. 1, який **відрізняється** тим, що вузол сита має відкриту площу просіювання, яка становить щонайменше 16 % загальної площі неперервної просіювальної поверхні вузла сита.

8. Вузол сита за п. 1, який **відрізняється** тим, що довгасті конструктивні елементи містять паралельні торцеві елементи ґрат і паралельні бічні елементи ґрат, перпендикулярні торцевим елементам ґрат, і причому довгасті конструктивні елементи також містять перший опорний елемент ґрат і другий опорний елемент ґрат, ортогональний першому опорному елементу ґрат, перший опорний сегмент ґрат проходить між торцевими елементами ґрат та паралельний бічним елементам ґрат, а другий опорний елемент ґрат проходить між бічними елементами ґрат та паралельний торцевим елементам ґрат і перпендикулярний крайнім елементам ґрат.

9. Вузол сита за п. 1, який **відрізняється** тим, що ґратчаста рама містить першу ґратчасту раму і другу ґратчасту раму, що створюють перший отвір ґрат і другий отвір ґрат, термопластичний просіювальний модуль містить перший просіювальний модуль і другий просіювальний модуль, причому ґрати містять гребінь і основу, перша ґратчаста рама і друга ґратчаста рама містять першу похилу поверхню і другу похилу поверхню, які доходять до гребеня і проходять вниз від гребеня до основи, і причому перший про-

сіювальний модуль перекриває першу похилу поверхню, а другий просіювальний модуль перекриває другу похилу поверхню.

10. Вузол сита за п. 1, який **відрізняється** тим, що перший отвір сита з набору отворів сита має одну з наступних форм: прямокутну форму, квадратну форму, круглу форму або овальну форму.

11. Вузол сита за п. 1, який **відрізняється** тим, що елементи поверхні сита проходять паралельно торцевим сегментам і утворюють отвори сита.

12. Вузол сита, що містить:

просіювальний модуль, який містить термопластичну просіювальну поверхню просіювального модуля з довгастими прорізами, причому кожний проріз з групи довгастих прорізів має довжину та рівномірну ширину, причому рівномірна ширина має значення в діапазоні від 43 до 180 мікрон; і

ґрати, які містять численні довгасті конструктивні елементи, що утворюють ґратчасту раму з отворами ґрат;

причому просіювальний модуль перекриває щонайменше один отвір ґрат і прикріплений до верхньої поверхні ґрат,

численні ґрати перманентно скріплені між собою для утворення вузла сита; і вузол сита має неперервну просіювальну поверхню вузла сита, що складається з множини термопластичних просіювальних поверхонь просіювальних модулів.

13. Вузол сита за п. 12, який **відрізняється** тим, що просіювальний модуль містить паралельні торцеві сегменти і паралельні бічні сегменти, перпендикулярні торцевим сегментам, причому термопластичний просіювальний модуль також містить перший опорний сегмент просіювального модуля і другий опорний сегмент просіювального модуля, ортогональний першому опорному сегменту просіювального модуля, перший опорний сегмент просіювального модуля проходить між торцевими сегментами і паралельний бічним сегментам, а другий опорний сегмент просіювального модуля проходить між бічними сегментами і паралельний торцевим сегментам, причому просіювальний модуль містить першу послідовність підсилювачів, паралельних бічним сегментам, і другу послідовність підсилювачів, паралельних торцевим сегментам, причому просіювальний модуль містить довгасті термопластичні елементи поверхні сита, що проходять паралельно торцевим сегментам і утворюють довгасті прорізи, причому торцеві сегменти, бічні сегменти, перший і другий опорні сегменти, перша і друга послідовності підсилювачів роблять конструктивно стійкими довгасті термопластичні елементи поверхні сита і довгасті прорізи.

14. Вузол сита за п. 13, який **відрізняється** тим, що перший опорний сегмент просіювального модуля, другий опорний сегмент просіювального модуля і торцеві сегменти містять кріпильний пристрій просіювального модуля, що має конфігурацію з можливістю з'єднання з кріпильним пристроєм ґрат, причому частина кріпильного пристрою ґрат має конфігурацію з можливістю розплавлення і закріплення просіювального модуля.

15. Вузол сита за п. 12, який **відрізняється** тим, що вузол сита має відкриту площу просіювання, яка дорівнює щонайменше 16 % загальної площі неперервної просіювальної поверхні вузла сита.

16. Вузол сита за п. 13, який **відрізняється** тим, що ширина має значення в діапазоні від 70 до 180 мікрон між внутрішніми поверхнями кожного з довгастих елементів поверхні сита.

17. Вузол сита за п. 13, який **відрізняється** тим, що ширина має значення в діапазоні від 43 до 106 мікрон між внутрішніми поверхнями кожного елемента поверхні сита.

18. Вузол сита за п. 13, який **відрізняється** тим, що ширина довгастих прорізів просіювального модуля має значення в діапазоні від 0,044 до 0,180 мм, а довжина довгастих прорізів просіювального модуля має значення в діапазоні від 0,088 до 60 мм.

19. Вузол сита за п. 13, який **відрізняється** тим, що перша послідовність підсилювачів і друга послідовність підсилювачів мають товщину, меншу товщини торцевих сегментів, бічних сегментів, першого опорного сегмента просіювального модуля і другого опорного сегмента просіювального модуля.

20. Вузол сита за п. 19, який **відрізняється** тим, що торцеві сегменти, бічні сегменти, перший опорний сегмент просіювального модуля і другий опорний сегмент просіювального модуля утворюють чотири прямокутних області, а перша послідовність підсилювачів і друга послідовність підсилювачів утворюють кілька прямокутних опорних ґрат в кожній з чотирьох прямокутних областей.

21. Вузол сита, що містить:

термопластичний просіювальний модуль, що містить просіювальну поверхню просіювального модуля з довгастими прорізами; і

ґрати, які містять ґратчасту раму з отворами ґрат, причому термопластичний просіювальний модуль перекриває отвори ґрат і прикріплений до поверхні ґрат, причому численні ґрати безпосередньо пов'язані одні з одними і утворюють вузол сита, а вузол сита являє собою готову окрему конструкцію,

причому вузол сита має неперервну просіювальну поверхню вузла сита, що містить множини просіювальних поверхонь просіювальних модулів, і причому термопластичний просіювальний модуль є деталлю, що виконана інжекційним формуванням.

22. Вузол сита за п. 21, який **відрізняється** тим, що отвори сита утворені елементами поверхні сита, що мають товщину від 43 до 100 мікрон.

23. Вузол сита за п. 21, який **відрізняється** тим, що кожний проріз з групи довгастих прорізів має довжину і рівномірну ширину, причому рівномірна ширина має значення в діапазоні від 43 до 180 мікрон.

24. Вузол сита за п. 21, який **відрізняється** тим, що містить перший просіювальний модуль і другий просіювальний модуль, причому ґратчаста рама містить першу ґратчасту раму і другу ґратчасту раму, що утворюють перший отвір ґрат і другий отвір ґрат, і причому ґрати містять гребінь і основу, перша ґратчаста рама і друга ґратчаста рама містять першу похилу поверхню і другу похилу поверхню, які доходять до гребеня і проходять вниз від гребеня до основи, а перший просіювальний модуль і другий просіювальний модуль перекривають першу і другу похилі поверхні, відповідно.

25. Вузол сита за п. 24, який **відрізняється** тим, що перша похила поверхня і друга похила поверхня містять кріпильний пристрій ґрат, виконаний з можливістю з'єднання з кріпильним пристроєм просіювального модуля.

26. Вузол сита за п. 21, який **відрізняється** тим, що вузол сита має відкриту площу просіювання, яка дорівнює щонайменше 16 % загальної площі неперервної просіювальної поверхні вузла сита.

27. Вузол сита, що містить:

термопластичний просіювальний модуль, що містить просіювальну поверхню просіювального модуля з довгастими прорізами, причому кожний проріз з групи довгастих прорізів має довжину і рівномірну ширину, причому рівномірна ширина має значення в діапазоні від 43 до 106 мікрон; і ґрати, які містять ґратчасту раму з отворами ґрат, причому просіювальний модуль перекриває щонайменше один отвір ґрат і прикріплений до верхньої поверхні ґрат, причому численні ґрати скріплені одні з одними і утворюють вузол сита, а вузол сита являє собою готову окрему конструкцію, виконану з можливістю знімного прикріплення до вібраційно-грохотної машини, і причому вузол сита має неперервну просіювальну поверхню вузла сита, що складається з множини просіювальних поверхонь просіювальних модулів.

28. Вузол сита за п. 27, який **відрізняється** тим, що просіювальний модуль містить паралельні торцеві сегменти і паралельні бічні сегменти, перпендикулярні торцевим сегментам, просіювальний модуль містить також перший опорний сегмент просіювального модуля і другий опорний сегмент просіювального модуля, ортогональний першому опорному сегменту просіювального модуля, причому перший опорний сегмент просіювального модуля проходить між торцевими сегментами і паралельний бічним сегментам, а другий опорний сегмент просіювального модуля проходить між бічними сегментами і паралельний торцевим сегментам, просіювальний модуль містить першу послідовність підсилювачів, паралельних бічним сегментам, і другу послідовність підсилювачів, паралельних торцевим сегментам, причому довгасті прорізи проходять паралельно торцевим сегментам, і причому торцеві сегменти, бічні сегменти, перший і другий опорні сегменти, перша послідовність підсилювачів і друга послідовність підсилювачів роблять конструктивно стійкими елементи поверхні сита і довгастий проріз.

29. Вузол сита за п. 28, який **відрізняється** тим, що перший опорний сегмент просіювального модуля, другий опорний сегмент просіювального модуля і торцеві сегменти містять відповідний кріпильний пристрій просіювального модуля, що має конфігурацію з можливістю з'єднання з відповідним кріпильним пристроєм ґрат.

30. Вузол сита за п. 27, який **відрізняється** тим, що вузол сита має відкриту площу просіювання, яка дорівнює щонайменше 16 % загальної площі неперервної просіювальної поверхні вузла сита.

(21) а 2021 03759

(22) 01.07.2021

(24) 22.02.2024

(72) Лобанов Леонід Михайлович (UA), Терновий Євген Георгійович (UA), Глушак Сергій Олександрович (UA)

(73) ІНСТИТУТ ЕЛЕКТРОЗВАРЮВАННЯ ІМ. Є.О. ПАТОНА НАЦІОНАЛЬНОЇ АКАДЕМІЇ НАУК УКРАЇНИ вул. Казимира Малевича, буд. 11, м. Київ, 03150 (UA)

(54) СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ КІЛЬЦЕВИХ СТИКОВИХ З'ЄДНАНЬ ЗВАРНИХ КОНСТРУКЦІЙ В УМОВАХ ВІДКРИТОГО КОСМОСУ

(57) 1. Спосіб одержання кільцевих стикових з'єднань зварних конструкцій в умовах відкритого космосу, при якому використовують елементи, які стикаються, крайки яких є попередньо обробленими та виконаними конгруентними, при цьому згадані елементи дистанційно з'єднують, зварюють і перевіряють герметичність зварного шва, який **відрізняється** тим, що використовують елементи, які стикаються, з потовщенням крайок, причому потовщення крайки одного зі згаданих елементів має конусно-циліндричний виступ, а потовщення крайки другого - відповідну проточку, при цьому при з'єднанні елементи, які стикаються, попередньо орієнтують з суміщенням осей і складають так, щоб виступ одного елемента входив в конгруентно виконану проточку другого елемента до стикування конічних поверхонь, після чого з лінією стику зібраних елементів суміщають електронний промінь і виконують їх зварювання прорізним швом без наскрізного проплавлення.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що товщина циліндричної частини конусно-циліндричного виступу є рівною або більшою за товщину стінки елементів, які стикаються, за межами потовщення.

3. Спосіб за п. 1 або 2, який **відрізняється** тим, що довжину конусно-циліндричного виступу одного елемента та глибину конгруентно виконаної проточки другого елемента вибрано залежно від кількості ремонтних швів, що накладаються, з урахуванням проміжку між ними, рівного не менше 1,5 ширини попереднього шва.

4. Спосіб за будь-яким із пп. 1-3, який **відрізняється** тим, що у разі виявлення нещільності при перевірці герметичності отриманого зварного шва, накладання ремонтних швів здійснюють в послідовності, що забезпечує дублювання герметизації з'єднання попереднім швом на глибину, що проходить принаймні на всю товщину циліндричної частини конусно-циліндричного виступу.

B 24

(11) 127959

(51) МПК

B24B 33/02 (2006.01)

B24B 33/08 (2006.01)

(21) а 2021 03814

(22) 05.07.2021

(24) 22.02.2024

(72) Буюклі Іван Михайлович (UA), Колеснік Василь Михайлович (UA), Георгієва Лариса Володимирівна (UA), Гавенко Кирило Олександрович (UA)

B 23

(11) 127958

(51) МПК (2024.01)

B23K 33/00

B23K 15/04 (2006.01)

- (73) **БУЮКЛІ ІВАН МИХАЙЛОВИЧ**
вул. Ак. Корольова, 60, кв. 43, м. Одеса, 65104 (UA)
КОЛЕСНІК ВАСИЛЬ МИХАЙЛОВИЧ
вул. Шоніна, 30, м. Балта, Балтський р-н, Одеська обл., 66100 (UA)
ГЕОРГІЄВА ЛАРИСА ВОЛОДИМИРІВНА
вул. Ак. Корольова, 34, кв. 72, м. Одеса, 65114 (UA)
ГАВЕНКО КИРИЛО ОЛЕКСАНДРОВИЧ
вул. Європейська, 5, кв. 124, м. Одеса, 65110 (UA)
- (54) **ХОНІНГУВАЛЬНА ГОЛОВКА**
- (57) Хонінгувальна головка, що містить корпус з подовжніми пазами, в яких розташовано рухливо в радіальному напрямі і з можливістю взаємодії з елементом радіального розтискання більше ніж один комплект

колодок з брусками різної зернистості, яка **відрізняється** тим, що робоча частина елемента радіального розтискання виконана у вигляді клина з кількістю граней, що дорівнює кількості колодок з брусками, при цьому кути між подовжньою віссю клина і гранями, що взаємодіють з комплектом колодок з брусками однієї зернистості, виконані рівними, а кути між подовжньою віссю клина і гранями, що взаємодіють з комплектами колодок з брусками різної зернистості, виконані різними так, що дискретно зростають у міру дискретного убавання зернистості від комплекту до комплекту.

Розділ С:**Хімія. Металургія****С 12**

- (11) **127944** (51) МПК
C12N 15/11 (2006.01)
C12N 15/82 (2006.01)
C12N 15/32 (2006.01)
A01H 6/46 (2018.01)
- (21) а **2017 10503** (22) **30.03.2016**
(24) **22.02.2024**
(31) **201510220034.6**
(32) **30.04.2015**
(33) **CN**
(86) **PCT/CN2016/077866, 30.03.2016**
(72) Дінг Деронг (CN), Канг Йюецзін (CN), Чжанг Йюньчжу (CN), Ліу Хейлі (CN), Панг Цзе (CN), Ванг Ліюн (CN), Джіа Чжівей (CN), Хуанг Чжінчун (CN), Гуо Ханжі (CN), Ванг Леі (CN), Фу Ксуекіань (CN), Чжоу Йі (CN), Лі Фенг (CN), Бао Ксяомін (CN), Лу Йюпінг (CN), Чжанг Шіпінг (CN)
- (73) **БЕІЖІНГ ДАБЕІНОНГ БІОТЕХНОЛОДЖІ КО., ЛТД. No. 49 Building, Institute For Application Of Atomic Energy Chinese Academy Of Agricultural Sciences No. 2 Yuanmingyuan West Road, Haidian District Beijing 100193, China (CN)**
- (54) **РОСЛИНА МАЇСУ DBN9936 І СПОСІБ ЗАСТОСУВАННЯ ПІД ЧАС ДЕТЕКТУВАННЯ ЇЇ ПОСЛІДОВНОСТІ НУКЛЕІНОВОЇ КИСЛОТИ**
- (57) 1. Молекула нуклеїнової кислоти для детектування наявності ДНК трансгенного об'єкта кукурудзи DBN9936 у зразку, яка характеризується послідовністю нуклеїнових кислот молекули нуклеїнової кислоти, що містить SEQ ID NO: 1 або комплементарну їй послідовність й/або SEQ ID NO: 2 або комплементарну їй послідовність, де трансгенний об'єкт кукурудзи DBN9936 містить SEQ ID NO: 1, послідовність нуклеїнової кислоти нуклеотидів 910-8049 SEQ ID NO: 5 та SEQ ID NO: 2 в послідовності або SEQ ID NO: 5.
2. Молекула нуклеїнової кислоти за п. 1, яка характеризується тим, що послідовність нуклеїнової кислоти містить SEQ ID NO: 3 або комплементарну їй послідовність і/або SEQ ID NO: 4 або комплементарну їй послідовність.
3. Молекула нуклеїнової кислоти за п. 2, яка характеризується тим, що послідовність нуклеїнової кислоти містить SEQ ID NO: 5 або комплементарну їй послідовність.
4. Спосіб детектування наявності ДНК трансгенного об'єкта кукурудзи DBN9936 у зразку, який передбачає:
- приведення в контакт зразка щонайменше з двома праймерами в реакції ампліфікації нуклеїнової кислоти;
 - здійснення реакції ампліфікації нуклеїнової кислоти; та
 - детектування наявності амплікона, причому наявність амплікона свідчить про наявність ДНК трансгенного об'єкта кукурудзи DBN9936 у зразку;

причому амплікон містить SEQ ID NO: 1 або комплементарну їй послідовність та/або SEQ ID NO: 2 або комплементарну їй послідовність, де трансгенний об'єкт кукурудзи DBN9936 містить SEQ ID NO: 1, послідовність нуклеїнової кислоти нуклеотидів 910-8049 SEQ ID NO: 5 та SEQ ID NO: 2 в послідовності або SEQ ID NO: 5.

5. Спосіб за п. 4, який **відрізняється** тим, що амплікон містить SEQ ID NO: 6 або комплементарну їй послідовність та/або SEQ ID NO: 7 або комплементарну їй послідовність.

6. Спосіб за п. 4 або 5, який **відрізняється** тим, що праймер включає перший праймер і другий праймер, причому перший праймер вибраний з SEQ ID NO: 8 і SEQ ID NO: 10, а другий праймер вибраний з SEQ ID NO: 9 і SEQ ID NO: 11.

7. Спосіб детектування наявності ДНК об'єкта кукурудзи DBN9936 у зразку, який **відрізняється** тим, що передбачає:

- приведення в контакт зразка з зондом, причому зонд містить SEQ ID NO: 1 або комплементарну їй послідовність та/або SEQ ID NO: 2 або комплементарну їй послідовність;

- гібридизацію зразка з зондом у жорстких умовах гібридизації; та

- детектування гібридизації зонда із зразком, причому гібридизація зонда із зразком свідчить про наявність ДНК трансгенного об'єкта кукурудзи DBN9936 у зразку;

де трансгенний об'єкт кукурудзи DBN9936 містить SEQ ID NO: 1, послідовність нуклеїнової кислоти нуклеотидів 910-8049 SEQ ID NO: 5 та SEQ ID NO: 2 в послідовності або SEQ ID NO: 5.

8. Спосіб за п. 7, який **відрізняється** тим, що зонд містить SEQ ID NO: 6 або комплементарну їй послідовність та/або SEQ ID NO: 7 або комплементарну їй послідовність.

9. Спосіб за п. 7 або 8, який **відрізняється** тим, що щонайменше один зонд помічений щонайменше одним флуорофором.

10. Спосіб детектування наявності ДНК об'єкта кукурудзи DBN9936 у зразку, який **відрізняється** тим, що передбачає:

- приведення в контакт зразка з маркерною молекулою нуклеїнової кислоти, причому маркерна молекула нуклеїнової кислоти містить SEQ ID NO: 1 або комплементарну їй послідовність та/або SEQ ID NO: 2 або комплементарну їй послідовність;

- гібридизацію зразка з маркерною молекулою нуклеїнової кислоти в жорстких умовах гібридизації;

- детектування гібридизації зразка з маркерною молекулою нуклеїнової кислоти, причому гібридизація зразка з маркерною молекулою нуклеїнової кислоти свідчить про наявність ДНК трансгенного об'єкта кукурудзи DBN9936 у зразку;

де трансгенний об'єкт кукурудзи DBN9936 містить SEQ ID NO: 1, послідовність нуклеїнової кислоти нуклеотидів 910-8049 SEQ ID NO: 5 та SEQ ID NO: 2 в послідовності або SEQ ID NO: 5.

11. Спосіб за п. 10, який **відрізняється** тим, що маркерна молекула нуклеїнової кислоти містить SEQ ID NO: 6 або комплементарну їй послідовність та/або SEQ ID NO: 7 або комплементарну їй послідовність.

12. Спосіб за п. 10, який **відрізняється** тим, що додатково передбачає здійснення аналітичного схрещування з використанням маркера для встановлен-

ня генетичного зв'язку стійкості до комах і/або толерантності до гербіциду з маркерною молекулою нуклеїнової кислоти.

13. Набір для детектування ДНК, який **відрізняється** тим, що містить щонайменше одну молекулу ДНК, причому молекула ДНК містить послідовність, яка є гомологічною або комплементарною SEQ ID NO: 1, або послідовність, яка є гомологічною або комплементарною SEQ ID NO: 2, і молекула ДНК може виконувати роль ДНК-праймера або зонда, специфічного для трансгенного об'єкта кукурудзи DBN9936 або його потомства; де трансгенний об'єкт кукурудзи DBN9936 містить SEQ ID NO: 1, послідовність нуклеїнової кислоти нуклеотидів 910-8049 SEQ ID NO: 5 та SEQ ID NO: 2 в послідовності або SEQ ID NO: 5.

14. Набір для детектування ДНК за п. 13, який **відрізняється** тим, що молекула ДНК містить послідовності, які гомологічні або комплементарні SEQ ID NO: 6, та/або послідовності, які гомологічні або комплементарні SEQ ID NO: 7.

15. Клітина або частина рослини, яка **відрізняється** тим, що містить послідовність нуклеїнової кислоти, що кодує білок Cry1Ab стійкості до комах, послідовність нуклеїнової кислоти, що кодує білок EPSPS, який забезпечує толерантність до гербіциду гліфосат, і послідовність нуклеїнової кислоти конкретної ділянки, причому послідовність нуклеїнової кислоти конкретної ділянки включає SEQ ID NO: 1, SEQ ID NO: 2, SEQ ID NO: 6 або SEQ ID NO: 7.

16. Клітина або частина рослини за п. 15, яка **відрізняється** тим, що клітина або частина рослини кукурудзи містить послідовність нуклеїнової кислоти, що кодує білок Cry1Ab стійкості до комах, послідовність нуклеїнової кислоти, що кодує білок EPSPS, який забезпечує толерантність до гербіциду гліфосат, і послідовність нуклеїнової кислоти конкретної ділянки, причому послідовність нуклеїнової кислоти конкретної ділянки включає SEQ ID NO: 3 або SEQ ID NO: 4.

17. Клітина або частина рослини за п. 15, яка **відрізняється** тим, що клітина або частина рослини кукурудзи містить послідовність нуклеїнової кислоти, яка викладена в SEQ ID NO: 5.

18. Спосіб захисту рослини кукурудзи від зараження комахами, який **відрізняється** тим, що передбачає внесення щонайменше однієї клітини або частини трансгенної рослини кукурудзи за будь-яким з пп. 15-17 у раціон цільової комахи, а вживання в їжу клітини або частини трансгенної рослини кукурудзи призводить подальше годування цільової комахи на зазначеній рослині кукурудзи.

19. Спосіб захисту рослини кукурудзи від пошкодження, спричиненого гербіцидом, який **відрізняється** тим, що передбачає внесення ефективної кількості гербіциду гліфосат у поле щонайменше з однією трансгенною рослиною кукурудзи, причому трансгенна рослина кукурудзи містить у своєму геномі щонайменше одну послідовність нуклеїнової кислоти, вибрану з групи, що складається з SEQ ID NO: 1, SEQ ID NO: 2, SEQ ID NO: 3, SEQ ID NO: 4, SEQ ID NO: 5, SEQ ID NO: 6 і SEQ ID NO: 7, і трансгенна рослина кукурудзи має толерантність до гербіциду гліфосат.

20. Спосіб селекції стійкої до комах рослини кукурудзи, який **відрізняється** тим, що передбачає:

- висівання щонайменше одного насіння кукурудзи, причому насіння кукурудзи містить у своєму геномі по-

слідовність нуклеїнової кислоти, що кодує білок Cry1Ab стійкості до комах, і послідовність нуклеїнової кислоти конкретної ділянки;

- вирощування насіння кукурудзи в рослину кукурудзи; та

- зараження рослини кукурудзи цільовою комахою, а потім збирання врожаю від рослини зі зменшеним пошкодженням рослини в порівнянні з іншими рослинами, які не містять послідовності нуклеїнової кислоти конкретної ділянки;

причому послідовність нуклеїнової кислоти конкретної ділянки вибрана щонайменше з однієї послідовності нуклеїнової кислоти, що складається з SEQ ID NO: 1, SEQ ID NO: 2, SEQ ID NO: 3, SEQ ID NO: 4, SEQ ID NO: 6 і SEQ ID NO: 7.

21. Спосіб селекції толерантної до гербіциду гліфосат рослини кукурудзи, який **відрізняється** тим, що передбачає:

- висівання щонайменше одного насіння кукурудзи, причому насіння кукурудзи містить у своєму геномі послідовність нуклеїнової кислоти, що кодує білок EPSPS, який забезпечує толерантність до гербіциду гліфосат, і послідовність нуклеїнової кислоти конкретної ділянки;

- вирощування насіння кукурудзи в рослину кукурудзи; та

- обприскування рослини кукурудзи ефективною кількістю гербіциду гліфосат, а потім збирання врожаю від рослини зі зменшеним пошкодженням рослини в порівнянні з іншими рослинами, які не містять послідовності нуклеїнової кислоти конкретної ділянки; причому послідовність нуклеїнової кислоти конкретної ділянки вибрана щонайменше з однієї послідовності нуклеїнової кислоти, що складається з SEQ ID NO: 1, SEQ ID NO: 2, SEQ ID NO: 3, SEQ ID NO: 4, SEQ ID NO: 6 і SEQ ID NO: 7.

22. Спосіб за п. 20 або 21, який **відрізняється** тим, що насіння кукурудзи містить у своєму геномі послідовність нуклеїнової кислоти, яка викладена в SEQ ID NO: 5.

23. Спосіб отримання стійкої до комах рослини кукурудзи, який **відрізняється** тим, що передбачає введення послідовності нуклеїнової кислоти, що кодує білок Cry1Ab стійкості до комах, і послідовності нуклеїнової кислоти конкретної ділянки в геном рослини кукурудзи, причому послідовність нуклеїнової кислоти конкретної ділянки вибрана щонайменше з однієї послідовності нуклеїнової кислоти, що складається з SEQ ID NO: 1, SEQ ID NO: 2, SEQ ID NO: 3, SEQ ID NO: 4, SEQ ID NO: 6 і SEQ ID NO: 7.

24. Спосіб отримання толерантної до гербіциду гліфосат рослини кукурудзи, який **відрізняється** тим, що передбачає введення послідовності нуклеїнової кислоти, що кодує білок EPSPS, який забезпечує толерантність до гербіциду гліфосат, і послідовності нуклеїнової кислоти конкретної ділянки в геном рослини кукурудзи, причому послідовність нуклеїнової кислоти конкретної ділянки вибрана щонайменше з однієї послідовності нуклеїнової кислоти, що складається з SEQ ID NO: 1, SEQ ID NO: 2, SEQ ID NO: 3, SEQ ID NO: 4, SEQ ID NO: 6 і SEQ ID NO: 7.

25. Спосіб за п. 23 або 24, який **відрізняється** тим, що передбачає введення послідовності нуклеїнової кислоти, яка викладена в SEQ ID NO: 5, у геном рослини кукурудзи.

26. Композиція, що містить полінуклеотиди, викладені в SEQ ID NO: 1 або SEQ ID NO: 2, яка **відрізняється** тим, що композиція містить кукурудзяне борошно грубого млива, кукурудзяне борошно, кукурудзяну олію, кукурудзяні рильця або кукурудзяний крохмаль.

27. Сільськогосподарський продукт або товар, який містить полінуклеотиди, викладені в SEQ ID NO: 1 або SEQ ID NO: 2, який **відрізняється** тим, що сільськогосподарський продукт або товар являє собою кукурудзяне борошно грубого млива, кукурудзяне борошно, кукурудзяну олію, кукурудзяний крохмаль, кукурудзяний глютен, кукурудзяну перепічку, косметичний засіб або наповнювач.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що період обертання фурми визначають залежно від кількості сопел із співвідношення:

$$T_{\text{обер.}} = T_{\text{од.}} \cdot n \cdot c,$$

де n - кількість сопел, шт.

C 21

(11) 127954

(51) МПК (2024.01)
C21C 1/02 (2006.01)
C21C 7/072 (2006.01)
C21C 7/064 (2006.01)
B22D 1/00
C21B 7/16 (2006.01)

(21) а 2020 08397
(24) 22.02.2024

(22) 28.12.2020

(72) Шевченко Анатолій Пилипович (UA), Кисляков Володимир Геннадійович (UA), Двоскін Борис Вульфович (UA), Єлісєєв Володимир Іванович (UA), Маначин Іван Олександрович (UA), Вергун Олександр Сергійович (UA), Шевченко Сергій Анатолійович (UA), Башмаков Олександр Михайлович (UA)

(73) ІНСТИТУТ ЧОРНОЇ МЕТАЛУРГІЇ НАЦІОНАЛЬНОЇ АКАДЕМІЇ НАУК УКРАЇНИ ІМ. З.І. НЕКРАСОВА
площа Академіка Стародубова, 1, м. Дніпро, 49107 (UA)

(54) СПОСІБ ПОЗАПІЧНОЇ ОБРОБКИ ЧАВУНУ ВДУВАННЯМ ДИСПЕРГОВАНОГО МАГНІЮ

(57) 1. Спосіб позапічної обробки чавуну вдуванням диспергованого магнію, який включає вдування в об'єм розплаву диспергованого магнію в газопорошковому струмені через щонайменше одне сопло зануреної фурми, яка обертається, який **відрізняється** тим, що диспергований магній вдувають з частинками 0,2-1,6 мм на глибину 0,5-4,5 м, при концентрації магнію в газоносії 6-50 кг/м³, зі швидкістю газопорошкового струменя на зрізі фурми 70-110 м/с і періодом обертання односоплової фурми $T_{\text{од.}} = 1,5-6,7$ с, який дорівнює тривалості спливання в розплав бульбашок суміші пари магнію з газоносієм, який визначається із співвідношення:

$$\tau = \frac{H_{\text{ф}}}{\left[g \cdot 0,01 H_{\text{ф}} \frac{\rho_{\text{м}} - \rho_{\text{р}}}{\rho_{\text{м}} + \rho_{\text{р}}} + \frac{\sigma}{0,01 H_{\text{ф}} (\rho_{\text{м}} + \rho_{\text{р}})} \right]^{1/2}} \text{ с},$$

де $H_{\text{ф}}$ - глибина занурення сопел фурми в чавун, м;
 $\rho_{\text{м}}$, $\rho_{\text{р}}$ - щільності, відповідно, металу і газу в бульбашці, кг/м³;

σ - поверхневий натяг, Н/м;

g - прискорення вільнопадаючого тіла, м/с².

(11) 127960

(51) МПК (2024.01)
C21C 5/30 (2006.01)
C21C 5/34 (2006.01)
C21C 5/48 (2006.01)
F27D 1/16 (2006.01)
F27D 17/00

(21) а 2021 03877
(24) 22.02.2024

(22) 02.07.2021

(72) Пантейков Сергій Петрович (UA)

(73) ПАНТЕЙКОВ СЕРГІЙ ПЕТРОВИЧ

просп. Металургів, 84-6, кв. 85, м. Кам'янське, 51928 (UA)

(54) ДОННА/БОКОВА ТРИПОТОВА ФУРМА ДЛЯ ПРОДУВКИ РОЗПЛАВУ КИСНЕМ І СПОСІБ ПОДАЧІ ДУТТЯ ДО АГРЕГАТУ ЧЕРЕЗ ДОННУ/БОКОВУ ТРИПОТОВУ ФУРМУ

(57) 1. Донна/бокова трипоткова фурма для продувки розплаву киснем, що являє собою вогнетривкий блок, до якого за його довжиною вставлено триканальне сопло типу "труба в трубі", яке містить три коаксіально розташовані із зазорами труби - внутрішню, проміжну і зовнішню, що утворюють центральний циліндричний канал та два кільцеві канали - середній канал та периферійний канал, для подачі технологічних газів, три патрубки з фланцями для підведення технологічних газів до каналів сопла, яка **відрізняється** тим, що проміжна і зовнішня труби сопла мають товщину стінки, не меншу за 4 мм, і виконані з низькотеплопровідного матеріалу, що має температуру плавлення, більшу за 2000 °С, при цьому площа поперечного перерізу середнього кільцевого каналу сопла складає 1-10 % від площі поперечного перерізу центрального циліндричного каналу сопла, а площа поперечного перерізу периферійного кільцевого каналу сопла більша за площу поперечного перерізу середнього кільцевого каналу сопла у k разів, де $k \geq 1,2$.

2. Фурма за п. 1, яка **відрізняється** тим, що форма поперечного перерізу вогнетривкого блока являє собою або коло, або овал, або квадрат, або прямокутник.

3. Фурма за п. 1 або 2, яка **відрізняється** тим, що кількість триканальних сопел у вогнетривкому блоці більша за одне.

4. Спосіб подачі дуття до агрегату через донну/бокову трипоткову фурму, що передбачає подачу до порожнини агрегату: кисню через центральний або середній канал триканального сопла фурми; захисного середовища або палива, відповідно, через середній або центральний канал триканального сопла фурми; нейтрального газу або інертного, відновного чи окислювального газу або суміші цих газів, через периферійний канал триканального сопла фурми, який **відрізняється** тим, що нейтральний газ або інертний, відновний чи окислювальний газ або їх суміш, подається через периферійний канал триканального сопла типу "труба в трубі" донної/бокової трипо-

токової фурми, проміжна і зовнішня труби якого мають товщину стінки, не меншу за 4 мм, і виконані з низькотеплопровідного матеріалу, що має температуру плавлення, більшу за 2000 °С, у підігрітому стані з температурою, значення якої вище за 500 °С, і має швидкість витікання із триканального сопла, яка перевищує швидкість витікання із триканального сопла газу, що подається через середній канал триканального сопла, у 1,3-2,5 разу.

5. Спосіб за п. 4, який **відрізняється** тим, що в ході процесу підігрівання брукхту, процесу продувки розплаву, процесу ошлакування футерівки, простоїв конвектора температура нейтрального газу або інертного, відновного чи окислювального газу або суміші цих газів, що подається через периферійний канал триканального сопла, має значення у межах ± 10 °С від значення температури робочого середовища у порожнині агрегату (брукхту, розплаву, шлаку, газу), яке контактує з робочим торцем донної/бокової трипотокової фурми.

(11) 127955

(51) МПК

C21D 9/46 (2006.01)**C21D 1/34** (2006.01)**C21D 1/673** (2006.01)**C23C 2/06** (2006.01)**C23C 2/12** (2006.01)**C25D 7/06** (2006.01)

(21) а 2021 01814

(22) 30.08.2019

(24) 22.02.2024

(31) РСТ/ІВ2018/056841

(32) 07.09.2018

(33) ІВ

(86) РСТ/ІВ2019/057323, 30.08.2019

(72) Гайєд Садок (FR)

(73) АРСЕЛОРМИТТАЛ

24-26, Boulevard d'Avranches L-1160 Luxembourg, Luxembourg (LU)

(54) СПОСІБ ПОКРАЩЕННЯ ДЕФОРМОВАНOSTІ СТАЛЕВИХ ЗАГОТОВОК ТА СТАЛЕВА ЗАГОТОВКА, ОДЕРЖАНА ЦИМ СПОСОБОМ

(57) 1. Спосіб покращення деформованості сталевих заготовки (1), причому зазначена сталева заготовка (1) має мікроструктуру, яка містить 5 % мартенситу, виражених у відсотках площі, ферит, бейніт і залишковий аустеніт, і має граничну міцність на розтяг, яка становить щонайменше 500 МПа, і яка має металічне покриття (14) на цинковій основі на щонайменше ділянці верхньої поверхні (2) і/або нижньої поверхні (4), який включає термообробку сталевих заготовки (1) за допомогою спрямування теплової енергії Q, яка забезпечується щонайменше одним джерелом тепла (16), на щонайменше частині товщини (6) по периферії зазначеної сталевих заготовки (1) для формування периферійної нагріваної ділянки (18) і термообробленого об'єму (22), причому температура зазначеного термообробленого об'єму (22) становить 400-1500 °С, причому весь об'єм сталевих заготовки (1) протягом операції термообробки залишається твердим, а товщина металічного покриття (14) після термообробки в області, яка покриває при термообробці об'єм (22), зменшується менше ніж на 30 %, у порівнянні з товщиною металічного покриття (14) в областях, які не покривають при термообробці об'єм (22), при цьому декілька сталевих заготовок (1) зібрані в пакет (12) заготовок і піддаються термообробці у вигляді партії щонайменше одним джерелом (16) тепла.

2. Спосіб за п. 1, в якому глибина D термообробленого об'єму (22) становить 0,5-50,0 мм.

3. Спосіб за п. 1 або 2, в якому тривалість термообробки становить від 1 мс до 10 хв.

4. Спосіб за будь-яким з пп. 1-3, в якому джерело тепла (16) рухається, а сталева заготовка (1) є нерухомою.

5. Спосіб за будь-яким з пп. 1-3, в якому джерело тепла (16) є нерухомим, а сталева заготовка (1) рухається в присутності зазначеного джерела тепла (16).

6. Спосіб за будь-яким з пп. 1-3, в якому джерело тепла (16) і сталева заготовка (1) є нерухомими.

7. Спосіб за будь-яким з пп. 1-3, в якому джерело тепла (16) спрямовується до однієї і тієї самої периферійної нагріваної ділянки (18) щонайменше двічі.

8. Спосіб за будь-яким з пп. 1-7, в якому вся поверхня, що утворює товщину (6) по периферії, піддається термообробці щонайменше за допомогою одного джерела тепла (16).

9. Спосіб за будь-яким з пп. 1-8, в якому джерело тепла (16) є лазером, який випромінює розфокусований лазерний промінь і який встановлений на промислового роботі (28).

10. Спосіб за будь-яким з пп. 1-3, в якому джерело тепла (16) є множиною нерухомих інфрачервоних трубок, у присутності яких рухаються сталеві заготовки (1).

11. Сталева заготовка (1), одержана способом за будь-яким з пп. 1-10, що має мікроструктуру, яка містить 5 % мартенситу, виражених у відсотках площі, ферит, бейніт і залишковий аустеніт, і має граничну міцність на розтяг, яка складає щонайменше 500 МПа, а також що містить металеве покриття (14) щонайменше на частині її верхньої і/або нижньої поверхні (2 і 4), причому товщина металічного покриття (14) в області, яка покриває при термообробці об'єм (22), менш ніж на 30 % менше товщини зазначеного металічного покриття (14) в областях, які не покривають при термообробці об'єм (22).

12. Сталева заготовка (1) за п. 11, в якій коефіцієнт збільшення отвору, вимірюваний в термообробленому об'ємі (22), щонайменше на 50 % вищий коефіцієнта збільшення отвору, вимірюваного в сталевій заготовці (1) зовні термообробленого об'єму (22).

Розділ Н:

Електрика

Н 02

- (11) **127947** (51) МПК
H02M 7/5387 (2007.01)
H02M 7/53862 (2007.01)
H05B 6/02 (2006.01)
- (21) а 2020 06241 (22) 28.09.2020
 (24) 22.02.2024
- (72) Герасименко Павло Юрійович (UA), Юрченко Олег Миколайович (UA)
- (73) **ІНСТИТУТ ЕЛЕКТРОДИНАМІКИ НАЦІОНАЛЬНОЇ АКАДЕМІЇ НАУК УКРАЇНИ**
 пр. Перемоги, 56, м. Київ-57, 03057 (UA)
- (54) **СПОСІБ КЕРУВАННЯ ТРАНЗИСТОРНИМ ПЕРЕТВОРЮВАЧЕМ ІЗ КОМБІНОВАНОЮ ТОПОЛОГІЄЮ МОСТОВОГО ТА НАПІВМОСТОВОГО ІНВЕРТОРІВ ДЛЯ ІНДУКЦІЙНОГО НАГРІВАЛЬНОГО ОБЛАДНАННЯ**
- (57) Спосіб керування транзисторним перетворювачем із комбінованою топологією мостового та напівмостового інверторів для індукційного нагрівального обладнання, який полягає в комбінуванні різних інтервалів вихідної напруги інвертора для регулювання вихідного струму перетворювача, який **відрізняється** тим, що при щільності імпульсів від 0,5 до 1 вихідний струм перетворювача регулюють комбінуванням інтервалу ввімкненого стану, коли вихідна напруга інвертора являє собою змінну напругу прямокутної форми, який отримано при функціонуванні мостової частини топології інвертора із комбінованою топологією, з інтервалом ввімкненого стану, який отримано при функціонуванні напівмостової частини топології інвертора із комбінованою топологією, а при щільності імпульсів від 0 до 0,5 вихідний струм перетворювача регулюють комбінуванням інтервалу ввімкненого стану, який отримано при функціонуванні напівмостової частини топології інвертора із комбінованою топологією, з інтервалом, коли вихідна напруга інвертора рівна нулю, який отримано при функціонуванні мостової частини топології інвертора із комбінованою топологією.

Н 04

- (11) **127949** (51) МПК (2024.01)
H04L 27/00
H04W 74/08 (2009.01)
H04L 5/00
- (21) а 2020 06784 (22) 15.02.2019
 (24) 22.02.2024
 (31) 201810247303.1
 (32) 23.03.2018
 (33) CN
 (86) PCT/CN2019/075187, 15.02.2019

- (72) Йіанг' Лей (CN), Ву Кай (CN), Лу Жі (CN)
- (73) **ВІВО МОБІЛЕ КОММУНІКАЦІОН КО., ЛТД.**
 #283, BBK Road, Wusha, Chang'an Dongguan, Guangdong 523860, China (CN)
- (54) **СПОСІБ ПЕРЕДАЧІ СИГНАЛІВ ТА МЕРЕЖЕВИЙ ПРИСТРІЙ**
- (57) 1. Спосіб передачі сигналів мережевим пристроєм, що включає: прослуховування перед розмовою (LBT) каналу в напрямку передачі блока сигналів синхронізації (SSB) перед здійсненням передачі SSB в нелицензованому діапазоні частот та передачу SSB при визначенні каналу як незайнятого, який **відрізняється** тим, що виконання LBT щодо каналу в напрямку передачі SSB включає виконання LBT для каналу в напрямку передачі SSB протягом необхідної тривалості, при цьому необхідну тривалість (NT) визначають як:
- $$NT=N$$
- або
- $$NT=T3+D4 \times N,$$
- де:
 N - тривалість оцінки стану каналу (CCA);
 T3 - тривалість затримки;
 D4 - довільне число від 0 до M;
 M - максимальна кількість оцінок стану каналу (CCA), що є додатним цілим числом менше 127.
2. Спосіб передачі сигналів за п. 1, який **відрізняється** тим, що M дорівнює 3.
3. Спосіб передачі сигналів за п. 1, який **відрізняється** тим, що виконання LBT щодо каналу в напрямку передачі SSB включає виконання LBT щодо каналу в напрямку передачі SSB в інтервальному символі мультиплексування з ортогональним частотним розділенням каналів (OFDM), у випадку якого інтервальный символ OFDM знаходиться між двох сусідніх SSB.
4. Спосіб передачі сигналів за п. 1, який **відрізняється** тим, що за наявності як мінімум двох послідовних SSB виконання LBT щодо каналу в напрямку передачі SSB включає:
 виконання LBT щодо каналу в напрямку передачі першого з як мінімум двох SSB; виконання LBT щодо каналу в напрямку передачі другого з як мінімум двох SSB в символі мультиплексування з ортогональним частотним розділенням каналів (OFDM) для першого SSB, якщо канал в напрямку передачі першого SSB визначено як зайнятий; передачу першого SSB в символі OFDM для першого SSB і відмову від передачі другого SSB в символі OFDM для другого SSB, якщо канал в напрямку передачі першого SSB визначено як незайнятий, причому другий SSB йде за першим і є сусіднім відносно нього.
5. Спосіб передачі сигналів за п. 4, який **відрізняється** тим, що виконання LBT щодо каналу в напрямку передачі SSB додатково включає виконання LBT щодо каналу в напрямку передачі третього з як мінімум двох SSB в символі OFDM для другого SSB, якщо канал в напрямку передачі першого SSB визначено як незайнятий, причому третій SSB йде за другим і є сусіднім відносно нього.
6. Спосіб передачі сигналів за будь-яким з пп. 1-5, який **відрізняється** тим, що мережевий пристрій не передає індекс SSB, що передають через нього.
7. Спосіб передачі сигналів за п. 6, який **відрізняється** тим, що відсутність передачі мережевим пристроєм індексу SSB, який передають через нього, реа-

лізують за допомогою одного з таких методів: мінімальна системна інформація, яка залишилася (RMSI), що передають мережевим пристроєм, не переносить індекс SSB, що передають мережевим пристроєм; та інформаційний елемент (IE), пов'язаний з індексом SSB, що передають мережевим пристроєм, не включений до технічної специфікації.

8. Мережевий пристрій, що включає: модуль прослуховування перед розмовою (LBT), призначений для виконання LBT щодо каналу в напрямку передачі блоку сигналів синхронізації (SSB) перед здійсненням передачі SSB в неліцензованому діапазоні частот; та передавальний модуль, призначений для передачі SSB при визначенні каналу як незайнятого, який **відрізняється** тим, що модуль LBT призначений для: виконання LBT для каналу в напрямку передачі SSB протягом необхідної тривалості, при цьому необхідну тривалість (NT) визначають як:

$$NT=N$$

або

$$NT=T3+D4 \times N,$$

де:

N - тривалість оцінки стану каналу (CCA);

T3 - тривалість затримки;

D4 - довільне число від 0 до M;

M - максимальна кількість оцінок стану каналу (CCA), що є додатним цілим числом менше 127.

9. Мережевий пристрій за п. 8, який **відрізняється** тим, що M дорівнює 3.

10. Мережевий пристрій за п. 8, який **відрізняється** тим, що модуль LBT призначений для виконання LBT щодо каналу в напрямку передачі SSB в інтервальному символі мультиплексування з ортогональним частотним розділенням каналів (OFDM), у випадку якого інтервальний символ OFDM знаходиться між двох сусідніх SSB.

11. Мережевий пристрій за п. 8, який **відрізняється** тим, що за наявності принаймні двох послідовних SSB модуль LBT включає: перший блок LBT, призначений для виконання LBT щодо каналу в напрямку передачі першого з як мінімум двох SSB; другий блок LBT, розрахований для виконання LBT щодо каналу в напрямку передачі другого з як мінімум двох SSB в символі мультиплексування з ортогональним частотним розділенням каналів (OFDM) для першого SSB, якщо канал в напрямку передачі першого SSB визначено як зайнятий; третій блок LBT, розрахований для передачі першого SSB в символі OFDM для першого SSB і відмову від передачі другого SSB в символі OFDM для другого SSB, якщо канал в напрямку передачі першого SSB визначено як незайнятий, причому другий SSB йде за першим і є сусіднім відносно нього.

12. Мережевий пристрій за п. 11, який **відрізняється** тим, що модуль LBT додатково включає четвертий блок LBT, розрахований на виконання LBT щодо каналу в напрямку передачі третього з як мінімум двох SSB в символі OFDM для другого SSB, якщо канал в напрямку передачі першого SSB визначено як незайнятий; причому третій SSB йде за другим і є сусіднім відносно нього.

13. Мережевий пристрій за будь-яким з пп. 8-12, який **відрізняється** тим, що він не передає індекс SSB, що передають через нього.

14. Мережевий пристрій за п. 13, який **відрізняється** тим, що відсутність передачі мережевим пристроєм індексу SSB, що передають через нього, реалізують у один з таких способів: мінімальна системна інформація, що залишилася (RMSI) і яку передають мережевим пристроєм, не переносить індекс SSB, що передають мережевим пристроєм; або інформаційний елемент (IE), пов'язаний з індексом SSB, що передають мережевим пристроєм, не включений до технічної специфікації.

15. Мережевий пристрій, що містить процесор, машиночитаний носій даних, на якому зберігають виконуваний процесором програму, що реалізує спосіб передачі сигналів за будь-яким із пп. 1-7.

16. Машиночитаний носій даних, на якому зберігають виконуваний процесором програму, що здійснює спосіб передачі сигналів за будь-яким із пп. 1-7.

(11) 127952

(51) МПК

H04W 24/02 (2009.01)

(21) а 2020 06925

(22) 25.03.2019

(24) 22.02.2024

(31) 201810265306.8

(32) 28.03.2018

(33) CN

(86) PCT/CN2019/079482, 25.03.2019

(72) Лі Венжін (CN), Ванг Бай'анг' (CN)

(73) BIBO МОБІЛЕ КОММУНІКАЦІОН КО., ЛТД.

#283, BBK Road, Wusha, Chang'an Dongguan, Guangdong 523860, China (CN)

(54) СПОСІБ КОНТРОЛЮ ПОВІДОМЛЕННЯ СИСТЕМИ ПОШУКОВОГО ВИКЛИКУ, АБОНЕНТСЬКЕ ОБЛАДНАННЯ МОБІЛЬНОГО ЗВ'ЯЗКУ ТА СЕРВЕР

(57) 1. Спосіб контролю повідомлення системи пошукового виклику, який використовується абонентським обладнанням мобільного зв'язку, що включає: визначення стану з'єднання абонентського обладнання мобільного зв'язку з пристроєм бездротового доступу, підключеним до інтернету; здійснення контролю повідомлення системи пошукового виклику відповідно до першого циклу пошукового виклику, коли виявлено, що абонентське обладнання мобільного зв'язку знаходиться в стані з'єднання з пристроєм бездротового доступу, який підключений до інтернету; здійснення контролю повідомлення системи пошукового виклику відповідно до другого циклу пошукового виклику, коли виявлено, що абонентське обладнання мобільного зв'язку не знаходиться в стані з'єднання з пристроєм бездротового доступу, який підключений до інтернету, причому перший цикл пошукового виклику триваліший за другий, що зазначений у стандарті мобільного зв'язку, а сервер у базовій мережі здійснює передачу повідомлення системи пошукового виклику відповідно до другого циклу пошукового виклику; після визначення стану з'єднання абонентського обладнання з пристроєм бездротового доступу і до початку здійснення контролю повідомлення системи пошукового виклику відповідно до першого циклу пошукового виклику спосіб додатково включає отримання ідентифікаційних даних абонентського облад-

нання мобільного зв'язку та даних про місцезнаходження пристрою бездротового доступу; передачу ідентифікаційних даних абонентського обладнання мобільного зв'язку та даних про місцезнаходження пристрою бездротового доступу на сервер; прийом першого повідомлення, переданого сервером, причому перше повідомлення включає дані про перший цикл пошукового виклику, згідно з яким здійснюється контроль повідомлення системи пошукового виклику, коли абонентське обладнання мобільного зв'язку знаходиться в стані з'єднання з пристроєм бездротового доступу;

після здійснення контролю через пристрій бездротового доступу повідомлення системи пошукового виклику відповідно до першого циклу пошукового виклику спосіб додатково включає:

прийом повідомлення системи пошукового виклику, переданого сервером через пристрій бездротового доступу;

після здійснення контролю через базову станцію повідомлення системи пошукового виклику відповідно до другого циклу пошукового виклику спосіб додатково включає прийом повідомлення системи пошукового виклику, переданого сервером через базову станцію.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що ідентифікаційні дані включають: адресу управління доступом до середовища (MAC) абонентського обладнання мобільного зв'язку, адресу інтернет-протоколу (IP), присвоєну абонентському обладнанню мобільного зв'язку пристроєм бездротового доступу, код міжнародного ідентифікатора обладнання мобільного зв'язку (IMEI) і код тимчасового ідентифікатора мобільного абонента (TMSI) абонентського обладнання мобільного зв'язку.

3. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що після етапу здійснення контролю повідомлення системи пошукового виклику відповідно до першого циклу пошукового виклику, коли абонентське обладнання мобільного зв'язку знаходиться в стані з'єднання з пристроєм бездротового доступу, він додатково включає передачу другого повідомлення на сервер через базову станцію після визначення від'єднання абонентського обладнання мобільного зв'язку від пристрою бездротового доступу, причому це повідомлення включає дані про відсутність з'єднання абонентського обладнання з пристроєм бездротового доступу.

4. Спосіб контролю повідомлення системи пошукового виклику, який використовується сервером у базовій мережі, що включає:

прийом від абонентського обладнання мобільного зв'язку через пристрій бездротового доступу ідентифікаційних даних абонентського обладнання мобільного зв'язку, а також даних про місцезнаходження пристрою бездротового доступу, підключеного до інтернету, в стані з'єднання з абонентським обладнанням, причому вважається, що абонентське обладнання знаходиться у стані з'єднання після прийому ідентифікаційних даних абонентського обладнання мобільного зв'язку та даних про місцезнаходження пристрою бездротового доступу;

передачу через пристрій бездротового доступу першого повідомлення на абонентське обладнання мобільного зв'язку відповідно до його ідентифікаційних даних і даних про місцезнаходження пристрою бездротового доступу, причому перше повідомлення вклю-

чає дані про перший цикл пошукового виклику, відповідно до якого за наявності з'єднання абонентського обладнання з пристроєм бездротового доступу здійснюється контроль повідомлення системи пошукового виклику, причому перший цикл пошукового виклику триваліший за другий, а другий дорівнює циклу, що зазначений у стандарті мобільного зв'язку, а сервер здійснює передачу повідомлення системи пошукового виклику відповідно до другого циклу пошукового виклику.

5. Спосіб за п. 4, який **відрізняється** тим, що після передачі першого повідомлення на абонентське обладнання мобільного зв'язку він додатково включає передачу повідомлення системи пошукового виклику на абонентське обладнання мобільного зв'язку через пристрій бездротового доступу після прийому цього повідомлення.

6. Абонентське обладнання мобільного зв'язку, яке включає:

модуль виявлення, який застосовується для визначення стану з'єднання абонентського обладнання мобільного зв'язку з пристроєм бездротового доступу, підключеним до інтернету; перший модуль обробки, який застосовується для здійснення контролю повідомлення системи пошукового виклику відповідно до першого циклу пошукового виклику в разі, якщо виявлена наявність з'єднання абонентського обладнання з пристроєм бездротового доступу, який підключений до інтернету; другий модуль обробки, який застосовується для здійснення контролю повідомлення системи пошукового виклику відповідно до другого циклу пошукового виклику у випадку, якщо виявлена відсутність з'єднання абонентського обладнання мобільного зв'язку з пристроєм бездротового доступу, який підключений до інтернету;

модуль збору даних, який застосовується для збору ідентифікаційних даних абонентського обладнання і даних про місцезнаходження пристрою бездротового доступу; перший передавальний модуль, який застосовується для передачі ідентифікаційних даних абонентського обладнання і даних про місцезнаходження пристрою бездротового доступу на сервер в базову мережу;

перший приймальний модуль, який застосовується для прийому першого повідомлення, переданого сервером, причому перше повідомлення включає дані про перший цикл пошукового виклику, згідно з яким здійснюється контроль повідомлення системи пошукового виклику, коли абонентське обладнання мобільного зв'язку знаходиться в стані з'єднання з пристроєм бездротового доступу;

другий приймальний модуль, який застосовується для прийому повідомлення системи пошукового виклику, переданого сервером через пристрій бездротового доступу, коли перший модуль обробки здійснює контроль повідомлення системи пошукового виклику відповідно до першого циклу пошукового виклику, та прийому повідомлення системи пошукового виклику, переданого сервером через базову станцію, коли другий модуль обробки здійснює контроль повідомлення системи пошукового виклику відповідно до другого циклу пошукового виклику;

причому перший цикл пошукового виклику триваліший за другий, а другий дорівнює циклу, що зазначений у стандарті мобільного зв'язку, а сервер здійс-

нює передачу повідомлення системи пошукового виклику відповідно до другого циклу пошукового виклику.

7. Абонентське обладнання мобільного зв'язку за п. 6, яке **відрізняється** тим, що ідентифікаційні дані включають: адресу управління доступом до середовища (MAC) абонентського обладнання мобільного зв'язку, адресу інтернет-протоколу (IP), присвоєну абонентському обладнанню мобільного зв'язку пристроєм бездротового доступу, код міжнародного ідентифікатора обладнання мобільного зв'язку (IMEI) і код тимчасового ідентифікатора мобільного абонента (TMSI) абонентського обладнання мобільного зв'язку.

8. Абонентське обладнання мобільного зв'язку за п. 6, яке **відрізняється** тим, що додатково включає другий передавальний модуль, що застосовується для передачі другого повідомлення на сервер через базову станцію при визначенні відключення абонентського обладнання від пристрою бездротового доступу, причому це повідомлення включає дані про відсутність з'єднання абонентського обладнання з пристроєм бездротового доступу.

9. Сервер, який використовується базовою мережею, який включає:

третій приймальний модуль, який застосовується для прийому від абонентського обладнання мобільного зв'язку через пристрій бездротового доступу ідентифікаційних даних абонентського обладнання мобільного зв'язку, що передаються цим обладнанням, а також даних про місцезнаходження пристрою бездротового доступу, підключеного до інтернету, в стані з'єднання з цим абонентським обладнанням, причому вважається, що абонентське обладнання знаходиться у стані з'єднання після прийому ідентифікаційних даних абонентського обладнання мобільного зв'язку та даних про місцезнаходження пристрою бездротового доступу;

третій передавальний модуль, який застосовується для передачі через пристрій бездротового доступу першого повідомлення на абонентське обладнання мобільного зв'язку відповідно до його ідентифікаційних даних і даних про місцезнаходження пристрою бездротового доступу, причому перше повідомлення включає в себе дані про перший цикл пошукового виклику, відповідно до якого за наявності з'єднання абонентського обладнання з пристроєм бездротового доступу здійснюється контроль повідомлення системи пошукового виклику, причому перший цикл пошукового виклику триваліший за другий, що зазначений у стандарті мобільного зв'язку, а сервер здійснює передачу повідомлення системи пошукового виклику відповідно до другого циклу пошукового виклику.

(72) Чен Лі (CN), Ву Юмін (CN), Ліанг Їнг (CN)

(73) **BIBO МОБІЛЕ КОММУНІКАЦІОН КО., ЛТД.**

#283, BBK Road, Wusha, Chang'an Dongguan, Guangdong 523860, China (CN)

(54) **СПОСІБ ВІДНОВЛЕННЯ З'ЄДНАННЯ ТА ПОВ'ЯЗАНИЙ З НИМ ПРИСТРІЙ**

(57) 1. Спосіб відновлення з'єднання, що застосовується до абонентського обладнання, який включає: виконання процесу перемикання каналів; ініціювання відновлення з'єднання на першому вузлі, якщо абонентським обладнанням виконана умова спрацьовування відновлення з'єднання, причому перший вузол включає як мінімум один вузол-джерело або один цільовий вузол в процесі перемикання каналу; при цьому умова спрацьовування відновлення з'єднання включає відмову перемикання каналів, яка включає як мінімум один з наступних варіантів: кількість спроб перемикання каналів досягає першого заданого значення; кількість відповідей умові перемикання каналів досягає другого заданого значення, і відбувається відмова перемикання каналів.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що умова спрацьовування відновлення з'єднання додатково включає як мінімум один з наступних варіантів: завершення роботи таймера, відмова перемикання каналів, відмова під час встановлення з'єднання, відмова відновлення з'єднання, програмні умови відновлення з'єднання і відмова радіоканалу (RLF).

3. Спосіб за п. 2, який **відрізняється** тим, що завершення роботи таймера включає як мінімум один з наступних варіантів: завершення роботи таймера перемикання каналів; завершення роботи програмного таймера; завершення роботи як мінімум одного таймера перемикання каналів; завершення роботи як мінімум одного програмного таймера; при цьому відмова перемикання каналів додатково включає як мінімум один з наступних варіантів: відмову при перемиканні каналів з вузла-джерела на цільовий вузол; відмову при перемиканні каналів з вузла-джерела на як мінімум один цільовий вузол; при цьому відмова відновлення з'єднання включає як мінімум один з наступних варіантів: відмову відновлення з'єднання, ініційованого на вузлі-джерелі; відмову відновлення з'єднання, ініційованого на цільовому вузлі; відмову відновлення з'єднання, ініційованого на як мінімум одному цільовому вузлі; при цьому RLF включає RLF, що виникає під час виконання як мінімум однієї умови перемикання каналів.

4. Спосіб за п. 3, який **відрізняється** тим, що час запуску таймера перемикання каналів включає як мінімум один з наступних варіантів: час в момент або після визначення абонентським обладнанням виконання умови перемикання каналів в команді на таке перемикання; час в момент або після визначення абонентським обладнанням виконання як мінімум однієї умови перемикання каналів як мінімум в одній команді на таке перемикання; час в момент або після прийому абонентським обладнанням команди на перемикання каналів; при цьому час зупинки таймера перемикання каналів включає як мінімум один з наступних варіантів: час в момент або після визначення абонентським обладнанням успішного або неуспішного перемикання каналів; час в момент або після визначення абонентським обладнанням успішного або неуспішного відновлення з'єднання; при цьому час запуску програмного таймера включає як мінімум

(11) **127953**

(51) МПК

H04W 36/26 (2009.01)

(21) а 2020 07063

(22) 03.04.2019

(24) 22.02.2024

(31) 201810302209.1

(32) 04.04.2018

(33) CN

(86) PCT/CN2019/081235, 03.04.2019

німум один з наступних варіантів: час в момент або після визначення абонентським обладнанням виконання умов перемикання каналів в команді на таке перемикання; час в момент або після визначення абонентським обладнанням виконання як мінімум однієї умови перемикання каналів як мінімум в одній команді на таке перемикання; час в момент або після прийому абонентським обладнанням команди на перемикання каналів; час в момент або після отримання контекстної інформації абонентського обладнання цільовим вузлом; час в момент або після отримання контекстної інформації абонентського обладнання як мінімум одним цільовим вузлом; при цьому час зупинки програмного таймера включає як мінімум один з наступних варіантів: час в момент або після визначення абонентським обладнанням успішного або неуспішного перемикання каналів; час в момент або після визначення абонентським обладнанням успішного або неуспішного відновлення з'єднання.

5. Спосіб за п. 3, який **відрізняється** тим, що кількість спроб перемикання каналів, що досягає першого заданого значення, включає досягнення кількості спроб перемикання каналів, що відповідає умові такого перемикання, що дорівнює першому заданому значенню.

6. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що ініціювання відновлення з'єднання на першому вузлі включає як мінімум один з наступних варіантів: ініціювання відновлення з'єднання на вузлі-джерелі; ініціювання відновлення з'єднання на цільовому вузлі; ініціювання відновлення з'єднання як мінімум на одному цільовому вузлі; ініціювання відновлення з'єднання на вузлі, що відповідає умові відновлення з'єднання, що виконується абонентським обладнанням, причому цей вузол включає як мінімум один вузол-джерело або цільовий вузол в процесі перемикання каналів; ініціювання відновлення з'єднання як мінімум на одному вузлі, що відповідає умові відновлення з'єднання, що виконується абонентським обладнанням, причому цей вузол включає в себе як мінімум один вузол-джерело або цільовий вузол в процесі перемикання каналів; ініціювання відновлення з'єднання на кожному з як мінімум двох цільових вузлів в процесі перемикання каналів послідовно доти, доки воно не буде успішно завершено або доки кількість спроб відновлення з'єднання не досягне третього заданого значення, або доки не буде завершена робота програмного таймера.

7. Спосіб за п. 6, який **відрізняється** тим, що ініціювання відновлення з'єднання як мінімум на одному цільовому вузлі включає: ініціювання відновлення з'єднання на як мінімум одному цільовому вузлі, що відповідає умові перемикання каналів, виконаній абонентським обладнанням; та ініціювання відновлення з'єднання на кожному з як мінімум двох цільових вузлів в процесі перемикання каналів послідовно доти, доки воно не буде успішно завершено або доки кількість спроб відновлення з'єднання не досягне третього заданого значення, або доки не буде завершена робота програмного таймера, що включає ініціювання відновлення з'єднання на кожному цільовому вузлі, що відповідає умові перемикання каналів, послідовно виконаній абонентським обладнанням, доти, доки воно не буде успішно завершено або доки кількість спроб відновлення з'єднання не досягне тре-

тього заданого значення, або доки не буде завершена робота програмного таймера.

8. Спосіб за п. 7, який **відрізняється** тим, що ініціювання відновлення з'єднання на як мінімум одному цільовому вузлі, що відповідає умові перемикання каналів, виконаній абонентським обладнанням, включає ініціювання відновлення з'єднання на як мінімум одному цільовому вузлі, що відповідає умові перемикання каналів, налаштованій командою на перемикання каналів і виконаній абонентським обладнанням.

9. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що додатково включає прийом інформації про відновлення з'єднання, що передається цільовим вузлом або вузлом-джерелом, причому ця інформація включає як мінімум одну умову або конфігурацію для відновлення з'єднання.

10. Спосіб за п. 9, який **відрізняється** тим, що прийом інформації про відновлення з'єднання, що передається вузлом-джерелом, включає: прийом інформації про відновлення з'єднання, що відправляється вузлом-джерелом, а також відправлення інформації про таке відновлення цільовим вузлом в контейнері на вузол-джерело або прийом інформації про відновлення з'єднання, що передається цільовим вузлом і включає прийом інформації про відновлення з'єднання, що відправляється цільовим вузлом або вузлом-джерелом, за допомогою команди на перемикання каналів або команди управління мобільним доступом.

11. Спосіб за п. 9, який **відрізняється** тим, що ініціювання відновлення з'єднання на першому вузлі включає як мінімум один з наступних варіантів: ініціювання відновлення з'єднання на першому вузлі за допомогою конфігурації відновлення з'єднання вузла-джерела; ініціювання відновлення з'єднання на першому вузлі за допомогою конфігурації відновлення з'єднання цільового вузла; ініціювання відновлення з'єднання на першому вузлі за допомогою конфігурації відновлення з'єднання першого вузла; ініціювання відновлення з'єднання на першому вузлі за допомогою конфігурації відновлення з'єднання в команді на перемикання каналів; ініціювання відновлення з'єднання на першому вузлі за допомогою як мінімум однієї конфігурації відновлення з'єднання в як мінімум одній з команд на перемикання каналів; ініціювання відновлення з'єднання на першому вузлі за допомогою конфігурації відновлення з'єднання цільового вузла, що відповідає умові перемикання каналів, виконаній абонентським обладнанням, або за допомогою конфігурації відновлення з'єднання як мінімум одного цільового вузла, що відповідає умові перемикання каналів, виконаній абонентським обладнанням; ініціювання відновлення з'єднання на першому вузлі за допомогою конфігурації відновлення з'єднання цільового вузла, що відповідає умові відновлення з'єднання, виконаній абонентським обладнанням, або за допомогою конфігурації відновлення з'єднання як мінімум одного цільового вузла, що відповідає умові відновлення з'єднання, виконаній абонентським обладнанням.

12. Абонентське обладнання, що включає: модуль перемикання для виконання процесу перемикання каналів; модуль відновлення для ініціювання відновлення з'єднання на першому вузлі, якщо абонентським обладнанням виконується умова спрацьовуван-

ня відновлення з'єднання; при цьому перший вузол включає як мінімум один вузол-джерело або цільовий вузол в процесі перемикання каналів; при цьому умова спрацювання відновлення з'єднання включає відмову перемикання каналів, яка включає як мінімум один з наступних варіантів: кількість спроб перемикання каналів досягає першого заданого значення; кількість відповідей умові перемикання каналів досягає другого заданого значення, і відбувається відмова перемикання каналів.

13. Абонентське обладнання за п. 12, яке **відрізняється** тим, що умова спрацювання відновлення з'єднання додатково включає як мінімум один з наступних варіантів: завершення роботи таймера, відмова під час встановлення з'єднання, відмова відновлення з'єднання, програмні умови відновлення з'єднання і відмова радіоканалу (RLF); при цьому завершення роботи таймера включає як мінімум один з наступних варіантів: завершення роботи таймера перемикання каналів; завершення роботи програмного таймера; завершення роботи як мінімум одного таймера перемикання каналів; завершення роботи як мінімум одного програмного таймера; при цьому відмова перемикання каналів включає як мінімум один з наступних варіантів: відмову при перемиканні каналів з вузла-джерела на цільовий вузол; відмову при перемиканні каналів з вузла-джерела на як мінімум один цільовий вузол; при цьому відмова відновлення з'єднання включає як мінімум один з наступних варіантів: відмову відновлення з'єднання, ініційованого на вузлі-джерелі; відмову відновлення з'єднання, ініційованого на цільовому вузлі; відмову відновлення з'єднання, ініційованого на як мінімум одному цільовому вузлі; при цьому RLF включає RLF, що виникає під час виконання як мінімум однієї умови перемикання каналів.

14. Абонентське обладнання за п. 13, яке **відрізняється** тим, що час запуску таймера перемикання каналів включає як мінімум один з наступних варіантів: час в момент або після визначення абонентським обладнанням виконання умови перемикання каналів в команді на таке перемикання; час в момент або після визначення абонентським обладнанням виконання як мінімум однієї умови перемикання каналів; час в момент або після прийому абонентським обладнанням команди на перемикання каналів; при цьому час зупинки таймера перемикання каналів включає як мінімум один з наступних варіантів: час в момент або після визначення абонентським обладнанням успішного або неуспішного перемикання каналів; час в момент або після визначення абонентським обладнанням успішного або неуспішного відновлення з'єднання; при цьому час запуску програмного таймера включає як мінімум один з наступних варіантів: час в момент або після визначення абонентським обладнанням виконання умов перемикання каналів в команді на таке перемикання; час в момент або після визначення абонентським обладнанням виконання як мінімум однієї умови перемикання каналів як мінімум в одній команді на таке перемикання; час в момент або після прийому абонентським обладнанням команди на перемикання каналів; час в момент або після отримання контекстної інформації абонентського обладнання цільовим вузлом; час в момент або після отримання кон-

текстної інформації абонентського обладнання як мінімум одним цільовим вузлом; при цьому час зупинки програмного таймера включає як мінімум один з наступних варіантів: час в момент або після визначення абонентським обладнанням успішного або неуспішного перемикання каналів; час в момент або після визначення абонентським обладнанням успішного або неуспішного відновлення з'єднання.

15. Абонентське обладнання за п. 13, яке **відрізняється** тим, що кількість спроб перемикання каналів, що досягає першого заданого значення, включає досягнення кількості спроб перемикання каналів, що відповідає умові такого перемикання, що дорівнює першому заданому значенню.

16. Абонентське обладнання за п. 12, яке **відрізняється** тим, що модуль відновлення включає як мінімум один з таких варіантів: перший блок відновлення, призначений для ініціювання відновлення з'єднання на вузлі-джерелі; другий блок відновлення, призначений для ініціювання відновлення з'єднання на цільовому вузлі; третій блок відновлення, призначений для ініціювання відновлення з'єднання як мінімум на одному цільовому вузлі; четвертий блок відновлення, призначений для ініціювання відновлення з'єднання на вузлі, що відповідає умові відновлення з'єднання, що виконується абонентським обладнанням, причому цей вузол включає як мінімум один вузол-джерело або цільовий вузол в процесі перемикання каналів; п'ятий блок відновлення, призначений для ініціювання відновлення з'єднання як мінімум на одному вузлі, що відповідає умові відновлення з'єднання, що виконується абонентським обладнанням, причому цей вузол включає як мінімум один вузол-джерело або цільовий вузол в процесі перемикання каналів; та шостий блок відновлення, призначений для ініціювання відновлення з'єднання на кожному з як мінімум двох цільових вузлів в процесі перемикання каналів послідовно доти, доки воно не буде успішно завершено або доки кількість спроб відновлення з'єднання не досягне третього заданого значення, або доки не буде завершена робота програмного таймера.

17. Абонентське обладнання за п. 16, яке **відрізняється** тим, що третій блок відновлення призначений для ініціювання відновлення з'єднання на як мінімум одному цільовому вузлі, що відповідає умові перемикання каналів, виконаній абонентським обладнанням; шостий блок відновлення призначений для послідовного ініціювання відновлення з'єднання на кожному з цільових вузлів, що відповідають умові перемикання каналів або умові відновлення з'єднання, виконаній абонентським обладнанням, доти, доки воно не буде успішно завершено або доки кількість спроб відновлення з'єднання не досягне третього заданого значення, або доки не буде завершена робота програмного таймера.

18. Абонентське обладнання за п. 17, яке **відрізняється** тим, що третій блок відновлення призначений для ініціювання відновлення з'єднання на як мінімум одному цільовому вузлі, що відповідає умові перемикання каналів, налаштованій командою перемикання каналів і виконаній абонентським обладнанням.

19. Абонентське обладнання за п. 12, яке **відрізняється** тим, що додатково включає приймальний модуль, призначений для прийому інформації про відновлення з'єднання, що передається цільовим вуз-

лом або вузлом-джерелом, причому ця інформація включає як мінімум одну умову або конфігурацію для відновлення з'єднання.

20. Абонентське обладнання за п. 19, яке **відрізняється** тим, що приймальний модуль призначений для прийому інформації про відновлення з'єднання, що відправляється вузлом-джерелом, і ця інформація відправляється цільовим вузлом в контейнері на вузол-джерело.

(11) 127951

(51) МПК
H04W 52/02 (2009.01)
H04W 68/02 (2009.01)
H04W 8/22 (2009.01)
H04W 88/06 (2009.01)

(21) а 2020 06924

(22) 27.03.2019

(24) 22.02.2024

(31) 201810265077.X

(32) 28.03.2018

(33) CN

(86) PCT/CN2019/079849, 27.03.2019

(72) Ван' Бай'ан' (CN), Лі Вен'жін (CN)

(73) ВІВО МОБІЛЕ КОММУНІКАЦІОН КО., ЛТД.

#283, BBK Road, Wusha, Chang'an Dongguan, Guangdong 523860, China (CN)

(54) СПОСІБ ВИЗНАЧЕННЯ МОЖЛИВОСТЕЙ UE, СПОСІБ ПЕРЕДАЧІ ІНФОРМАЦІЇ ПРО МОЖЛИВОСТІ UE, АБОНЕНТСЬКЕ ОБЛАДНАННЯ МОБІЛЬНОГО ЗВ'ЯЗКУ ТА СЕРВЕР

(57) 1. Спосіб визначення можливостей UE, що виконує базова мережа, який включає:

отримання через інтернет інформації про пристрій, відправленої абонентським обладнанням мобільного зв'язку, при цьому базова мережа налаштована таким чином, щоб зв'язуватись з абонентським обладнанням мобільного зв'язку через пристрій бездротового доступу, та інформація про пристрій включає як мінімум ідентифікаційні дані абонентського обладнання мобільного зв'язку та дані про розташування пристрою бездротового доступу;

відправлення через інтернет повідомлення-запиту на інформацію про можливості UE на абонентське обладнання мобільного зв'язку на підставі даних про пристрій;

отримання через інтернет інформації про можливості UE, яка відправляється абонентським обладнанням мобільного зв'язку у відповідь на повідомлення-запит, щоб визначити на підставі інформації про можливості UE, чи підтримує абонентське обладнання мобільного зв'язку регулювання періоду пошукового виклику в стані очікування; та

у випадку, якщо визначено, що абонентське обладнання мобільного зв'язку здатне регулювати період пошукового виклику в стані очікування, зміну періоду пошукового виклику та виклик абонентського обладнання мобільного зв'язку через інтернет відповідно до зміненого періоду пошукового виклику.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що, якщо абонентське обладнання підтримує регулювання періоду пошукового виклику в стані очікування, після отримання інформації про можливості UE, яка відправляється абонентським обладнанням у відповідь на повідомлення-запит, він додатково включає:

відправлення інструкції щодо зміни періоду пошукового виклику на абонентське обладнання мобільного зв'язку на підставі інформації про можливості UE, при цьому конфігурація інструкції щодо зміни розрахована на надання вказівок для абонентського обладнання мобільного зв'язку з контролю повідомлення системи пошукового виклику за першим періодом пошукового виклику;

перший період пошукового виклику буде більше другого періоду, а другий період - це період пошукового виклику, за яким абонентське обладнання мобільного зв'язку контролює повідомлення системи пошукового виклику, коли це обладнання не має доступу до пристрою бездротового доступу, підключеного до інтернету.

3. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що, якщо абонентське обладнання підтримує регулювання періоду пошукового виклику в стані очікування, після отримання інформації про можливості UE, яка відправляється абонентським обладнанням у відповідь на повідомлення-запит, він додатково включає: отримання повідомлення системи пошукового виклику, відправленого абонентським обладнанням мобільного зв'язку; та відправлення повідомлення системи пошукового виклику на абонентське обладнання мобільного зв'язку через пристрій бездротового доступу.

4. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що ідентифікаційні дані включають як мінімум: адресу управління доступом до середовища (MAC) абонентського обладнання мобільного зв'язку, IP-адресу, присвоєну абонентському обладнанню мобільного зв'язку пристроєм бездротового доступу, код міжнародного ідентифікатора обладнання мобільного зв'язку (IMEI) і код тимчасового ідентифікатора мобільного абонента (TMSI) абонентського обладнання мобільного зв'язку.

5. Спосіб передачі інформації про можливості UE, що виконує абонентське обладнання мобільного зв'язку, який включає:

відправлення через інтернет інформації про пристрій в базову мережу, при цьому абонентське обладнання мобільного зв'язку налаштоване таким чином, щоб зв'язуватись з базовою мережею через пристрій бездротового доступу, та інформація про пристрій включає як мінімум ідентифікаційні дані абонентського обладнання мобільного зв'язку та дані про розташування пристрою бездротового доступу; отримання через інтернет повідомлення-запиту, яке відправляється базовою мережею, на інформацію про можливості UE; при цьому повідомлення-запит відправляється базовою мережею після того, як на неї надходить інформація про пристрій; та налаштоване таким чином, щоб на підставі інформації про можливості UE визначати, чи підтримує абонентське обладнання мобільного зв'язку регулювання періоду пошукового виклику в стані очікування; відправлення через інтернет інформації про можливості UE в базову мережу у відповідь на повідомлення-запит; та

у випадку, якщо визначено, що абонентське обладнання мобільного зв'язку здатне регулювати період пошукового виклику в стані очікування, контроль через інтернет повідомлення системи пошукового виклику відповідно до зміненого періоду пошукового виклику.

6. Спосіб за п. 5, який **відрізняється** тим, що, якщо абонентське обладнання підтримує регулювання періоду пошукового виклику в стані очікування, після відправлення інформації про можливості UE в базову мережу у відповідь на повідомлення-запит, він додатково включає:

зміну періоду пошукового виклику при контролі повідомлення системи пошукового виклику на перший період пошукового виклику, при цьому перший період пошукового виклику буде більше другого періоду, а другий період - це період пошукового виклику, за яким абонентське обладнання мобільного зв'язку контролює повідомлення системи пошукового виклику, коли це обладнання не має доступу до пристрою бездротового доступу, підключеного до інтернету; та

контроль повідомлення системи пошукового виклику за першим періодом пошукового виклику.

7. Спосіб за п. 6, який **відрізняється** тим, що зміна періоду пошукового виклику під час контролю повідомлення пошукового виклику на перший період пошукового виклику включає:

отримання інструкції щодо зміни періоду пошукового виклику, яка відправляється базовою мережею на підставі інформації про можливості UE, при цьому конфігурація інструкції щодо зміни розрахована на надання вказівок для абонентського обладнання мобільного зв'язку з контролю повідомлення системи пошукового виклику за першим періодом пошукового виклику; та

зміну періоду пошукового виклику на перший період пошукового виклику відповідно до інструкції.

8. Спосіб за п. 6, який **відрізняється** тим, що зміна періоду пошукового виклику під час контролю повідомлення пошукового виклику на перший період пошукового виклику включає зміну періоду пошукового виклику на перший період пошукового виклику відповідно до раніше заданого значення періоду.

9. Спосіб за п. 5, який **відрізняється** тим, що, якщо абонентське обладнання підтримує регулювання періоду пошукового виклику в стані очікування, після відправлення інформації про можливості UE в базову мережу у відповідь на повідомлення-запит, він додатково включає отримання повідомлення системи пошукового виклику, яке відправляється базовою мережею через пристрій бездротового доступу.

10. Спосіб за п. 5, який **відрізняється** тим, що ідентифікаційні дані включають як мінімум: адресу управління доступом до середовища (MAC) абонентського обладнання мобільного зв'язку, IP-адресу, присвоєну абонентському обладнанню мобільного зв'язку пристроєм бездротового доступу, код міжнародного ідентифікатора обладнання мобільного зв'язку (IMEI) і код тимчасового ідентифікатора мобільного абонента (TMSI) абонентського обладнання мобільного зв'язку.

11. Сервер для виявлення можливості UE, що містить:

перший приймальний модуль, розрахований на отримання через інтернет інформації про пристрій, відправленої абонентським обладнанням мобільного зв'язку, при цьому базова мережа налаштована таким чином, щоб зв'язуватися з абонентським обладнанням мобільного зв'язку через пристрій бездротового доступу, та інформація про пристрій включає як мінімум ідентифікаційні дані абонентського обла-

днання мобільного зв'язку та дані про розташування пристрою бездротового доступу;

перший модуль відправлення, розрахований на відправлення через інтернет повідомлення-запиту на інформацію про можливості UE на абонентське обладнання мобільного зв'язку на підставі інформації про пристрій, отриманої першим приймальним модулем;

другий приймальний модуль, розрахований на отримання через інтернет інформації про можливості UE, яка відправляється абонентським обладнанням мобільного зв'язку у відповідь на повідомлення-запит, щоб визначити на підставі інформації про можливості UE, чи підтримує абонентське обладнання мобільного зв'язку регулювання періоду пошукового виклику в стані очікування; та

у випадку, якщо визначено, що абонентське обладнання мобільного зв'язку здатне регулювати період пошукового виклику в стані очікування, відбувається зміна періоду пошукового виклику та виклик абонентського обладнання мобільного зв'язку через інтернет відповідно до зміненого періоду пошукового виклику.

12. Сервер за п. 11, який **відрізняється** тим, що додатково включає:

другий модуль відправлення, розрахований на відправлення інструкції щодо зміни періоду пошукового виклику на абонентське обладнання мобільного зв'язку на підставі інформації про можливості UE, при цьому конфігурація інструкції щодо зміни розрахована на надання вказівок для абонентського обладнання мобільного зв'язку з контролю повідомлення системи пошукового виклику за першим періодом пошукового виклику;

перший період пошукового виклику буде більше другого періоду, а другий період - це період пошукового виклику, за яким абонентське обладнання мобільного зв'язку контролює повідомлення системи пошукового виклику, коли це обладнання не має доступу до пристрою бездротового доступу, підключеного до інтернету.

13. Сервер за п. 11, який **відрізняється** тим, що додатково включає:

третій приймальний модуль, розрахований на отримання повідомлення системи пошукового виклику, відправленого для абонентського обладнання мобільного зв'язку; та

третій модуль відправлення, розрахований на відправлення повідомлення системи пошукового виклику на абонентське обладнання мобільного зв'язку через пристрій бездротового доступу.

14. Сервер за п. 11, який **відрізняється** тим, що ідентифікаційні дані включають як мінімум: адресу управління доступом до середовища (MAC) абонентського обладнання мобільного зв'язку, IP-адресу, присвоєну абонентському обладнанню мобільного зв'язку пристроєм бездротового доступу, код міжнародного ідентифікатора обладнання мобільного зв'язку (IMEI) і код тимчасового ідентифікатора мобільного абонента (TMSI) абонентського обладнання мобільного зв'язку.

15. Абонентське обладнання мобільного зв'язку, яке включає:

четвертий модуль відправлення, розрахований на відправлення через інтернет інформації про пристрій в базову мережу, при цьому абонентське обладнання

мобільного зв'язку налаштоване таким чином, щоб зв'язуватись з базовою мережею через пристрій бездротового доступу, та інформація про пристрій включає як мінімум ідентифікаційні дані абонентського обладнання мобільного зв'язку та дані про розташування пристрою бездротового доступу;

четвертий приймальний модуль, розрахований на отримання через інтернет повідомлення-запиту, яке відправляється базовою мережею, на інформацію про можливість UE;

при цьому повідомлення-запит відправляється базовою мережею після того, як на неї надходить інформація про пристрій; та

налаштований таким чином, щоб на підставі інформації про можливість UE визначати, чи підтримує абонентське обладнання мобільного зв'язку регулювання періоду пошукового виклику в стані очікування;

п'ятий модуль відправлення, розрахований на відправлення через інтернет інформації про можливість UE в базову мережу у відповідь на повідомлення-запит; та

модуль контролю, розрахований, у випадку, якщо визначено, що абонентське обладнання мобільного зв'язку здатне регулювати період пошукового виклику в стані очікування, на контроль через інтернет повідомлення системи пошукового виклику відповідно до зміненого періоду пошукового виклику.

16. Абонентське обладнання мобільного зв'язку за п. 15, яке **відрізняється** тим, що додатково включає: модуль зміни, розрахований на зміну періоду пошукового виклику при контролі повідомлення системи пошукового виклику на перший період пошукового виклику, при цьому перший період пошукового виклику буде більше другого періоду, а другий період - це період пошукового виклику, за яким абонентське обладнання мобільного зв'язку контролює повідомлення системи пошукового виклику, коли це обладнання не має доступу до пристрою бездротового доступу, підключеного до інтернету.

17. Абонентське обладнання мобільного зв'язку за п. 16, яке **відрізняється** тим, що модуль зміни включає: приймальний блок, розрахований на отримання інструкції щодо зміни періоду пошукового виклику, яка відправляється базовою мережею на підставі інформації про можливість UE, при цьому конфігурація інструкції щодо зміни розрахована на надання вказівок для абонентського обладнання мобільного зв'язку з контролю повідомлення системи пошукового виклику за першим періодом пошукового виклику; та перший блок зміни, розрахований на зміну періоду пошукового виклику на перший період пошукового виклику відповідно до інструкції.

18. Абонентське обладнання мобільного зв'язку за п. 16, яке **відрізняється** тим, що модуль зміни включає: другий блок зміни, розрахований на зміну періоду пошукового виклику на перший період пошукового виклику відповідно до раніше заданого значення періоду.

19. Абонентське обладнання мобільного зв'язку за п. 15, яке **відрізняється** тим, що додатково включає: п'ятий приймальний модуль, розрахований на отримання повідомлення системи пошукового виклику, яке відправляється базовою мережею через пристрій бездротового доступу.

20. Абонентське обладнання мобільного зв'язку за п. 15, яке **відрізняється** тим, що ідентифікаційні дані

включають як мінімум: адресу управління доступом до середовища (MAC) абонентського обладнання мобільного зв'язку, IP-адресу, присвоєну абонентському обладнанню мобільного зв'язку пристроєм бездротового доступу, код міжнародного ідентифікатора обладнання мобільного зв'язку (IMEI) і код тимчасового ідентифікатора мобільного абонента (TMSI) абонентського обладнання мобільного зв'язку.

21. Сервер для виявлення можливості UE, що містить процесор та машинозчитуваний носій даних, на якому зберігається виконувана процесором програма, яка виконує спосіб визначення можливостей UE за будь-яким із пп. 1-4.

22. Абонентське обладнання мобільного зв'язку, що включає процесор та машинозчитуваний носій даних, на якому зберігається виконувана процесором програма, яка виконує спосіб передачі інформації про можливість UE за будь-яким з пп. 5-10.

23. Машинозчитуваний носій даних, на якому зберігається виконувана процесором програма, яка виконує спосіб визначення можливостей UE за будь-яким з пп. 1-4 або спосіб передачі інформації про можливість UE за будь-яким з пп. 5-10.

(11) 127950

(51) МПК
H04W 76/18 (2018.01)

(21) а 2020 06902

(22) 19.03.2019

(24) 22.02.2024

(31) 201810266175.5

(32) 28.03.2018

(33) CN

(86) PCT/CN2019/078633, 19.03.2019

(72) Чен Лі (CN)

(73) BIVO МОБІЛЕ КОММУНІКАЦІОН КО., ЛТД.
#283, BBK Road, Wusha, Chang'an Dongguan, Guangdong 523860, China (CN)

(54) СПОСІБ РОБОТИ У ВИПАДКУ ВТРАТИ ЗВ'ЯЗКУ ТА АБОНЕНТСЬКЕ ОБЛАДНАННЯ

(57) 1. Спосіб роботи абонентського обладнання у випадку втрати зв'язку, що включає:

визначення події відновлення зв'язку після його втрати, де подія відновлення зв'язку після його втрати включає виникнення позаштатної ситуації, що є втратою зв'язку зі стільником або відсутністю, або ігноруванням відновлення зв'язку, під час процедури відновлення зв'язку або виконання відновлення зв'язку після його втрати щонайменше у двох стільниках; виконання особливої операції, що є подією, що відповідає події відновлення зв'язку після його втрати, при цьому перший стільник представлений первинним стільником, а другий - вторинним (Scell); або перший стільник представлений Scell, а другий - первинним стільником; або перший стільник представлений Scell, а другий - іншим Scell.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що у випадку втрати зв'язку з першим стільником під час виконання процедури відновлення зв'язку після його втрати з цим стільником особлива операція включає в себе щонайменше одну з таких дій:

зупинку процедури відновлення зв'язку, що виконується у першому стільнику;

зупинку процедури відновлення зв'язку, що виконується у другому стільнику;

зупинку процедури відновлення зв'язку, що виконується у першому і другому стільниках;
виконання відновлення зв'язку за рахунок першого стільника у випадку втрати зв'язку з ним;
видачу звіту на верхній рівень про втрату зв'язку з першим стільником;

виконання відновлення зв'язку з першим стільником і продовження виконання процедури відновлення зв'язку, виконуваної в ньому;

виконання відновлення зв'язку з першим стільником після завершення виконання процедури відновлення зв'язку в ньому;

ігнорування втрати зв'язку з першим стільником;

у випадку втрати зв'язку з другим стільником під час виконання процедури відновлення зв'язку з першим стільником особлива операція включає щонайменше одну з таких дій:

ігнорування втрати зв'язку з другим стільником;

виконання відновлення зв'язку з другим стільником;

виконання відновлення зв'язку з другим стільником і продовження виконання процедури відновлення зв'язку, виконуваної у першому стільнику;

виконання відновлення зв'язку з другим стільником після завершення виконання процедури відновлення зв'язку у першому стільнику.

3. Спосіб за п. 2, який **відрізняється** тим, що під час видачі звіту про втрату зв'язку з першим стільником на верхній рівень запускається відмова радіоканалу (RLF), лічильник розсинхронізації або таймер, взаємопов'язаний з моніторингом радіоканалу (RLM) або RLF;

ігнорування втрати зв'язку, що виникла у другому стільнику, включає щонайменше одну з таких дій:

неввімкнення процедури відновлення зв'язку з другим стільником;

неввімкнення процедури відновлення зв'язку за рахунок першого стільника у випадку втрати зв'язку з другим;

неввімкнення процедури відновлення зв'язку з першим і другим стільниками у випадку втрати зв'язку з другим;

ігнорування втрати зв'язку, що виникла у першому стільнику, включає щонайменше одну з таких дій:

неввімкнення відновлення зв'язку з першим стільником;

неввімкнення процедури відновлення зв'язку з другим стільником у випадку втрати зв'язку з першим;

неввімкнення процедури відновлення зв'язку з першим і другим стільниками у випадку втрати зв'язку з першим;

виконання відновлення зв'язку з другим стільником включає щонайменше одну з таких дій:

запуск процедури відновлення зв'язку з другим стільником в першому стільнику;

запуск процедури відновлення зв'язку з другим стільником в тому самому стільнику;

запуск процедури відновлення зв'язку з другим стільником в першому і другому стільниках.

4. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що первинний стільник включає щонайменше один з наступних варіантів: первинний стільник (Pcell), первинний стільник в головній стільниковій групі (MCG), первинно-вторинний стільник (PScell) у вторинній стільниковій групі (SCG) і спеціальний стільник (SpCell).

5. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що виникнення позаштатної ситуації під час процедури відновлення зв'язку передбачає, що втрата зв'язку з

другим стільником відбувається до передачі преамбули в першому стільнику, причому під час процедури відновлення зв'язку преамбула виконується в першому стільнику, після того, як в ньому сталася втрата зв'язку; і

також передбачає, що відновлення зв'язку щонайменше у двох стільниках одночасно включає виконання цієї процедури після втрати зв'язку з першим і другим стільниками.

6. Спосіб за п. 5, який **відрізняється** тим, що особлива операція включає щонайменше одну з таких дій: виконання відновлення зв'язку з первинним стільником за рахунок цього самого стільника; виконання відновлення зв'язку з вторинним стільником (Scell) за рахунок первинного стільника;

виконання відновлення зв'язку зі стільником з особливим потенційним променем, де джерело з довільним доступом, що відповідає цьому потенційному променю, представлене джерелом з безконкурентним довільним доступом (CFRA);

виконання відновлення зв'язку з Scell за рахунок цього самого Scell;

виконання відновлення зв'язку з первинним стільником за рахунок Scell;

виконання відновлення зв'язку за рахунок первинного стільника і Scell одночасно;

виконання відновлення зв'язку з первинним стільником за рахунок цього самого стільника і, після завершення цієї процедури, виконання відновлення зв'язку з Scell за рахунок цього самого Scell, де перший стільник представлений первинним стільником, а другий - Scell, або перший стільник представлений Scell, а другий - первинний стільник.

7. Спосіб за п. 6, який **відрізняється** тим, що виконання відновлення зв'язку з первинним стільником за рахунок цього самого стільника включає:

виконання відновлення зв'язку з первинним стільником за рахунок цього самого стільника у випадку, якщо у кожного з декількох стільників є потенційний промінь, де джерело з довільним доступом, що відповідає цьому потенційному променю, представлене джерелом CFRA;

виконання відновлення зв'язку з Scell за рахунок цього самого Scell включає виконання відновлення зв'язку з Scell за рахунок цього самого Scell у випадку, якщо у кожного з декількох стільників є потенційний промінь, де джерело з довільним доступом, що відповідає цьому потенційному променю, представлене джерелом CFRA.

8. Спосіб за п. 6, який **відрізняється** тим, що під час особливої операції у випадку виконання відновлення зв'язку в будь-якому стільнику або ігнорується втрата зв'язку з іншим стільником, або здійснюється запобігання виконанню відновлення зв'язку в ньому; або у випадку, якщо потужність передачі за висхідним каналом абонентського обладнання недостатня для передачі преамбули у двох стільниках, відновлення зв'язку виконується тільки в одному стільнику за рахунок особливої операції; або

у випадку, якщо потужність передачі за висхідним каналом абонентського обладнання достатня для передачі преамбули у двох стільниках, відновлення зв'язку виконується одночасно в цих двох стільниках за рахунок особливої операції.

9. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що у випадку виникнення позаштатної ситуації під час про-

цедури відновлення зв'язку передбачається запобігання або ігнорування відновлення зв'язку за рахунок первинного стільника, а особлива операція передбачає скасування щонайменше однієї з наступних операцій: запуск індикації відновлення зв'язку з первинним стільником для верхнього рівня; запуск RLF за рахунок верхнього рівня; запуск таймера, взаємопов'язаного з RLM або RLF; виконання відліку за відсутності синхронізації на верхньому рівні.

10. Абонентське обладнання, що включає: модуль визначення, призначений для визначення події відновлення зв'язку після його втрати, в якому подія відновлення зв'язку після його втрати включає виникнення позаштатної ситуації під час процедури відновлення зв'язку або виконання відновлення зв'язку після його втрати щонайменше у двох стільниках; виконуючий модуль, призначений для виконання особливої операції, що відповідає події відновлення зв'язку після його втрати, при цьому перший стільник представлений первинним стільником, а другий - вторинним (Scell); або

перший стільник представлений Scell, а другий - первинним стільником; або перший стільник представлений Scell, а другий - іншим Scell.

11. Абонентське обладнання за п. 10, яке **відрізняється** тим, що у випадку втрати зв'язку з першим стільником під час виконання процедури відновлення зв'язку після його втрати з цим стільником особлива операція включає щонайменше одну з таких дій:

зупинку процедури відновлення зв'язку, що виконується у першому стільнику;

зупинку процедури відновлення зв'язку, що виконується у другому стільнику;

зупинку процедури відновлення зв'язку, що виконується у першому і другому стільниках;

виконання відновлення зв'язку за рахунок першого стільника у випадку втрати зв'язку з ним;

видачу звіту на верхній рівень про втрату зв'язку з першим стільником;

виконання відновлення зв'язку з першим стільником і продовження виконання процедури відновлення зв'язку, виконуваної в ньому;

виконання відновлення зв'язку з першим стільником після завершення виконання процедури відновлення зв'язку в ньому;

ігнорування втрати зв'язку з першим стільником;

у випадку втрати зв'язку з другим стільником під час виконання процедури відновлення зв'язку з першим стільником особлива операція включає щонайменше одну з таких дій:

ігнорування втрати зв'язку з другим стільником; виконання відновлення зв'язку з другим стільником;

виконання відновлення зв'язку з другим стільником і продовження виконання процедури відновлення зв'язку, виконуваної у першому стільнику;

виконання відновлення зв'язку з другим стільником після завершення виконання процедури відновлення зв'язку у першому стільнику.

12. Абонентське обладнання за п. 11, яке **відрізняється** тим, що під час видачі звіту про втрату зв'язку з першим стільником на верхній рівень запускається відмова радіоканалу (RLF), лічильник розсин-

хронізації або таймер, взаємопов'язаний з моніторингом радіоканалу (RLM) або RLF;

ігнорування втрати зв'язку, що виникла у другому стільнику, включає щонайменше одну з таких дій:

неввімкнення процедури відновлення зв'язку з другим стільником;

неввімкнення процедури відновлення зв'язку за рахунок першого стільника у випадку втрати зв'язку з другим;

неввімкнення процедури відновлення зв'язку з першим і другим стільниками у випадку втрати зв'язку з другим;

ігнорування втрати зв'язку, що виникла у першому стільнику, включає щонайменше одну з таких дій:

неввімкнення відновлення зв'язку з першим стільником;

неввімкнення процедури відновлення зв'язку з другим стільником у випадку втрати зв'язку з першим;

неввімкнення процедури відновлення зв'язку з першим і другим стільниками у випадку втрати зв'язку з першим;

виконання відновлення зв'язку з другим стільником включає щонайменше одну з таких дій:

запуск процедури відновлення зв'язку з другим стільником в першому стільнику;

запуск процедури відновлення зв'язку з другим стільником в тому самому стільнику;

запуск процедури відновлення зв'язку з другим стільником в першому і другому стільниках.

13. Абонентське обладнання за п. 10, яке **відрізняється** тим, що первинний стільник включає щонайменше один з наступних варіантів:

первинний стільник (Pcell), первинний стільник в головній стільниковій групі (MCG), первинно-вторинний стільник (PScell) у вторинній стільниковій групі (SCG) і спеціальний стільник (SpCell).

14. Абонентське обладнання за п. 10, яке **відрізняється** тим, що виникнення позаштатної ситуації під час процедури відновлення зв'язку передбачає, що втрата зв'язку з другим стільником відбувається до передачі преамбули в першому стільнику, причому, під час процедури відновлення зв'язку, преамбула виконується в першому стільнику, після того, як в ньому сталася втрата зв'язку; і

також передбачає, що відновлення зв'язку щонайменше у двох стільниках одночасно включає виконання цієї процедури після втрати зв'язку з першим і другим стільниками.

15. Абонентське обладнання за п. 14, яке **відрізняється** тим, що особлива операція включає як мінімум одну з таких дій: виконання відновлення зв'язку з первинним стільником за рахунок цього самого стільника; виконання відновлення зв'язку з вторинним стільником (Scell) за рахунок первинного стільника; виконання відновлення зв'язку зі стільником з особливим потенційним променем, де джерело з довільним доступом, що відповідає цьому потенційному променю, представлене джерелом з безконкурентним довільним доступом (CFRA);

виконання відновлення зв'язку з Scell за рахунок цього самого Scell; виконання відновлення зв'язку з первинним стільником за рахунок Scell;

виконання відновлення зв'язку за рахунок первинного стільника і Scell одночасно;

виконання відновлення зв'язку з первинним стільником за рахунок цього самого стільника і, після завершення цієї процедури, виконання відновлення зв'язку з Scell за рахунок цього самого Scell, де перший стільник представлений первинним стільником, а дру-

гий - Scell, або перший стільник являє собою Scell, а другий - первинний стільник.

ВІДОМОСТІ ПРО ДЕРЖАВНУ РЕЄСТРАЦІЮ КОРИСНИХ МОДЕЛЕЙ

Розділ А:

Життєві потреби людини

A 01

- (11) **155391** (51) МПК
A01H 1/08 (2006.01)
- (21) **u 2023 04622** (22) **02.10.2023**
(24) **22.02.2024**
(72) Міщенко Сергій Володимирович (UA)
(73) **ІНСТИТУТ ЛУБ'ЯНИХ КУЛЬТУР НАЦІОНАЛЬНОЇ
АКАДЕМІЇ АГРАРНИХ НАУК УКРАЇНИ**
вул. Терещенків, 45, м. Глухів, Сумська обл.,
41400 (UA)
- (54) **СПОСІБ ОТРИМАННЯ ТЕТРАПЛОЇДНИХ РОСЛИН
КОНОПЕЛЬ ПОСІВНИХ (CANNABIS SATIVA L.)**
- (57) Спосіб отримання тетраплоїдних рослин конопель посівних *Cannabis sativa* L., що включає використання пагонів, отриманих у культурі *in vitro*, культивування їх на агаризованому живильному середовищі Мура-сіге і Скуга з додаванням розчину колхіцину, адаптацію пагонів *in vivo*, який відрізняється тим, що пагони культивують протягом 72 годин на безгормональному середовищі, що містить 0,125 мг/л колхіцину та 30 г/л глюкози, з подальшим пасажем експлантів для індукції ризогенезу на середовище, що містить 0,4 мг/л індол-3-оцтової кислоти, 5 мг/л аскорбінової кислоти та 12,5 г/л глюкози, до бутонізації проводять ідентифікацію тетраплоїдних рослин за співвідношенням довжини листка і ширини, й видаляють рослини, у яких це співвідношення вище за 5,01.

- (11) **155365** (51) МПК
A01N 47/24 (2006.01)
- (21) **u 2023 03709** (22) **01.08.2023**
(24) **22.02.2024**
(72) Кнечунас Сергій Володимирович (UA)
(73) **АСА КЕМІКАЛ ГРУП ЛІМІТЕД**
41 Misiaouli & Kavazoglou Street, 2nd Floor, Office
203-D3, 3016 Limassol, Cyprus (CY)
- (54) **СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ФУНГІЦИДНОЇ КОМПОЗИЦІЇ**
- (57) 1. Спосіб одержання фунгіцидної композиції у формі концентрату емульсії, що містить пропіконазол, піраклостробін, боскалід та допоміжні агенти, в якому в органічному розчиннику при підвищеній температурі розчиняють боскалід, піраклостробін і пропікона-

- зол, додають допоміжні агенти і суміш перемішують з одержанням концентрату емульсії.
2. Спосіб за п. 1, який відрізняється тим, що як органічний розчинник використовують суміш аміду карбонової кислоти та естеру карбонової кислоти.
3. Спосіб за п. 1, який відрізняється тим, що як органічний розчинник використовують суміш диметилформаміду та етилацетату.
4. Спосіб за п. 1, який відрізняється тим, що розчинення боскаліду, піраклостробіну і пропіконазолу в органічному розчиннику проводять при температурі 40-60 °C.
5. Спосіб за п. 1, який відрізняється тим, що змішують пропіконазол, піраклостробін, боскалід та допоміжні агенти, при наступному співвідношенні компонентів, у мас. %:
- | | |
|------------------|-----------|
| пропіконазол | 15,0-25,0 |
| піраклостробін | 10,0-20,0 |
| боскалід | 7,0-15,0 |
| допоміжні агенти | решта. |
6. Спосіб за п. 1, який відрізняється тим, що змішують пропіконазол, піраклостробін, боскалід та допоміжні агенти, при наступному співвідношенні компонентів, у мас. %:
- | | |
|------------------|-----------|
| пропіконазол | 17,0-23,0 |
| піраклостробін | 12,0-18,0 |
| боскалід | 9,0-13,0 |
| допоміжні агенти | решта. |
7. Спосіб за п. 1, який відрізняється тим, що змішують пропіконазол, піраклостробін, боскалід та допоміжні агенти, при наступному співвідношенні компонентів, у мас. %:
- | | |
|------------------|-----------|
| пропіконазол | 18,0-20,0 |
| піраклостробін | 14,0-16,0 |
| боскалід | 11,0-13,0 |
| допоміжні агенти | решта. |
8. Спосіб за п. 1, який відрізняється тим, що пропіконазол, піраклостробін та боскалід змішують у співвідношенні 1,1-1,3:0,9-1,1:0,7-0,9.
9. Спосіб за п. 1, який відрізняється тим, що пропіконазол, піраклостробін та боскалід змішують у співвідношенні 1,2:1,0:0,8.

- (11) **155364** (51) МПК
A01N 47/24 (2006.01)
- (21) **u 2023 03708** (22) **01.08.2023**
(24) **22.02.2024**
(72) Кнечунас Сергій Володимирович (UA)
(73) **АСА КЕМІКАЛ ГРУП ЛІМІТЕД**
41 Misiaouli & Kavazoglou Street, 2nd Floor, Office
203-D3, 3016 Limassol, Cyprus (CY)
- (54) **СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ФУНГІЦИДНОЇ КОМПОЗИЦІЇ**

(57) 1. Спосіб одержання фунгіцидної композиції у формі суспензії, що містить пропіконазол, піраклостробін, боскалід та допоміжні агенти, який включає наступні стадії:

а) в першому реакторі об'єднують у кислому водному розчині боскалід та піраклостробін і диспергують одержану суміш,

б) в другому реакторі змішують олію та пропіконазол з одержанням емульсії,

в) змішують дисперсію боскаліду та піраклостробіну з першого реактора з емульсією пропіконазолу з другого реактора з одержанням суспензії.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що для створення кислого середовища використовують органічну кислоту.

3. Спосіб за п. 2, який **відрізняється** тим, що як органічну кислоту використовують монокарбонову, дикарбонову або трикарбонову кислоти.

4. Спосіб за п. 3, який **відрізняється** тим, що як органічну кислоту використовують кислоту, вибрану з наступної групи: мурашина кислота, оцтова кислота, пропіонова кислота, щавлева кислота, яблучна кислота, малінова кислота, бурштинова кислота, лимонна кислота або трифлуороцтова кислота.

5. Спосіб за п. 4, який **відрізняється** тим, що як органічну кислоту використовують лимонну кислоту.

6. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що рН фунгіцидної композиції становить 4,2-5,5.

7. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що одержання дисперсії боскаліду та піраклостробіну в першому реакторі та емульсії пропіконазолу в другому реакторі проводять в присутності допоміжних агентів.

8. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що змішують пропіконазол, піраклостробін, боскалід та допоміжні агенти, при наступному співвідношенні компонентів, у мас. %:

| | |
|------------------|-----------|
| пропіконазол | 15,0-25,0 |
| піраклостробін | 10,0-20,0 |
| боскалід | 7,0-15,0 |
| допоміжні агенти | решта. |

9. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що змішують пропіконазол, піраклостробін, боскалід та допоміжні агенти, при наступному співвідношенні компонентів, у мас. %:

| | |
|------------------|-----------|
| пропіконазол | 17,0-23,0 |
| піраклостробін | 12,0-18,0 |
| боскалід | 9,0-13,0 |
| допоміжні агенти | решта. |

10. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що змішують пропіконазол, піраклостробін, боскалід та допоміжні агенти, при наступному співвідношенні компонентів, у мас. %:

| | |
|------------------|-----------|
| пропіконазол | 18,0-20,0 |
| піраклостробін | 14,0-16,0 |
| боскалід | 11,0-13,0 |
| допоміжні агенти | решта. |

11. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що пропіконазол, піраклостробін та боскалід змішують у співвідношенні 1,1-1,3:0,9-1,1:0,7-0,9.

12. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що пропіконазол, піраклостробін та боскалід змішують у співвідношенні 1,2:1,0:0,8.

A 23

(11) 155354

(51) МПК (2024.01)
A23N 1/00
B02C 17/00

(21) u 2023 02218

(22) 10.05.2023

(24) 22.02.2024

(72) Бабенко Дмитро Володимирович (UA), Доценко Наталія Андріївна (UA), Горбенко Олена Андріївна (UA), Башуровська Ілона Вікторівна (UA)

(73) МИКОЛАЇВСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ АГРАРНИЙ УНІВЕРСИТЕТ

вул. Георгія Гонгадзе, 9, м. Миколаїв, 54008 (UA)

(54) ПРИСТРІЙ ДЛЯ ОТРИМАННЯ ТОМАТНОЇ ПУЛЬПИ З РЕГУЛЬОВАНИМ ПІДБАРАБАННЯМ

(57) Пристрій для отримання томатної пульпи з регульованим підбаранням, який містить перфорований барабан із розміщенням в ньому подрібнювальним пристроєм, який **відрізняється** тим, що в корпусі вмонтовані зовнішній барабан, внутрішній перфорований барабан та зовнішній перфорований барабан, всередині якого розташований зовнішній шнек та витки шнека; до внутрішньої поверхні корпусу прикріплена протиральна камера, в якій вмонтовані протиральні пластини; на зовнішній поверхні корпусу приварений лоток та подрібнювальний барабан, всередині якого розташований вал, пластини підбарання, диск, вісь, подрібнюючий ніж та регулювання підбарання.

A 41

(11) 155386

(51) МПК (2024.01)
A41D 13/00
F41H 3/00

(21) u 2023 04398

(22) 18.09.2023

(24) 22.02.2024

(72) Сліпченко Олександр Олександрович (UA)

(73) СЛІПЧЕНКО ОЛЕКСАНДР ОЛЕКСАНДРОВИЧ

вул. Підмосковка, буд. 13а, м. Канів, Черкаська обл., 19003 (UA)

(54) ЗАХИСНИЙ МАСКУВАЛЬНИЙ КОСТЮМ ДЛЯ ВІЙСЬКОВОСЛУЖБОВЦІВ

(57) 1. Захисний маскувальний костюм для військовослужбовців, виконаний у вигляді плаща з глибоким капюшоном з міцної водостійкої водонепроникної камуфляжної тканини типу Оксфорд Піксель або Оксфорд Мультикам, який **відрізняється** тим, що має багат шарову конструкцію, яка складається з основної тканини, підкладки з того самого матеріалу, проміжного тепловідбивного прошарку, виконаного з алюбонду, а також містить додатковий верхній маскувальний шар, виконаний у вигляді маскувальної сітки, прикріпленої поверх капюшона та в плечовій зоні з вплетеними стрічками з тієї ж камуфляжної тканини.

2. Захисний маскувальний костюм за п. 1, який **відрізняється** тим, що в шийно-плечовій зоні плащ по-

силений "сендвічем" із синтепону та додатковим шаром з алюбонду для маскувannya найбільш видимої зони.

3. Захисний маскувальний костюм за п. 1, який **відрізняється** тим, що рукави плаща оснащені манжетами-крильцями для додаткового захисту рук.

4. Захисний маскувальний костюм за п. 1, який **відрізняється** тим, що капюшон оснащений застібками Velcro, шнурівкою з фіксаторами та захисним козирком.

5. Захисний маскувальний костюм за п. 1, який **відрізняється** тим, що плащ оснащений щонайменше двома фастексами для швидкого та зручного надягання або скидання плаща.

| | |
|--------------------|-----------|
| МСГ | 3,0-4,0 |
| стеаринова кислота | 2,0-3,0 |
| цетиловий спирт | 1,0-2,0 |
| Emulight | 1,0-2,0 |
| ПЕО-400 | 6,0-7,0 |
| натрію КМЦ | 0,5-1,2 |
| масло вазелінове | 18,0-20,0 |
| вода очищена | решта. |

A 61

- (11) 155359 (51) МПК
A61J 3/04 (2006.01)
A61K 9/06 (2006.01)
A61P 17/02 (2006.01)
- (21) u 2023 03280 (22) 05.07.2023
(24) 22.02.2024
- (72) Остащенко Тетяна Миколаївна (UA), Дроздова Анна Олександрівна (UA), Тарасенко Вікторія Олександрівна (UA)
- (73) **ОСТАЩЕНКО ТЕТЯНА МИКОЛАЇВНА**
вул. Кн. Острозьких, 45/1, м. Київ, 01015 (UA)
- ДРОЗДОВА АННА ОЛЕКСАНДРІВНА**
вул. Володимира Івасюка, 64/56, кв. 82, м. Київ, 04213 (UA)
- ТАРАСЕНКО ВІКТОРІЯ ОЛЕКСАНДРІВНА**
вул. Григорія Ващенко, 3, кв. 160, м. Київ, 02144 (UA)
- (54) СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ МАЗІ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ РАН У ХІРУРГІЧНІЙ ПРАКТИЦІ
- (57) Спосіб одержання мазі для лікування ран у хірургічній практиці шляхом змішування в проточно-змішувальній установці активних фармацевтичних інгредієнтів (АФІ), гідрофобної основи мазі - моностеарату гліцерину (МСГ), стеаринової кислоти, цетилового спирту, Emulight, масла вазелінового та води очищеної, причому спочатку одержують розчин натрію карбоксиметилцелюлози (КМЦ) у воді очищеній, суспензії CO₂-екстракту ромашки, метилурацилу у ПЕО-400, суспензію ібупрофену у маслі вазеліновому, розчин лідокаїну гідрохлориду у ПЕО-400; в реактор-змішувач завантажують 90-95 % основи мазі і розігрівають її до 55-60 °С, решту основи змішують з АФІ, одержаними на стадії суспендування та розчинення, розігрівають до такої ж температури і додають до основи, що вже знаходиться в реакторі, температуру в реакторі підтримують на рівні 40-45 °С, зменшують тиск до 500-550 мм рт. ст. і включають роторно-пульсацийний апарат, циркулюють суміш протягом 40-45 хв, знімають вакуум, охолоджують до 35-40 °С і розфасовують в туби, за співвідношення компонентів, мас. %:
- | | |
|-----------------------------------|---------|
| лідокаїну гідрохлорид | 1,9-2,2 |
| ібупрофен | 3,5-4,5 |
| метилурацил | 3,5-4,5 |
| CO ₂ -екстракт ромашки | 3,5-4,5 |

- (11) 155361 (51) МПК (2024.01)
A61K 8/00
A61K 8/18 (2006.01)
A61K 9/06 (2006.01)

- (21) u 2023 03481 (22) 17.07.2023
(24) 22.02.2024
- (72) Волобуєв Сергій Анатолійович (UA)
- (73) **МІНРАН ЛІМІТЕД**
Griva Digeni & 28 Octovriou, 1, BLOCK E, Floor 2, Flat/Office 211-212, Egkomi, 2414 Nicosia, Cyprus (CY)
- (54) СПОСІБ ВИГОТОВЛЕННЯ КОСМЕТИЧНОГО ГЕЛЮ ДЛЯ ДОГЛЯДУ ЗА ШКІРОЮ ОБЛИЧЧЯ
- (57) 1. Спосіб виготовлення косметичного гелю для догляду за шкірою обличчя, що включає попередню підготовку компонентів і змішування їх для одержання косметичного гелю, який **відрізняється** тим, що попередньо розділяють компоненти гелю на чотири Фази - А, Б, В, Г, при цьому до Фази А включають: воду, гліцин, алантоїн, лізин, таурин, сорбітол, молочну кислоту, до Фази Б включають воду, кокоїл ізетіонат натрію, Glucotain Flex, кокоглюкозид, кокамідопропіл бетаїн 45 %, до Фази В - Ceramide Complex CLR, (BPM), до Фази Г - RESPLANTA OLIVE MB (BPM), Sharomix EG10, запашник Floressance Cameron 16385B, після цього розчиняють усі сухі активні компоненти і молочну кислоту Фази А у воді, нагрівають до 65 °С до повного розчинення всіх сухих компонентів, отримуючи прозорий розчин з легким жовтим відтінком, потім до всього об'єму води Фази Б додають суху ПАР - кокоїл ізетіонат натрію, нагрівають до повного його розчинення, після цього додають усі рідкі ПАР - Glucotain Flex, кокоглюкозид, кокамідопропіл бетаїн 45 %, перемішують протягом 20 хвилин, після чого вимикають нагрів, охолоджують суміш до 25 °С, а коли температура продукту буде нижчою за 25 °С, додають до Фази Б охолоджену до 25 °С Фазу А та Фазу В, ретельно перемішують, в окремій ємності змішують компоненти Фази Г - RESPLANTA OLIVE MB із Sharomix EG10 та запашником Floressance Cameron 16385B і додають Фазу Г до Фази Б, ретельно перемішуючи, вимірюють рН готового гелю і, якщо значення рН нижче за 5,5, то додають молочну кислоту порційно, отримуючи готовий прозорий гель з жовтим відтінком і перевіряючи його густину.
2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що компоненти використовують у такому співвідношенні, мас. %:
- | | |
|-----------------|-------|
| Фаза А: | |
| вода | 18,65 |
| гліцин | 0,5 |
| алантоїн | 0,25 |
| лізин | 0,5 |
| таурин | 0,5 |
| сорбітол | 5,0 |
| молочна кислота | 0,3 |

| | |
|-------------------------------------|------|
| Фаза Б: | |
| вода | 50 |
| кокоїл ізетіонат натрію | 2,0 |
| glucotain Flex | 0,6 |
| кокоглюкозид | 7,5 |
| кокамідопропіл бетаїн 45 % | 11, |
| Фаза В: | |
| ceramide Complex CLR | 1,5, |
| Фаза Г: | |
| RESPLANTA OLIVE MB (BPM) | 0,8 |
| Sharomix EG10 | 0,8 |
| запахник Floressance Cameron 16385B | 0,1. |

| | |
|---------------------------------|--------|
| молочна кислота | 0,10 |
| пентиленгліколь | 0,10 |
| гліцерин | 3,00 |
| вода | 47,70, |
| фаза Б: | |
| каприк каприлік тригліцериди | 10,00 |
| олія примули вечірньої | 3,00 |
| Emulpharma Coreosome | 6,00 |
| цетил-стеариловий спирт (50:50) | 2,50, |
| фаза В: | |
| каолін | 20,00 |
| глина зелена | 3,00 |
| глина Гассул | 0,10 |
| Aqua Shuttle | 0,10 |
| Pantrofina NMF | 0,50 |
| Bio Marine | 0,40 |
| ефірна олія бергамоту | 0,20 |
| Sharomix EG10 | 0,80 |
| бета-глюкан | 0,10 |
| алоє гель | 0,10 |
| матча зелена | 2,00. |

(11) 155360

(51) МПК

A61K 8/04 (2006.01)**A61K 8/99** (2017.01)**A61K 8/97** (2017.01)**A61K 8/19** (2006.01)**A61K 8/34** (2006.01)**A61K 9/06** (2006.01)

(21) у 2023 03328

(22) 06.07.2023

(24) 22.02.2024

(72) Волобуєв Сергій Анатолійович (UA)

(73) МІНРАН ЛІМІТЕД

Griva Digeni & 28 Octovriou, 1, BLOCK E, Floor 2, Flat/Office 211-212, Egkomi, 2414 Nicosia, Cyprus (CY)

(54) СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ МАСКИ ДЛЯ ОБЛИЧЧЯ

(57) 1. Спосіб одержання маски для обличчя, що включає попередню підготовку компонентів маски та змішування їх, який **відрізняється** тим, що попередньо розділяють компоненти маски на три фази - А, Б і В, при цьому до фази А включають: гіалуронат натрію, алантоїн, молочну кислоту, пентиленгліколь, гліцерин і воду, до фази Б включають: каприк каприлік тригліцериди, олію примули вечірньої, Emulpharma Coreosome і цетил-стеариловий спирт (50:50), до фази В включають: каолін, глину зелену, глину Гассул, Aqua Shuttle, Pantrofina NMF, Bio Marine, ефірну олію бергамоту, Sharomix EG10, бета-глюкан, алоє гель і матчу зелену, після цього здійснюють змішування сухих і рідких компонентів фази А і перед нагріванням добре перебивають і перемішують суміш, нагрівають до розчинення всіх сухих компонентів до 70-75 °С, в окремій ємності змішують всі компоненти фази Б, нагрівають суміш до 70-75 °С до розчинення всіх компонентів, а коли різниця між фазою А та фазою Б не буде більшою за 5-7 °С, поступово додають фазу Б до фази А при постійному перемішуванні (гомогенізації) при швидкості обертів до 3000 об./хв, продовжують перемішування (гомогенізацію) протягом 10-15 хвилин на тих самих обертах до одержання емульсії білого кольору, охолоджують емульсію до 30-40 °С, постійно гомогенізуючи емульсію на швидкості до 1000 об./хв, а при досягненні температури емульсії нижче 30 °С додають всі компоненти фази В і перемішують, використовуючи гомогенізатор, до одержання продукту світло-зеленого кольору, кремової (нерідкої) консистенції.

2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що використовують компоненти маски з наступним відсотковим вмістом, %:

| | |
|-------------------|------|
| фаза А: | |
| гіалуронат натрію | 0,10 |
| алантоїн | 0,20 |

A 63

(11) 155393

(51) МПК (2024.01)

A63F 13/87 (2014.01)**A63F 13/86** (2014.01)**A63B 71/00****A63F 13/803** (2014.01)**G06F 17/40** (2006.01)

(21) у 2023 04692

(22) 04.10.2023

(24) 22.02.2024

(72) Перекрестов Кирило Олександрович (UA)

(73) ПЕРЕКРЮСТОВ КИРИЛО ОЛЕКСАНДРОВИЧ

вул. Космонавтів, 3, кв. 6, м. Харків, 61000 (UA)

(54) СИСТЕМА ДЛЯ ПРОВЕДЕННЯ ГРИ У ГРОМАДСЬКИХ МІСЦЯХ З ВИКОРИСТАННЯМ ЕЛЕКТРИЧНИХ ТРАНСПОРТНИХ ЗАСОБІВ

(57) Система для проведення гри у громадських місцях з використанням електричних транспортних засобів, що містить електричні транспортні засоби гравців "пілотів", термінальні пристрої гравців "пілотів", що виконані з можливістю передачі даних за допомогою зовнішніх мереж Internet, термінальні пристрої гравців "навігаторів", що виконані з можливістю передачі даних за допомогою зовнішніх мереж Internet, сервер обробки даних, при цьому кожен електричний транспортний засіб гравця "пілота" оснащений GPS-модулем, а кожен термінальний пристрій гравця "пілота" та кожен термінальний пристрій гравця "навігатора" виконані з функцією voice-чата, при цьому кожен термінальний пристрій гравця "навігатора" виконаний з можливістю визначення реального географічного розташування електричного транспортного засобу відповідного гравця "пілота" на ігровій мапі місцевості, через взаємодію з сервером обробки даних, який виконаний з можливістю зберігання, обробки та автоматичного обміну даними за допомогою спеціального програмного забезпечення.

Розділ В:**Виконання операцій.
Транспортування****В 21**

- (11) **155371** (51) МПК (2024.01)
B21B 21/00
- (21) u 2023 04169 (22) 04.09.2023
(24) 22.02.2024
- (72) Король Радомир Миколайович (UA), Мироненко Микола Андрійович (UA), Мироненко Артем Юрійович (UA), Протопопова Наталія Андріївна (UA), Рябець Марина Анатоліївна (UA), Бардіна Єлизавета Радомирівна (UA), Гнеушева Вікторія Олександрівна (UA), Михайлик Денис Павлович (UA), Коваленко-Марченкова Євгенія Вікторівна (UA), Коваленко Олена Юріївна (UA), Кокоріна Вікторія Ігорівна (UA), Томарева-Патлахова Вікторія Валеріївна (UA), Діденко Анастасія Володимирівна (UA), Галацька Валентина Леонідівна (UA), Колісник Ольга Андріївна (UA), Козенков Дмитро Євгенович (UA), Лисенко Тетяна Іллівна (UA), Усиченко Ірина Володимирівна (UA), Каут Ольга Вікторівна (UA), Вишневська Марія Костянтинівна (UA), Крамаренко Аліса Василівна (UA), Алексєєнко Інна Анатоліївна (UA), Єськов Дмитро Олександрович (UA), Аніщенко Людмила Олександрівна (UA), Беркунов Віталій Романович (UA)
- (73) **КОРОЛЬ РАДОМИР МИКОЛАЙОВИЧ**
вул. Писаржевського, 1а, м. Дніпро, 49000 (UA)
- МИРОНЕНКО МИКОЛА АНДРІЙОВИЧ**
вул. Казакова, 4-а, кв. 47, м. Дніпро, 49107 (UA)
- МИРОНЕНКО АРТЕМ ЮРІЙОВИЧ**
вул. Високовольтна, 32, кв. 16, м. Дніпро, 49000 (UA)
- ПРОТОПОПОВА НАТАЛІЯ АНДРІЙВНА**
вул. Савкіна, 2, кв. 25, м. Дніпро, 49000 (UA)
- РЯБЕЦЬ МАРИНА АНАТОЛІЙВНА**
вул. Березинська, 20, кв. 12, м. Дніпро, 49000 (UA)
- БАРДІНА ЄЛИЗАВЕТА РАДОМИРІВНА**
вул. Паніахи, 77-А, корп. 3, кв. 29, м. Дніпро, 49000 (UA)
- ГНЕУШЕВА ВІКТОРІЯ ОЛЕКСАНДРІВНА**
вул. Патріотична, 82б, кв. 36, м. Запоріжжя, 69000 (UA)
- МИХАЙЛИК ДЕНИС ПАВЛОВИЧ**
вул. Українська, 31, кв. 117, м. Запоріжжя, 69000 (UA)
- КОВАЛЕНКО-МАРЧЕНКОВА ЄВГЕНІЯ ВІКТОРІВНА**
вул. Матроса Кошки, 3, м. Дніпро, 49000 (UA)
- КОВАЛЕНКО ОЛЕНА ЮРІЙВНА**
вул. Матроса Кошки, 3, м. Дніпро, 49000 (UA)
- КОКОРІНА ВІКТОРІЯ ІГОРІВНА**
вул. Цитрусова, 8-б, кв. 15, м. Запоріжжя, 69000 (UA)
- ТОМАРЕВА-ПАТЛАХОВА ВІКТОРІЯ ВАЛЕРІЙВНА**
пров. Понтонний, 9, м. Запоріжжя, 69000 (UA)

ДІДЕНКО АНАСТАСІЯ ВОЛОДИМИРІВНА
вул. Бочарова, 3, кв. 1, м. Запоріжжя, 69000 (UA)

ГАЛАЦЬКА ВАЛЕНТИНА ЛЕОНІДІВНА
вул. Казакова, 4-а, кв. 47, м. Дніпро, 49107 (UA)

КОЛІСНИК ОЛЬГА АНДРІЙВНА
вул. Максима Чиженка, 96, кв. 30, м. Кам'янське, 51938 (UA)

КОЗЕНКОВ ДМИТРО ЄВГЕНОВИЧ
пр. Івана Мазепи, 39, кв. 51, м. Дніпро, 49064 (UA)

ЛИСЕНКО ТЕТЯНА ІЛЛІВНА
пр. Д. Яворницького, 123, кв. 6, м. Дніпро, 49038 (UA)

УСІЧЕНКО ІРИНА ВОЛОДИМИРІВНА
пр. Д. Яворницького, 96, м. Дніпро, 49038 (UA)

КАУТ ОЛЬГА ВІКТОРІВНА
вул. Варшавська, 34, м. Дніпро, 49108 (UA)

ВИШНЕВСЬКА МАРІЯ КОСТЯНТИНІВНА
вул. Набережна Перемоги, 48, кв. 281, м. Дніпро, 49094 (UA)

КРАМАРЕНКО АЛІСА ВАСИЛІВНА
вул. Казакова, 4-а, кв. 11, м. Дніпро, 49107 (UA)

АЛЕКСЄЄНКО ІННА АНАТОЛІЙВНА
пров. Шлаковий, 25, м. Дніпро, 49082 (UA)

ЄСЬКОВ ДМИТРО ОЛЕКСАНДРОВИЧ
вул. Б. Хмельницького, 27, кв. 25, м. Кам'янське, 51938 (UA)

АНИЩЕНКО ЛЮДМИЛА ОЛЕКСАНДРІВНА
вул. М. Малиновського, 8, кв. 200, м. Дніпро, 49098 (UA)

БЕРКУНОВ ВІТАЛІЙ РОМАНОВИЧ
пров. 4-й Дорошенка, 4, м. Кам'янське, 51900 (UA)

(54) **СПОСІБ ВИГОТОВЛЕННЯ ПРЕЦЕНЗІЙНИХ ОСОБЛИВО ТОНКОСТІННИХ КАПІЛЯРНИХ ТРУБ ЗІ ЗВАРЮВАНИХ СТАЛЕЙ І СПЛАВІВ**

(57) Спосіб виробництва прецензійних особливо тонкостінних капілярних труб зі зварюваних сталей і сплавів зі зварної заготовки з наступною холодною деформацією з проміжними термічними обробками, який відрізняється тим, що зварну заготовку виконують спіралешовною зі зварюванням на оправці, а задля уникнення появи дефектів в зоні зварного шва і на вколосовній зоні при наступній холодній деформації перший прохід виконують з обтиском по товщині стінки 10 %, а другий - 20 % на циліндричній оправці, при цьому її діаметр підбирають таким, щоб мінімізувати вільне редукування.

В 23

(11) **155374** (51) МПК (2024.01)
B23H 1/00
B23H 7/00

(21) u 2023 04230 (22) 07.09.2023
(24) 22.02.2024

(72) Сергєєв Антон Олегович (UA), Боков Віктор Михайлович (UA), Шмельов Віталій Миколайович (UA)

(73) ЦЕНТРАЛЬНОУКРАЇНСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ
просп. Університетський, 8, м. Кропивницький,
25006 (UA)

(54) ЕЛЕКТРОЕРОЗІЙНА ГОЛОВКА РОЗМІРНОЇ ОБРОБКИ ДУГОЮ НА БАЗІ НАСТІЛЬНОГО СВЕРДЛУВАЛЬНОГО ВЕРСТАТА З РУЧНОЮ ПОДАЧЕЮ ЕЛЕКТРОДА-ІНСТРУМЕНТА ВІД ВАЛА-ШЕСТИРНИ

(57) Електроерозійна головка розмірної обробки дугою на базі настільного свердлувального верстата з ручною подачею електрода-інструмента від вала-шестирні, яка відрізняється тим, що на місце штурвала привода вала-шестирні встановлено самогальмівну передачу, наприклад однозахідну черв'ячну, з маховичком та рукояткою, а головка оснащується амперметром, що вимірює силу струму в процесі обробки, причому амперметр розташований в полі зору оператора.

| | |
|------------------|-----------|
| нікель (Ni) | 1,5-2,0 |
| марганець (Mn) | 1,0-1,4 |
| вольфрам (W) | 0,2-0,4 |
| молібден (Mo) | 0,09-0,14 |
| сталева оболонка | решта. |

(11) 155384 (51) МПК
B23K 35/30 (2006.01)

(21) u 2023 04366 (22) 15.09.2023

(24) 22.02.2024

(72) Кропачов Віталій Валерійович (UA)

(73) КРОПАЧОВ ВІТАЛІЙ ВАЛЕРІЙОВИЧ

вул. 50 років СРСР, б. 9, кв. 4, м. Торез, 86600 (UA)

(54) ПОРОШКОВИЙ ДРІТ ДЛЯ НАПЛАВЛЕННЯ

(57) Порошковий дріт для наплавлення, який складається зі сталеві оболонки і порошкоподібної шихти, що містить хром (Cr), молібден (Mo), кремній (Si), марганець (Mn), вуглець (C), який відрізняється тим, що у порошкоподібну шихту додатково введено ванадій (V) в кількості 0,3-0,6 мас. % та титан (Ti) в кількості 0,2-0,4 мас. %, а інші компоненти взяті в наступному співвідношенні, мас. %:

| | |
|------------------|---------|
| хром (Cr) | 4,7-5,9 |
| молібден (Mo) | 0,9-1,4 |
| кремній (Si) | 0,8-1,3 |
| марганець (Mn) | 0,6-1,0 |
| вуглець (C) | 0,2-0,3 |
| сталева оболонка | решта. |

(11) 155385 (51) МПК
B23K 35/30 (2006.01)

(21) u 2023 04367 (22) 15.09.2023

(24) 22.02.2024

(72) Кропачов Віталій Валерійович (UA)

(73) КРОПАЧОВ ВІТАЛІЙ ВАЛЕРІЙОВИЧ

вул. 50 років СРСР, б. 9, кв. 4, м. Торез, 86600 (UA)

(54) ПОРОШКОВИЙ ДРІТ ДЛЯ НАПЛАВЛЕННЯ

(57) Порошковий дріт для наплавлення, що складається зі сталеві оболонки і порошкоподібної шихти, яка містить хром, вуглець, нікель, який відрізняється тим, що у порошкоподібну шихту додатково введено марганець (Mn), вольфрам (W) та молібден (Mo), при наступному співвідношенні компонентів (в мас. %):

| | |
|-------------|---------|
| хром (Cr) | 27,0 |
| вуглець (C) | 3,5-4,0 |

(11) 155382 (51) МПК
B23K 35/30 (2006.01)

(21) u 2023 04364 (22) 15.09.2023

(24) 22.02.2024

(72) Кропачов Віталій Валерійович (UA)

(73) КРОПАЧОВ ВІТАЛІЙ ВАЛЕРІЙОВИЧ

вул. 50 років СРСР, б. 9, кв. 4, м. Торез, 86600 (UA)

(54) ПОРОШКОВИЙ ДРІТ ДЛЯ НАПЛАВЛЕННЯ

(57) Порошковий дріт для наплавлення, що складається зі сталеві оболонки та порошкоподібної шихти, яка містить хром (Cr), марганець (Mn), вуглець (C) та кремній (Si), який відрізняється тим, що у порошкоподібну шихту додатково введено вольфрам (W) в кількості 8-11 мас. % та ванадій (V) в кількості 0,2-0,5 мас. %, а інші компоненти взяті в наступному співвідношенні, мас. %:

| | |
|------------------|-----------|
| хром (Cr) | 2,2-3,5 |
| марганець (Mn) | 0,6-1,1 |
| вуглець (C) | 0,26-0,41 |
| кремній (Si) | 0,2-1,0 |
| сталева оболонка | решта. |

(11) 155383 (51) МПК
B23K 35/30 (2006.01)

(21) u 2023 04365 (22) 15.09.2023

(24) 22.02.2024

(72) Кропачов Віталій Валерійович (UA)

(73) КРОПАЧОВ ВІТАЛІЙ ВАЛЕРІЙОВИЧ

вул. 50 років СРСР, б. 9, кв. 4, м. Торез, 86600 (UA)

(54) ПОРОШКОВИЙ ДРІТ ДЛЯ НАПЛАВЛЕННЯ

(57) Порошковий дріт для наплавлення, що складається зі сталеві оболонки та порошкоподібної шихти, яка містить хром, бор, вуглець, марганець, який відрізняється тим, що у порошкоподібну шихту додатково введено кремній (Si) в кількості 0,2-1,0 мас. % і титан (Ti) в кількості 0,1-0,8 мас. %, а інші компоненти взяті в наступному співвідношенні, мас. %:

| | |
|------------------|-----------|
| хром (Cr) | 17,5-23,0 |
| бор (B) | 2,7-4,0 |
| вуглець (C) | 0,5-1,2 |
| марганець (Mn) | 0,5-1,0 |
| сталева оболонка | решта. |

B 27

(11) 155373 (51) МПК (2024.01)
B27M 1/00
B27M 3/26 (2006.01)
B65B 7/02 (2006.01)

- (21) **u 2023 04224** (22) **07.09.2023**
(24) **22.02.2024**
(72) Табацький Дмитро Анатолійович (UA)
(73) **ТАБАЦЬКИЙ ДМИТРО АНАТОЛІЙОВИЧ**
вул. Ушакова, буд. 4, м. Кривий Ріг, Дніпропетровська обл., 50000 (UA)
- (54) **ПАЛИВНИЙ ВИРІБ ДЛЯ ОТРИМАННЯ ТЕПЛОЄМНОГО ТЛІЮЧОГО ВУГІЛЛЯ**
- (57) 1. Паливний виріб для отримання теплоємного тліючого вугілля, переважно деревного тліючого вугілля, що являє собою поздовжню заготовку з деревини, яка містить ділянку деревини з технологічними поперечними глухими прорізами, який **відрізняється** тим, що заготовка з деревини містить поздовжню ділянку із інтегрально цільною структурою деревини, яка утворена під ділянкою деревини з технологічними поперечними глухими прорізами, які виконані вздовж заготовки на однаковій відстані одна від одної, з можливістю розміщення їх своїми кінцями в одній спільній для них площині, при цьому висота поздовжньої ділянки із інтегрально цільної структури дерева (h) під згаданими технологічними поперечними глухими прорізами взята не менше (0,3-0,8) h₁, де (h₁) - висота технологічних поперечних глухих прорізів, а ширина кожного технологічного поперечного глухого прорізу (s) дорівнює не більше (0,001-0,003) h₁.
2. Паливний виріб для отримання теплоємного тліючого вугілля за п. 1, який **відрізняється** тим, що відстань (b) одного технологічного поперечного глухого прорізу від іншого дорівнює (1/4-1/6) довжині заготовки.
3. Паливний виріб для отримання теплоємного тліючого вугілля за п. 1, який **відрізняється** тим, що поздовжня заготовка з цільної деревини в поперечному перерізі має форму кола, сектора, трикутника або прямокутника.

тор охолодження наддувного повітря складається з алюмінієвих верхнього та нижнього бачків, трубчастострічкової серцевини, впускних та випускних патрубків, причому серцевина радіатора охолодження двигуна складається з вертикально розміщених чотирьох рядів трубок, а серцевина радіатора охолодження наддувного повітря складається з трубок, розміщених вертикально, радіатор охолодження роздавальної коробки та радіатор охолодження гідромотора приводу вентилятора виконані з алюмінію та складаються з впускних та випускних патрубків та охолоджуючих трубок зі стрічками між ними.

2. Система охолодження за п. 1, яка **відрізняється** тим, що вентилятор розміщено в нижній частині блока радіаторів.

3. Система охолодження за п. 1, яка **відрізняється** тим, що блок радіаторів змонтовано на гумові буфери до внутрішньої частини корпусу машини за допомогою кронштейнів кріплення та болтів.

4. Система охолодження за п. 1, яка **відрізняється** тим, що радіатор охолодження двигуна та радіатор охолодження наддувного повітря змонтовано до корпусу блока радіаторів за допомогою болтів та планок.

5. Система охолодження за п. 1, яка **відрізняється** тим, що радіатор охолодження роздавальної коробки та радіатор охолодження гідромотора приводу вентилятора змонтовано за допомогою болтів та планок.

6. Система охолодження за п. 1, яка **відрізняється** тим, що серцевина радіатора охолодження наддувного повітря складається з 15 трубок.

7. Система охолодження за п. 1, яка **відрізняється** тим, що ширина трубок серцевини радіатора охолодження двигуна становить 4 мм, а відстань між трубками - 8мм.

8. Система охолодження за п. 1, яка **відрізняється** тим, що радіатор охолодження роздавальної коробки має 41 трубку, а радіатор охолодження гідромотора приводу вентилятора складається з 21 трубки.

В 60

- (11) **155395** (51) МПК (2024.01)
B60K 11/00
F01P 3/18 (2006.01)
- (21) **u 2023 04958** (22) **23.10.2023**
(24) **22.02.2024**
(72) Лагодін Олександр Вікторович (UA)
(73) **ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ "КОНСТРУКТОРСЬКЕ БЮРО "БЕРИЛ"**
вул. Микільсько-Слобідська, буд. 6В, м. Київ, 02002 (UA)
- (54) **СИСТЕМА ОХОЛОДЖЕННЯ ДВИГУНА ВНУТРІШНЬОГО ЗГОРЯННЯ ДОРОЖНЬО-БУДІВЕЛЬНОЇ МАШИНИ**
- (57) 1. Система охолодження двигуна внутрішнього згоряння дорожньо-будівельної машини, що містить блок радіаторів, яка **відрізняється** тим, що блок радіаторів, що містить радіатор охолодження роздавальної коробки, радіатор охолодження гідромотора приводу вентилятора, радіатор охолодження двигуна, радіатор охолодження наддувного повітря, змонтовано на гумові буфери до внутрішньої частини корпусу машини, радіатор охолодження двигуна та радіа-

- (11) **155392** (51) МПК (2024.01)
B60L 9/10 (2006.01)
H02J 15/00
- (21) **u 2023 04635** (22) **02.10.2023**
(24) **22.02.2024**
(72) Сулим Андрій Олександрович (UA), Хозя Павло Олександрович (UA)
(73) **ДЕРЖАВНЕ ПІДПРИЄМСТВО "УКРАЇНСЬКИЙ НАУКОВО-ДОСЛІДНИЙ ІНСТИТУТ ВАГОНОБУДУВАННЯ"**
вул. Івана Приходька, буд. 33, м. Кременчук, Полтавська обл., 39621 (UA)
- (54) **ПРИСТРІЙ ДЛЯ КЕРУВАННЯ ЕНЕРГЕТИЧНИМИ ПРОЦЕСАМИ НА ЕЛЕКТРОРУХОМОМУ СКЛАДІ З КОНДЕНСАТОРНИМ НАКОПИЧУВАЧЕМ**
- (57) 1. Пристрій для керування енергетичними процесами на електрорухомому складі з конденсаторним накопичувачем, що містить задатчик швидкості, блок розрядження, блок релейної нелінійності з гістерезисом, перший, другий, третій, четвертий, п'ятий, шостий і сьомий суматори, перший, другий і третій регулятори, перший, другий і третій широтно-імпульсні моду-

лятори, перший, другий і третій формувачі імпульсів на силові ключі, перший, другий і третій логічні блоки АБО, перший блок порівняння з формувачем дискретного сигналу, при цьому вихід задатчика швидкості з'єднаний з входами блока розрядження і першого суматора, вихід якого з'єднаний з входом блока релейної нелінійності з гістерезисом, вихід блока релейної нелінійності з гістерезисом з'єднаний з входом першого логічного блока АБО, вхід другого суматора з'єднаний з виходом блока розрядження, а вихід з'єднаний з входом першого регулятора, входи третього суматора з'єднані з виходами першого регулятора та першого широтно-імпульсного модулятора, а вихід з'єднаний з входом першого формувача імпульсів на силовий ключ, вихід першого формувача імпульсів на силовий ключ з'єднаний з входом першого логічного блока АБО, виходи четвертого та п'ятого суматорів з'єднані з входами другого та третього регуляторів відповідно, входи шостого суматора з'єднані з виходом другого регулятора та другим широтно-імпульсним модулятором, а вихід з'єднаний з входом другого формувача імпульсів на силовий ключ, входи сьомого суматора з'єднані з виходом третього регулятора та третім широтно-імпульсним модулятором, а вихід з'єднаний з входом третього формувача імпульсів на силовий ключ, вихід другого формувача імпульсів на силовий ключ з'єднаний з другим логічним блоком АБО, вихід третього формувача імпульсів на силовий ключ з'єднаний з третім логічним блоком АБО, при цьому входи пристрою виконані з можливістю з'єднання з розташованими на електрорухомому складі датчиками струму та напруги контактної мережі, датчиками струму і напруги конденсаторного накопичувача, датчиками струму та швидкості електродвигуна, блоком введення даних та обмежувальних параметрів, а виходи пристрою виконані з можливістю з'єднання з розташованими на електрорухомому складі силовим перетворювачем конденсаторного накопичувача, керованим комутатором контактної мережі і силовим ключем у колі гальмівного резистора, який **відрізняється** тим, що він додатково містить блок розрахунку параметрів, блок запису даних, другий і третій блоки порівняння з формувачем дискретного сигналу, восьмий суматор, блок зміни алгоритму і логічний блок НІ, при цьому виходи блока розрахунку параметрів з'єднані з блоком розрядження і блоком запису даних, вхід першого блока порівняння з формувачем дискретного сигналу з'єднаний з виходом восьмого суматора, вихід другого блока порівняння з формувачем дискретного сигналу з'єднаний з входом блока розрядження, вхід третього блока порівняння з формувачем дискретного сигналу з'єднаний з виходом восьмого суматора, а виходи з'єднані з логічним блоком НІ та другим логічним блоком АБО, вихід блока зміни алгоритму з'єднаний з блоком розрядження, а вихід логічного блока НІ з'єднаний з третім логічним блоком АБО, при цьому входи пристрою виконані з можливістю з'єднання з розташованими на електрорухомому складі датчиком напруги електродвигуна, датчиками струму та напруги гальмівного резистора, датчиками температури конденсаторного накопичувача та навколишнього середовища, контролером машиніста через блок узгодження, датчиком маси електрорухомого складу, а виходи пристрою виконані з можливістю з'єднання з розташованою на еле-

ктрорухомому складі системою керування вищого рівня, вихід якої з'єднаний з силовим перетворювачем електродвигуна.

2. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що його входи виконані з можливістю з'єднання з допомогою блока розрахунку параметрів з розташованими на електрорухомому складі датчиками струму та напруги контактної мережі, датчиками струму та напруги електродвигуна, датчиком швидкості електродвигуна, датчиками струму і напруги конденсаторного накопичувача, датчиками струму та напруги гальмівного резистора, за допомогою восьмого суматора з датчиком температури конденсаторного накопичувача і датчиком температури навколишнього середовища, за допомогою блока розрядження з блоком введення даних та обмежувальних параметрів, датчиком маси електрорухомого складу та контролером машиніста через блок узгодження і задатчик швидкості, при цьому вхід першого суматора виконаний з можливістю з'єднання з датчиком швидкості електродвигуна, другий вхід другого суматора виконаний з можливістю з'єднання з датчиком струму контактної мережі, входи першого блока порівняння з формувачем дискретного сигналу виконані з можливістю з'єднання з блоком введення даних та обмежувальних параметрів, входи другого та третього блоків порівняння з формувачем дискретного сигналу виконані з можливістю з'єднання з датчиком напруги контактної мережі і блоком введення даних та обмежувальних параметрів.

3. Пристрій за п. 1, який **відрізняється** тим, що його входи виконані з можливістю з'єднання з допомогою блока розрахунку параметрів з розташованою на електрорухомому складі системою керування вищого рівня, за допомогою першого та третього логічних блоків АБО з керованими ключами силового перетворювача конденсаторного накопичувача, за допомогою другого логічного блока АБО з керованим ключем кола гальмівного резистора, за допомогою першого блока порівняння з формувачем дискретного сигналу з керованим ключем силового перетворювача конденсаторного накопичувача, за допомогою блока розрядження та другого блока порівняння з формувачем дискретного сигналу, керованим комутатором контактної мережі, датчиком маси електрорухомого складу і блоком введення даних та обмежувальних параметрів, при цьому виходи блока розрядження і другого блока порівняння з формувачем дискретного сигналу виконані з можливістю з'єднання з керованим контактором контактної мережі.

B 61

(11) 155372

(51) МПК
B61C 15/04 (2006.01)

(21) u 2023 04199

(22) 06.09.2023

(24) 22.02.2024

(72) Ковтанець Максим Володимирович (UA), Могила Валентин Іванович (UA), Ноженко Володимир Сергійович (UA), Морнева Марина Олегівна (UA), Ковтанець Тетяна Миколаївна (UA), Папуков Анатолій Миколайович (UA)

(73) СХІДНОУКРАЇНСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ ІМЕНІ ВОЛОДИМИРА ДАЛЯ

вул. Іоанна Павла II, 17, м. Київ, 01042 (UA)

(54) СПОСІБ ПОКРАЩЕННЯ ФІЗИКО-МЕХАНІЧНИХ ВЛАСТИВОСТЕЙ ПОВЕРХНІ ГОЛОВКИ РЕЙКИ

(57) Спосіб покращення фізико-механічних властивостей поверхні головки рейки, який здійснюється за рахунок того, що виконують швидке нагрівання поверхні рейки, а потім її швидке охолодження, який **відрізняється** тим, що покращення фізико-механічних властивостей поверхні головки рейки реалізують шляхом дугового імпульсного зміцнення її поверхні завдяки впливу на поверхню високої температури, що передається поверхні від стовпа електричної дуги, що має зворотну полярність, при цьому імпульсний характер струму дозволяє обмежити кількість тепла, яка передається для уникнення розплавлення та деформації.

(54) ГАЛЬМІВНА КОЛОДКА

(57) Гальмівна колодка, яка містить металевий каркас та чавунне фрикційне робоче тіло колодки з суцільним гребеневим фігурним пазом, яка **відрізняється** тим, що у робочому тілі колодки виконані отвори, у які групами розміщені вставки, виконані з композиційного фрикційного матеріалу, з коефіцієнтом тертя вище коефіцієнта тертя основи, і бічні вставки, виконані у вигляді профільних елементів, що знаходяться в контакт з гребеневою поверхнею колеса, що взаємодіє з бічною поверхнею рейки, при цьому бічні вставки виконані з антифрикційного композиційного матеріалу з коефіцієнтом тертя нижче коефіцієнта тертя матеріалу основи та матеріалу вставок основної ділянки тіла колодки.

В 64

(11) 155381

(51) МПК (2024.01)

B61H 1/00

F16D 69/02 (2006.01)

F16D 65/02 (2006.01)

(21) u 2023 04363

(22) 15.09.2023

(24) 22.02.2024

(72) Ковтанець Максим Володимирович (UA), Могила Валентин Іванович (UA), Ноженко Володимир Сергійович (UA), Бойко Григорій Олексійович (UA), Сергієнко Оксана Вікторівна (UA), Ковтанець Тетяна Миколаївна (UA)

(73) СХІДНОУКРАЇНСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ ІМЕНІ ВОЛОДИМИРА ДАЛЯ

вул. Іоанна Павла II, буд. 17, м. Київ, 01042 (UA)

(54) ГАЛЬМІВНА КОЛОДКА ЗАЛІЗНИЧНОГО РУХОМОГО СКЛАДУ

(57) Гальмівна колодка залізничного рухомого складу, що містить металевий каркас та чавунне фрикційне робоче тіло колодки з суцільним гребеневим фігурним пазом, яка **відрізняється** тим, що робоче тіло має фрикційні елементи у вигляді вставок циліндричної форми з пластичного матеріалу, закладені в тіло колодки з боку поверхні колеса, де розміщені двома групами у шаховому порядку.

(11) 155351

(51) МПК (2024.01)

B64C 39/00

G01S 13/00

G01S 13/58 (2006.01)

(21) u 2023 01236

(22) 24.03.2023

(24) 22.02.2024

(72) Троїцький Володимир Олександрович (UA)

(73) ІНСТИТУТ ЕЛЕКТРОЗВАРЮВАННЯ ІМ. Є.О. ПАТОНА НАЦІОНАЛЬНОЇ АКАДЕМІЇ НАУК УКРАЇНИ

вул. Казимира Малевича, 11, м. Київ, 03150 (UA)

(54) БЕЗПІЛОТНИЙ ЛІТАЛЬНИЙ АПАРАТ ІЗ ЗАХИСНОЮ БОРТОВОЮ СИСТЕМОЮ ДЕЗІНФОРМАЦІЇ ПРОТИВНИКА

(57) Безпілотний літальний апарат із захисною бортовою системою дезінформації противника, що містить широкозахватну відеокамеру, оптоелектронні датчики, вузли обробки відеоінформації, акумулятор, бортовий комп'ютер, штатні вузли дрона та елементи для виконання бойового завдання, який **відрізняється** тим, що до складу системи дезінформації введено поєднані з акумулятором аналізатор, програматор, фіксатор часу, швидкості і висоти, механізм для запуску піропатрона та димових шашок, генератор випадкових чисел з комутатором, зв'язаний з вимикачами електродвигунів, та блок обчислення координат стрілка, поєднаний з радіокомандним наземним пунктом.

(11) 155380

(51) МПК (2024.01)

B61H 1/00

F16D 69/02 (2006.01)

F16D 65/02 (2006.01)

(21) u 2023 04347

(22) 14.09.2023

(24) 22.02.2024

(72) Ковтанець Максим Володимирович (UA), Могила Валентин Іванович (UA), Ноженко Володимир Сергійович (UA), Бойко Григорій Олексійович (UA), Сергієнко Оксана Вікторівна (UA), Ковтанець Тетяна Миколаївна (UA)

(73) СХІДНОУКРАЇНСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ ІМЕНІ ВОЛОДИМИРА ДАЛЯ

вул. Іоанна Павла II, 17, м. Київ, 01042 (UA)

В 65

(11) 155388

(51) МПК

B65G 47/96 (2006.01)

B07C 3/08 (2006.01)

(21) u 2023 04535

(22) 25.09.2023

(24) 22.02.2024

(72) Артеменко Дмитро Михайлович (UA), Варибок Андрій Володимирович (UA), Уваров Олег Дмитрович (UA)

(73) ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ "УКРАЇНСЬКІ ІНТЕЛЕКТУАЛЬНІ СИСТЕМИ"

вул. Рибальська, 13, м. Київ, 01011 (UA)

(54) КАРЕТКА АВТОМАТИЧНОЇ СОРТУВАЛЬНОЇ ЛІНІЇ

(57) 1. Каретка автоматичної сортувальної лінії, що містить встановлену на шасі основу, на якій шарнірно закріплена вантажонесуча платформа з лотком і механізмом її нахилання, яка **відрізняється** тим, що вона оснащена механізмом фіксації вантажонесучої платформи, що складається з двох коромисел зі слідкуючими роликками, пов'язаних протилежним від роликів кінцем з кронштейном, що встановлений на основі з можливістю вертикального переміщення, й циліндричного фіксатора, один край якого прикріплений до рейки, що з'єднує коромисла, а другий - до кронштейна, при цьому механізм нахилання вантажонесучої платформи виконаний у вигляді коромисла зі слідкуючими роликками, до якого приєднані тро-

си, що через систему обвідних блоків пов'язані з вантажонесучою платформою, крім того вантажонесуча платформа оснащена противагою лотка.

2. Каретка автоматичної сортувальної лінії за п. 1, яка **відрізняється** тим, що лоток виконаний з ребрами на внутрішній поверхні, розташованими поперек осі обертання вантажонесучої платформи.

3. Каретка автоматичної сортувальної лінії за будь-яким із пп. 1, 2, яка **відрізняється** тим, що лоток виконаний з шаром шумопоглинального матеріалу, наприклад каучукового, нанесеного з боку вантажонесучої платформи.

4. Каретка автоматичної сортувальної лінії за будь-яким із пп. 1-3, яка **відрізняється** тим, що основа закріплена на шасі швидкокороз'ємним з'єднанням.

Розділ С:**Хімія. Металургія****С 04**

- (11) **155366** (51) МПК
C04B 33/22 (2006.01)
- (21) **и 2023 03713** (22) **02.08.2023**
(24) **22.02.2024**
(72) Брилль Євгеній Григорійович (UA)
(73) **БРИЛЬ ЄВГЕНІЙ ГРИГОРІЙОВИЧ**
квартал Гагаріна, 21, кв. 54, м. Луганськ, 91057 (UA)
- (54) **СПОСІБ ВИГОТОВЛЕННЯ ВОГNETРИВКОЇ ШАМОТНОЇ ЦЕГЛИ МЕТОДОМ ГІПЕРПРЕСУВАННЯ**
- (57) Спосіб виготовлення вогнетривкої шамотної цегли, що включає приготування сировинної маси, формування, сушіння, який **відрізняється** тим, що приготування сировинної маси відбувається шляхом змішування в пропорції 1:5 цементу з шамотним заповнювачем фракцією 0,1-5 мм, що містить глиноземисті складові і алюмосилікати, з додаванням води в кількості 5,5 % від маси суміші, при цьому її ретельно перемішують і додають в кількості 0,36 % від маси суміші натрієве рідке скло, після ретельного перемішування суміші її поміщають в прес-форми і здійснюють пресування за допомогою преса під тиском 23,3 МПа, з наступним сушінням у камері при температурі 18-22 °С протягом 1 доби.

С 09

- (11) **155370** (51) МПК (2024.01)
C09K 15/00
C09K 15/24 (2006.01)
C09K 15/30 (2006.01)
C12N 1/00
C12N 1/20 (2006.01)
C12P 1/04 (2006.01)
C07C 50/10 (2006.01)
- (21) **и 2023 04077** (22) **29.08.2023**
(24) **22.02.2024**
(72) Поліш Наталія Володимирівна (UA), Марінцова Наталія Геннадіївна (UA), Журахівська Леся Романівна (UA), Яремкевич Олена Святославівна (UA), Корецька Наталія Ігорівна (UA), Карпенко Олена Володимирівна (UA), Лубенець Віра Ільківна (UA)
(73) **НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ "ЛЬВІВСЬКА ПОЛІТЕХНІКА"**
вул. Степана Бандери, 12, м. Львів, 79013 (UA)
- (54) **СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ КОМПОЗИЦІЙНОГО ПРЕПАРАТУ НА ОСНОВІ ТРЕГАЛОЗОЛІПІДІВ, ЩО ВИЯВЛЯЄ АНТИОКСИДАНТНУ АКТИВНІСТЬ**
- (57) Спосіб одержання композиційного препарату на основі трегалозоліпідів, що виявляє антиоксидантну ак-

тивність, який включає взаємодію трегалозоліпідів, продукованих *Rhodococcus erythropolis* AU-1, та похідного 1,4-нафтохінону з використанням розчинника та дистильованої води, який **відрізняється** тим, що як розчинник використовують диметилсульфоксид, як похідний 1,4-нафтохінону використовують 2-[(6-(4-фторофеніл-5-оксо-2,5-дигідро-1,2,4-триазин-3-іл)феніл)аміно]нафтален-1,4-діон, який змішують еквімолярно з трегалозоліпідами, розтирають до однорідної маси, розтерту суміш розчиняють у диметилсульфоксиді, додають дистильовану воду та піддають дії ультразвуку з одночасним струшуванням протягом 15-20 хвилин.

С 10

- (11) **155394** (51) МПК (2024.01)
C10J 3/00
- (21) **и 2023 04721** (22) **06.10.2023**
(24) **22.02.2024**
(72) Подольський Мирослав Романович (UA), Гвоздевич Олег Васильович (UA), Кульчицька-Жигайло Леся Зиновіївна (UA)
(73) **ПОДОЛЬСЬКИЙ МИРОСЛАВ РОМАНОВИЧ**
вул. Є. Коновальця, 54, кв. 6, м. Львів, 79057 (UA)
ГВОЗДЕВИЧ ОЛЕГ ВАСИЛЬОВИЧ
вул. Ак. Колесси, 6-А, кв. 6, м. Львів, 79013 (UA)
КУЛЬЧИЦЬКА-ЖИГАЙЛО ЛЕСЯ ЗИНОВІІВНА
пр. Червоної Калини, 121, кв. 34, м. Львів, 79049 (UA)
- (54) **СПОСІБ ТЕРМІЧНОГО ПЕРЕРОБЛЕННЯ ВУГІЛЛЯ**
- (57) Спосіб термічного перероблення вугілля, який включає неперервне посекційне завантаження вугілля, поступове нагрівання, регулювання швидкості переміщення секцій, температурний контроль процесу, отримання газових, рідких і твердих продуктів, який **відрізняється** тим, що вугілля в кожній із секцій нагрівають до наперед визначеної температури 250-750 °С з можливістю встановлення для кількох суміжних секцій однакової температури, а швидкість переміщення секцій визначають за максимальним виходом цільових продуктів.

С 12

- (11) **155352** (51) МПК (2024.01)
C12N 5/074 (2010.01)
C12N 5/077 (2010.01)
A61K 9/00
A61K 35/28 (2015.01)
A61K 35/51 (2015.01)
- (21) **и 2023 01486** (22) **06.04.2023**
(24) **22.02.2024**
(72) Злацька Альона Василівна (UA), Гордієнко Інна Михайлівна (UA)

(73) ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ "ГУД ЦЕЛЛС"

вул. Івана Крамського, 9, м. Київ, 03115 (UA)

(54) СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ КОМПЛЕКСНОГО БІОТЕХНОЛОГІЧНОГО ПРОДУКТУ, ЩО МІСТИТЬ ПОЗАКЛІТИННІ ВЕЗИКУЛИ ВІД ТРЬОХ ТИПІВ КЛІТИН-ПРОДУЦЕНТІВ, ДЛЯ ВІДНОВЛЕННЯ ДЕФЕКТІВ М'ЯКИХ ТКАНИН

- (57)** 1. Спосіб одержання комплексного біотехнологічного продукту, що містить позаклітинні везикули від трьох типів клітин-продуцентів, для відновлення дефектів м'яких тканин, за яким одержують мезенхімальні стромальні/стовбурові клітини методами механічної та ферментативної обробки чи методом експлантів, який **відрізняється** тим, що для одержання мезенхімальних стромальних/стовбурових клітин виконують їх виділення з жирової тканини, ліпоаспірату та/або біоптату шкіри, мультипотентних мезенхімальних стромальних/стовбурових клітин з пупкового канатика та мультипотентних стовбурових клітин-похідних нервового гребеня, отриманих із пульпи зуба, волосяного фолікула, біоптату слизової піднебіння, виконують обробку та ізоляцію одержаних клітин, виконують культивування *in vitro* для експансії МСК ЖТ, МСК ПК та МСК-ПНГ, здійснюють первинне виділення МСК ЖТ, МСК ПК та МСК-ПНГ ферментативним способом або способом експлантів, застосовуючи додатковий спосіб селекції необхідної популяції клітин МСК-ПНГ поміщенням первинної популяції клітин у фібриновий гель, та їх культивування до необхідної кількості з наступним кріоконсервуванням та/або пасируванням для подальшого виготовлення біотехнологічного безклітинного продукту на основі їх секретому, створюють майстер-банк отриманих культур клітин шляхом кріоконсервування необхідної кількості клітин на ранніх пасажах, отримують секретом клітин-продуцентів для біотехнологічного продукту, очищують отримане середовище секретому клітин-продуцентів, поєднують безклітинне кондиційне середовище отриманого від культивованих МСК ЖТ, МСК ПК та МСК-ПНГ у попередньо визначеній пропорції.
2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що культивування МСК ЖТ та МСК ПК здійснюють у ростовому середовищі α -MEM з 10 % фетальної бичачої сироватки, 10 нг/мл основного фактора росту фібробластів (bFGF), 2mM стабільного глутаміну та 1 % розчину антибіотика/антимікотика при 37 °C, 5 % CO₂, 5 % O₂ та 95 % вологості в CO₂-інкубаторі.
3. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що культивування МСК-ПНГ здійснюють у ростовому середовищі α -MEM з 5 % фетальної бичачої сироватки,

5 нг/мл основного фактора росту фібробластів (bFGF), 10 нг/мл епідермального фактора росту (EGF), 1 % інсулін-трансферин-селену, 2 mM стабільного глутаміну, антибіотиків/антимікотиків на культуральних флаконах з додатковим покриттям желатином/колагеном чи інших компонентів позаклітинного матриксу.

4. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що очищення отриманого секретому виконують шляхом диференційного центрифугування, ультрацентрифугування та фільтрації через 0,22 мкм нейлоновий фільтр для очищення від клітин, дебрису та апоптотичних тілець.

C 21**(11) 155387****(51) МПК (2024.01)****C21B 5/00****C21B 7/16** (2006.01)**(21) u 2023 04528****(22) 25.09.2023****(24) 22.02.2024**

(72) Верещак Віктор Іванович (UA), Верещак Денис Вікторович (UA), Писаренко Вадим Юрійович (UA), Чайка Олексій Леонідович (UA)

(73) ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ НАУКОВО-ВИРОБНИЧА ФІРМА "КОШ"

бул. Слави, 42, кор. 2, кв. 70, м. Дніпро, 49126 (UA)

(54) СПОСІБ ПОДАЧІ ПРИРОДНОГО ГАЗУ В ДОМЕННУ ПІЧ

- (57)** Спосіб подачі природного газу в доменну піч, що включає його попередній підігрів до введення в повітряну фурму шляхом використання природного газу як охолоджуючого середовища для охолодження елементів фурменого приладу, введення в потік гарячого дуття і подачу в піч, який **відрізняється** тим, що для підігріву газу, що проходить по загальному трубопроводу, здійснюють його поділ на два потоки, один з яких подають на охолодження нижнього, а другий - верхнього фланців коліна фурменого приладу, після чого обидва потоки газу з'єднують в один потік, тим самим забезпечують збереження пропускної здатності подачі газу в доменну піч при технологічних величинах тиску в 4,5-5,0 кг/см² і пропускну здатність трубопроводу при подачі газу до 1200 м³ за годину на одну фурму.

Розділ Е:**Будівництво****Е 02**

- (11) **155358** (51) МПК (2024.01)
E02B 9/00
- (21) **и 2023 03031** (22) **22.06.2023**
(24) **22.02.2024**
- (72) Кузь Олександр Павлович (UA), Козленко Олег Володимирович (UA), Рибачик Вячеслав Костянтинович (UA), Якуніна Наталія Олександрівна (UA)
- (73) **ПОЛІТЕХНІЧНИЙ ЛІЦЕЙ НАЦІОНАЛЬНОГО ТЕХНІЧНОГО УНІВЕРСИТЕТУ УКРАЇНИ "КИЇВСЬКИЙ ПОЛІТЕХНІЧНИЙ ІНСТИТУТ ІМЕНІ ІГОРЯ СІКОРСЬКОГО" М. КИЄВА**
пр-кт Берестейський, 37, корп. 7, к. 537, м. Київ-56, 03056 (UA)
- (54) **ШАХТНА ГІДРОАКУМУЛЮЮЧА ЕЛЕКТРОСТАНЦІЯ**
- (57) 1. Шахтна гідроакумулююча електростанція, що містить верхній і нижній накопичувальні басейни, водовід, гідроенергетичні та насосні агрегати, яка **відрізняється** тим, що в нижньому басейні знаходиться кілька складаних ємностей, розташованих одна в одній.
2. Шахтна гідроакумулююча електростанція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що як насосні агрегати застосовано аерліфтні насоси.
3. Шахтна гідроакумулююча електростанція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що труби насосів знаходяться у верхньому рівні кожної ємності нижнього басейна.

Е 03

- (11) **155390** (51) МПК
E03B 3/28 (2006.01)
- (21) **и 2023 04586** (22) **28.09.2023**
(24) **22.02.2024**
- (72) Костенко Віктор Климентович (UA), Ляшок Ярослав Олександрович (UA), Богомаз Ольга Петрівна (UA), Таврель Марина Ігорівна (UA), Кутняшенко Олексій Ігорович (UA), Костенко Тетяна Вікторівна (UA), Главатських Кристина Максимівна (UA)
- (73) **ДЕРЖАВНИЙ ВИЩИЙ НАВЧАЛЬНИЙ ЗАКЛАД "ДОНЕЦЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ"**
вул. Потебні, 56, м. Луцьк, 43003 (UA)
- (54) **ПРИСТРІЙ ДЛЯ ОДЕРЖАННЯ ВОДИ З ШАХТНОГО ПОВІТРЯ**
- (57) Пристрій для одержання води з шахтного повітря, який містить корпус, повітропровід, джерело низької температури, теплообмінник для охолодження повітря, резервуар для конденсованої води, який **відрізняється** тим, що пристрій містить з'єднаний з теплоізолюваним корпусом повітропровід, що має венти-

лятор, трубчастий теплообмінник вмонтовано в теплоізолюваний корпус, в нижній частині корпусу зроблено жолоб, з'єднаний з резервуаром для конденсованої води трубою з краном, джерелом низької температури є холодоагент, що циркулює під дією компресора до радіатора, встановленого в повітряному струмені гірничої виробки, а з радіатора - до дроселя, встановленого на вході до труб теплообмінника.

Е 04

- (11) **155356** (51) МПК
E04B 5/08 (2006.01)
E04B 5/23 (2006.01)
- (21) **и 2023 02657** (22) **01.06.2023**
(24) **22.02.2024**
- (72) Вознюк Леонід Іванович (UA), Гнат Галина Олександрівна (UA)
- (73) **НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ "ЛЬВІВСЬКА ПОЛІТЕХНІКА"**
вул. Степана Бандери, 12, м. Львів, 79013 (UA)
- (54) **ПЕРЕКРИТТЯ БУДИНКУ АБО СПОРУДИ**
- (57) Перекриття будинку або споруди, яке складається з багатошарових плит, кожна з яких містить нижній та верхній шари з бетону і середній шар з утеплювача, причому нижній шар армований, плити оперті на пролітну конструкцію, яке **відрізняється** тим, що кожна з багатошарових плит містить несучі ребра, а нижній та верхній шари плити виконані з керамзитобетону, причому верхній шар армований, середній шар плити виконаний із пінополістиролу, а пролітна конструкція виконана ферменною із верхнім і нижнім поясами та розкосами.

Е 05

- (11) **155378** (51) МПК
E05B 65/52 (2006.01)
- (21) **и 2023 04309** (22) **12.09.2023**
(24) **22.02.2024**
- (72) Козлов Сергій Валерійович (UA)
- (73) **КОЗЛОВ СЕРГІЙ ВАЛЕРІЙОВИЧ**
вул. Приморська, 66, кв. 66, м. Світловодськ, Олександрійський р-н, Кіровоградська обл., 27501 (UA)
- (54) **ЗАМОК**
- (57) 1. Замок, що складається з корпусу з бічними стінками, важеля управління П-подібного поперечного перерізу з двома полицями, рухомого замикаючого елемента і відповідної частини, полиці важеля управління встановлені на осі, закріпленій в бічних стінках корпусу, а рухомий замикаючий елемент містить два плеча і виконаний з можливістю взаємодії з важелем управління і відповідною частиною, який **відрізняється** тим, що плечі рухомого замикаючого елемента оснащені симетрично розташованими Г-подібними пазами, в яких розміщена вісь важеля управлін-

ня, і симетрично розташованими поздовжніми пазами, в яких розміщений обмежувач, встановлений у бічних стінках корпусу, при цьому рухомий замикаючий елемент з'єднаний з важелем управління через тяги, шарнірно закріплені одна симетрично одній на плечах рухомого замикаючого елемента і полицях важеля управління.

2. Замок за п. 1, який **відрізняється** тим, що корпус з протилежного відповідній частині боку оснащений торцевою стінкою.

3. Замок за будь-яким з пп. 1, 2, який **відрізняється** тим, що плечі рухомого замикаючого елемента з боку відповідної частини пов'язані Г-подібною планкою.

4. Замок за будь-яким з пп. 1, 2, 3, який **відрізняється** тим, що полиці важеля управління розміщені всередині корпусу, а кожне плече рухомого замикаючого елемента розташоване між відповідними стінкою корпусу і полицею важеля управління.

Розділ F:

Машинобудування.
Освітлювання. Опалювання.
Зброя. Підrivні роботи

F 02

- (11) 155379 (51) МПК
F02C 7/36 (2006.01)
F16H 1/28 (2006.01)
F16H 1/46 (2006.01)
F16H 1/48 (2006.01)
F16H 1/20 (2006.01)
- (21) u 2023 04346 (22) 14.09.2023
(24) 22.02.2024
- (72) Подгорський Костянтин Миколайович (UA), Михайлютенко Анатолій Васильович (UA), Ступаков Олександр Анатолійович (UA), Северин Олександр Васильович (UA)
- (73) ПУБЛІЧНЕ АКЦІОНЕРНЕ ТОВАРИСТВО "МОТОР СІЧ"
проспект Моторобудівників, 15, м. Запоріжжя, 69068 (UA)
- (54) РЕДУКТОР ДВОСТУПІНЧАСТИЙ ЦИЛІНДРИЧНО-ПЛАНЕТАРНИЙ
- (57) Редуктор двоступінчастий циліндрично-планетарний, що містить два корпуси, з'єднані між собою, в одному з яких розміщено вал гвинта з елементами системи подачі мастила на управління повітряним гвинтом та встановлений на ньому планетарний ступінь, який містить ведучу шестірню, шестерні-сателіти, зубчате колесо внутрішнього зачеплення, корпус планетарного ступеня та з'єднувальну вал-ресору; в іншому корпусі встановлено циліндричну прямокутну передачу з підшипниковими опорами, кінематично з'єднану з планетарним ступенем, вал-ресору для з'єднання редуктора з ротором двигуна та привід генератора електричного струму, що з'єднаний з ведучою шестірнею циліндричної прямокутної передачі, який відрізняється тим, що редуктор оснащено елементами системи вимірювача крутного моменту (ВКМ), яка містить масляний насос, циліндро-поршневі групи, що з'єднані з одного боку з корпусом вала гвинта, а з іншого боку - з зубчатим колесом внутрішнього зачеплення, з можливістю відносного переміщення останнього в поперечній площині редуктора, крім того, шестерні-сателіти встановлені в корпусі планетарного ступеня за допомогою роликових підшипників, а ведуча шестірня планетарного ступеня встановлена на з'єднувальну вал-ресору за допомогою шліцьового з'єднання.

F 04

- (11) 155350 (51) МПК (2024.01)
F04C 2/00
F04C 2/08 (2006.01)

(21) u 2022 04504 (22) 30.11.2022
(24) 22.02.2024

- (72) Панченко Анатолій Іванович (UA), Волошина Анжела Анатоліївна (UA), Кюрчев Сергій Володимирович (UA), Кюрчев Володимир Миколайович (UA), Тітова Олена Анатоліївна (UA), Панченко Ігор Анатолійович (UA)
- (73) ТАВРІЙСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ АГРОТЕХНОЛОГІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ ІМЕНІ ДМИТРА МОТОРНОГО пр. Б. Хмельницького, 18, м. Мелітополь, Запорізька обл., 72312 (UA)
- (54) ПЛАНЕТАРНО-РОТОРНИЙ ГІДРОМОТОР
- (57) Планетарно-роторний гідромотор, що містить ротор, ексцентрично встановлений в корпусі, виконаний з двома зубчастими вінцями - зовнішнім, що входить в зачеплення з зубчастим вінцем корпусу, та внутрішнім, виконаним у вигляді роликів, який у сполученні з зубчастим колесом, нерухомо закріпленим на валу, утворює робочі камери, встановлений на валу розподільник з вікнами каналів та підпружинений золотник з пропускними вікнами каналів, розміщений в торцевій кришці з утворенням поршневих порожнин, канали розподільника з'єднані з робочими камерами, а канали золотника з'єднані з каналами підведення-відведення робочої рідини, який відрізняється тим, що в роторі виконано циліндричну розточку, в якій беззазорно встановлені ролики, на циліндричній поверхні ротора виконано n поздовжніх пазів, причому кількість роликів кратна кількості n поздовжніх пазів, з круговим кутом $360^\circ/n$ розташування пазів на роторі, але щонайменше $n=2$ поздовжніх пазів, що розташовані діаметрально протилежно, в поздовжніх пазах з можливістю взаємодії з роликами встановлені шпонки.

F 16

- (11) 155349 (51) МПК (2024.01)
F16L 23/00
- (21) u 2021 06297 (22) 08.11.2021
(24) 22.02.2024
- (72) Малюта Сергій Іванович (UA), Вершков Олександр Олександрович (UA), Мацулевич Олександр Євгенович (UA), Бондаренко Лариса Юріївна (UA), Щербина Віктор Михайлович (UA)
- (73) ТАВРІЙСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ АГРОТЕХНОЛОГІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ ІМЕНІ ДМИТРА МОТОРНОГО пр. Б. Хмельницького, 18, м. Мелітополь, Запорізька обл., 72312 (UA)
- (54) ФЛАНЦЕВЕ З'ЄДНАННЯ
- (57) 1. Фланцеве з'єднання, що містить два патрубки з приварним фланцем на кінцевій ділянці одного з них та вільного фланця на приварному кільці кінцевої ділянки іншого, причому, по периферії обох фланців виконано отвори для розміщення в них болтів або шпильок, яке відрізняється тим, що внутрішня циліндрична поверхня отвору вільного фланця оснащена принаймні двома рівномірно розміщеними паралельними до його осі прямокутними зубами і западинами. 2. Фланцеве з'єднання за п. 1, яке відрізняється тим, що зовнішня циліндрична поверхня приварного кіль-

ця оснащена принаймні двома рівномірно розміщеними паралельними до його осі прямокутними зубами і западинами.

F 23

- (11) **155353** (51) МПК (2024.01)
F23G 5/00
C10B 53/00
- (21) **и 2023 01760** (22) **17.04.2023**
(24) **22.02.2024**
- (72) Акімов Анатолій Андрійович (UA), Гвоздевич Олег Васильович (UA)
- (73) **АКІМОВ АНАТОЛІЙ АНДРІЙОВИЧ**
вул. Генерала Тарнавського, 39, кв. 3, м. Львів, 79017 (UA)
- ГВОЗДЕВИЧ ОЛЕГ ВАСИЛЬОВИЧ**
вул. Ак. Колесси, 6-А, кв. 6, м. Львів, 79013 (UA)
- (54) **ЕНЕРГЕТИЧНИЙ КОМПЛЕКС ПЕРЕРОБКИ ВУГЛЕЦЕВМІСНОЇ СИРОВИНИ**
- (57) Енергетичний комплекс переробки вуглецевмісної сировини, що містить газифікатор сировини з отриманням як продуктів газифікації суміші горючих газів, діоксиду вуглецю CO₂, оксиду азоту, а також теплої води, парогазову установку для виробництва електроенергії шляхом спалювання у ній горючих газів з отриманням скидної низькопотенційної теплої води, системи її утилізації та утилізації теплової енергії газів, вузли очистки та контролю теплоносіїв, який **відрізняється** тим, що комплекс додатково містить біореактор, у який після газифікації направляють діоксид вуглецю і оксид азоту та частину скидної теплої води, які інтенсифікують вирощування у біореакторі водоростей для переробки в окремому модулі на цільовий продукт, наприклад біопаливо.

F 41

- (11) **155377** (51) МПК
F41A 3/66 (2006.01)
F41A 3/46 (2006.01)
- (21) **и 2023 04295** (22) **12.09.2023**
(24) **22.02.2024**
- (72) Галкін Сергій Григорович (UA)
- (73) **ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ "КОМПАНІЯ ЗБРОЯ"**
майдан Захисників України, 7/8, м. Харків, 61001 (UA)
- (54) **КРИШКА СТОЛЬНОЇ КОРОБКИ ВОГНЕПАЛЬНОЇ ЗБРОЇ**
- (57) 1. Кришка ствольної коробки вогнепальної зброї, що містить корпус кришки, на верхній горизонтальній поверхні якого розташована встановлювальна поверхня для фіксації додаткового пристрою, фіксуючий механізм для кріплення передньої частини кришки, бічні панелі заданої конфігурації з вирізами, а також

замикаючий механізм для фіксування заднього кінця корпусу, яка **відрізняється** тим, що фіксуючий механізм для кріплення передньої частини кришки виконаний у вигляді дугоподібного виступу, розташованого на передній зовнішній торцевій поверхні корпусу кришки, при цьому форма виступу відповідає заглибленню на ствольній коробці вогнепальної зброї, а також містить підпружинену кlawішу з клиноподібним наконечником, при цьому підпружинена кlawіша розташована в заглибленні перед встановлювальною поверхнею в передній частині корпусу таким чином, що верхня поверхня підпружиненої кlawіші та встановлювальна поверхня лежать в одній горизонтальній площині, замикаючий механізм для фіксування заднього кінця корпусу кришки виконаний у вигляді замикаючої рамки, встановленої з можливістю вертикального переміщення по направляючим в задній частині корпусу, колеса прокручування, розташованого у верхній частині корпусу під встановлювальною поверхнею, фіксатора переміщення колеса прокручування, а також регулювального гвинта колеса прокручування, що з'єднує колесо прокручування і замикаючу рамку, бічні панелі корпусу, що виконані жорсткими і нерухомими щодо корпусу, при цьому ліва бічна панель має прямокутний виріз подовженої форми, а на внутрішній горизонтальній поверхні кришки в задній її частині виконано овалоподібне заглиблення.

2. Кришка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що в середній частині підпружиненої кlawіші розташована поперечна вісь для забезпечення обертального руху кlawіші в заданому напрямку.

3. Кришка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що під задньою частиною підпружиненої кlawіші розташовані пружини.

4. Кришка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що замикаюча рамка виконана товстостінною зі скосом в нижній частині і отвором під фіксуючу кнопку вогнепальної зброї.

5. Кришка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що бічна поверхня колеса прокручування виконана рифленою.

6. Кришка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що фіксатор переміщення колеса прокручування містить кульку та пружину.

7. Кришка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що замикаючий механізм містить стопорний гвинт, що додатково фіксує положення замикаючої рамки.

8. Кришка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що встановлювальна поверхня для фіксації додаткового пристрою виконана подовженої форми на 18 слотів.

9. Кришка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що виріз на лівій бічній панелі має довжину 39-45 мм.

10. Кришка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що на внутрішній поверхні бічних панелей виконані поздовжні ребра жорсткості, пов'язані з внутрішньою поверхнею задньої торцевої кришки.

11. Кришка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що корпус виконаний монолітним з алюмінієвих сплавів.

12. Кришка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що підпружинена кlawіша виконана зі сталі.

13. Кришка за п. 1, яка **відрізняється** тим, що замикаючий механізм виконаний зі сталі.

- (11) **155355** (51) МПК (2024.01)
F41H 13/00
G08G 1/095 (2006.01)
- (21) **u 2023 02337** (22) **16.05.2023**
(24) **22.02.2024**
- (72) Дмитрієва Олена Семенівна (UA), Петруша Олександр Олексійович (UA), Положенцев Вячеслав Васильович (UA), Русняк Ігор Миколайович (UA), Богдан Володимир Михайлович (UA), Кондратьєв Сергій Георгійович (UA), Жук Олег Артемович (UA), Нюга Ніна Михайлівна (UA)
- (73) **ДМИТРИЄВА ОЛЕНА СЕМЕНІВНА**
бул. Дружби Народів (Михайла Міхновського), 7, кв. 161, м. Київ, 01042 (UA)
ПЕТРУША ОЛЕКСАНДР ОЛЕКСІЙОВИЧ
вул. Василя Касіяна, 2, кв. 4, м. Київ, 03191 (UA)
ПОЛОЖЕНЦЕВ ВЯЧЕСЛАВ ВАСИЛЬОВИЧ
вул. Озерна (Новосілки), 5, кв. 13, м. Київ-027, 03027 (UA)
РУСНЯК ІГОР МИКОЛАЙОВИЧ
вул. Михайла Драгоманова, 15-а, кв. 140, м. Київ, 02068 (UA)
- (54) **КОНСТРУКЦІЯ ПОТУЖНОГО ПРОЖЕКТОРНОГО ПРИСТРОЮ ДЛЯ ЗАХИСТУ ВІД КЕРОВАНИХ РАКЕТ З ОПТИКО-ЕЛЕКТРОННИМИ КАНАЛАМИ НАВЕДЕННЯ**
- (57) 1. Конструкція потужного прожекторного пристрою для захисту від керованих ракет з оптико-електронними каналами наведення, який має: загальний корпус, на якому змонтовані елементи зовнішнього захисту вихідної апертури пристрою, які встановлені з можливістю зміщення, наприклад вихідний оптичний фільтр і непрозора зовнішня кришка; всередині якого розміщені світловипромінюючі комірки, які мають принаймні одне джерело випромінювання - лазерний світловипромінюючий діод, розміщений в фокусі індивідуального фокусуєчого пристрою, який має принаймні один лінзовий елемент, наприклад сферичну лінзу і/або лінзу з двоюкою кривизною, з високим коефіцієнтом пропускання в робочій зоні джерела випромінювання комірок, які змонтовані в загальному корпусі за допомогою спеціальних монтажних елементів із струмовідводами і виконані уніфікованими або мають відмінні джерела випромінювання і відповідні оптичні схеми, при цьому світловипромінюючі комірки зорієнтовані так, що в сукупності утворюють двомірну світловипромінюючу матрицю, перпендикулярну осі загального вихідного променя з однаковими або різними кутами розходження в горизонтальній і вертикальній площинах, а вихідна апертура пристрою включає вихідні елементи оптичних схем світловипромінюючих комірок, герметично вмонтовані в передню панель пристрою, яка **відрізняється** тим, що загальний корпус запропонованого пристрою виконаний у вигляді паралелепіпедного порожнистого короба-каркаса, на передній грані якого розміщена робоча випромінююча панель для виведення загального променя, на задній грані встановлена панель з елементами електричної монтажною схеми, наприклад електричними з'єднувачами і монтажними кросами, нижня грань використана як основа для встановлення на нерухому або рухому, наприклад поворотну, платформу зовнішнього об'єкта, а на бічних гранях змонтовані конструкційні монтажні

елементи, виконані у вигляді бічних кришок, на внутрішніх поверхнях яких на несучих платах встановлені лінійки наборів світловипромінюючих комірок.

2. Конструкція потужного прожекторного пристрою для захисту від керованих ракет з оптико-електронними каналами наведення за п. 1, яка **відрізняється** тим, що бічні кришки нерухомо закріплені на корпусі, наприклад за допомогою різьбових елементів, або встановлені з можливістю кутового повороту (відкривання) відносно одного із його ребер, наприклад горизонтального ребра, прилеглого до нижньої основи.

3. Конструкція потужного прожекторного пристрою для захисту від керованих ракет з оптико-електронними каналами наведення за будь-яким з пп. 1 і 2, яка **відрізняється** тим, що контактуючі поверхні загального корпусу і бічної кришки, нерухомо закріпленої на ньому або змонтованої з можливістю кутового повороту, з'єднані безпосередньо або з використанням прокладок з високою теплопровідністю.

4. Конструкція потужного прожекторного пристрою для захисту від керованих ракет з оптико-електронними каналами наведення за будь-яким з пп. 1-3, яка **відрізняється** тим, що контактуючі поверхні загального корпусу і несучих плат з світловипромінюючими комірками з'єднані безпосередньо або з використанням прокладок з високою теплопровідністю.

5. Конструкція потужного прожекторного пристрою для захисту від керованих ракет з оптико-електронними каналами наведення за будь-яким з пп. 1-4, яка **відрізняється** тим, що зовнішні поверхні складових частин пристрою, наприклад зовнішні поверхні бічних кришок, мають пристрої для розсіювання тепла, наприклад радіаторне оребрення.

6. Конструкція потужного прожекторного пристрою для захисту від керованих ракет з оптико-електронними каналами наведення за будь-яким з пп. 1-5, яка **відрізняється** тим, що всередині загального корпусу встановлений принаймні один давач температури, наприклад на внутрішній поверхні його основи (на нижній поверхні), виводи якого зв'язані з виходами пристрою, наприклад, призначеними для підключення до зовнішньої системи контролю і/або до зовнішньої системи автоматичного блокування електроживлення модульних світловипромінювачів (комірок) в разі критичного теплового режиму їх роботи.

7. Конструкція потужного прожекторного пристрою для захисту від керованих ракет з оптико-електронними каналами наведення за пп. 1-6, яка **відрізняється** тим, що модульні світловипромінювачі (комірки) виконані уніфікованими, мають світловипромінюючі лазерні діоди із спільною робочою смугою і розміщені рівномірно в межах вихідної апертури пристрою.

8. Конструкція потужного прожекторного пристрою для захисту від керованих ракет з оптико-електронними каналами наведення за пп. 1-6, яка **відрізняється** тим, що модульні світловипромінювачі (комірки) мають світловипромінюючі лазерні діоди з різними робочими смугами, розміщені в межах вихідної апертури пристрою рівномірно або групами, при цьому встановлені в комірках лінзові фокусуєчі елементи мають високі коефіцієнти пропускання у відповідних робочих смугах їх випромінювання.

Розділ G:

Фізика

G 01

- (11) **155375** (51) МПК
G01N 33/50 (2006.01)
- (21) u 2023 04234 (22) 07.09.2023
(24) 22.02.2024
- (72) Денова Лідія Данилівна (UA), Іванов Дмитро Дмитрович (UA)
- (73) **НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ ІМЕНІ П.Л. ШУПИКА**
вул. Дорогожицька, 9, м. Київ, 04112 (UA)
- ДЕНОВА ЛІДІЯ ДАНИЛІВНА**
вул. Миру, 55, кв. 2, смт Калита, Броварський р-н, Київська обл., 07420 (UA)
- ІВАНОВ ДМИТРО ДМИТРОВИЧ**
вул. Прирічна, 17Г, кв. 91, м. Київ, 01412 (UA)
- (54) СПОСІБ ОЦІНКИ РИЗИКУ ШВИДКОГО ПРОГРЕСУВАННЯ ХРОНІЧНОЇ ХВОРОБИ НИРОК У ПАЦІЄНТІВ З ДОДІАЛІЗНОЮ ХРОНІЧНОЮ ХВОРОБОЮ НИРОК
- (57) Спосіб оцінки ризику швидкого прогресування хронічної хвороби нирок у пацієнтів з додіалізною хронічною хворобою нирок, що включає визначення рівня уромодуліну сечі, який відрізняється тим, що у пацієнтів з додіалізною хронічною хворобою нирок додатково визначають альбумін сечі, розраховують співвідношення альбуміну сечі і уромодуліну сечі, співставляють отримані результати із швидкістю клубочкової фільтрації та індексом коморбідності у цих пацієнтів, якщо значення співвідношення альбумін/уромодулін сечі більше 5,24 мкг/мл, то розцінюють як високий ризик швидкого прогресування хронічної хвороби нирок.

- (11) **155376** (51) МПК
G01S 11/04 (2006.01)
G01S 17/42 (2006.01)
- (21) u 2023 04289 (22) 11.09.2023
(24) 22.02.2024
- (72) Коломійцев Олексій Володимирович (UA), Васюта Костянтин Станіславович (UA), Третяк В'ячеслав Федорович (UA), Воронін Андрій Володимирович (UA), Служенко Віталій Олександрович (UA), Глушко Анатолій Петрович (UA), Долина Михайло Петрович (UA), Єлін Віталій Михайлович (UA), Іванов Олег Віталійович (UA), Литвин Андрій Володимирович (UA), Малуга Володимир Геннадійович (UA), Матюх Юрій Володимирович (UA), Панасенко Сергій Вікторович (UA), Підлісний Ігор Павлович (UA), Чечуй Олександр Вікторович (UA)
- (73) **ХАРКІВСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ УНІВЕРСИТЕТ ПОВІТРЯНИХ СИЛ ІМЕНІ ІВАНА КОЖЕДУБА**
вул. Сумська, 77/79, м. Харків, 61023 (UA)

(54) КАНАЛ ВИМІРЮВАННЯ КУТОВИХ ШВИДКОСТЕЙ ЛІТАЛЬНИХ АПАРАТІВ З КІБЕРНЕТИЧНИМ ЗАХИСТОМ ІНФОРМАЦІЇ ТА РАДІОКАНАЛОМ ДЛЯ МОБІЛЬНОЇ ОДНОПУНКТНОЇ ВИМІРЮВАЛЬНОЇ СИСТЕМИ

- (57) Канал вимірювання кутових швидкостей літальних апаратів з кібернетичним захистом інформації та радіоканалом для мобільної однопунктної вимірювальної системи, який містить керуючий елемент, блок керування дефлекторами, лазер з накачкою, модифікований селектор подовжніх мод, блок дефлекторів, передавальну оптику, радіолокаційний модуль, який складений з антени, приймально-передавальної апаратури і апаратури захисту від завад, приймальну оптику, фотодетектор, широкосмуговий підсилювач, резонансні підсилювачі, настроєні на відповідні частоти міжмодових биттів, формувачі імпульсів, тригери, реверсивні лічильники, схеми "І", схеми порівняння, спеціалізовану електронну обчислювальну машину, блок з розширеними можливостями із введенням б, простабілізовану платформу та $\Delta v_{m \text{ оп-введення}}$ опорних сигналів з частотами міжмодових биттів ($\Delta v_{m \text{ оп}}$, $2\Delta v_{m \text{ оп}}$, $3\Delta v_{m \text{ оп}}$, $6\Delta v_{m \text{ оп}}$) від передавального лазера, б-введення сигналу від каналу вимірювання кутових швидкостей літального апарата, який відрізняється тим, що додатково введено апаратуру обміну даними.

- (11) **155396** (51) МПК
G01S 17/42 (2006.01)
- (21) u 2023 05171 (22) 01.11.2023
(24) 22.02.2024
- (72) Коломійцев Олексій Володимирович (UA), Комаров Володимир Олександрович (UA), Баленко Олексій Іванович (UA), Бікулова Світлана Євгенівна (UA), Борисенко Олександр Васильович (UA), Гриньов Денис Валерійович (UA), Кійко Андрій Сергійович (UA), Клим Вікторія Юрьевна (UA), Ковальчук Юрій Олексійович (UA), Лазарев Олексій Владленович (UA), Носков Валентин Іванович (UA), Носик Андрій Михайлович (UA), Прокопович-Ткаченко Дмитро Ігорович (UA), Рисований Олександр Миколайович (UA), Фіров Олександр Дмитрович (UA)
- (73) **КОЛОМІЙЦЕВ ОЛЕКСІЙ ВОЛОДИМИРОВИЧ**
вул. Астрономічна, 35-а, кв. 88, м. Харків, 61085 (UA)
- (54) КАНАЛ ВИМІРЮВАННЯ РАДІАЛЬНОЇ ШВИДКОСТІ ЛІТАЛЬНИХ АПАРАТІВ З МОЖЛИВІСТЮ ЇХ РОЗПІЗНАВАННЯ ТА КІБЕРНЕТИЧНИМ ЗАХИСТОМ ІНФОРМАЦІЇ
- (57) Канал вимірювання радіальної швидкості літальних апаратів з можливістю їх розпізнавання та кібернетичним захистом інформації, який містить керуючий елемент, блок керування дефлекторами, лазер з накачкою, селектор подовжніх мод, блок дефлекторів, передавальну оптику, радіолокаційний модуль, який складений з антени, приймально-передавальної апаратури і апаратури захисту від завад, приймальну оптику, фотодетектор, широкосмуговий підсилювач, резонансні підсилювачі, настроєні на відповідні частоти міжмодових биттів, змішувачі, фільтри, фазову автотіпдстройку частоти на частоті міжмодових биттів,

керуючий генератор, опорний генератор з частотою підставки $\Delta v_{\text{п}}$, формувач імпульсів, схему "I", формувач мірних імпульсів, лічильник, дешифратор, спеціалізовану електронну обчислювальну машину, блок розпізнавання та $\Delta v_{\text{м}}$ -введення опорної частоти $\Delta v_{\text{м}}$ оп від передавального лазера, б-введення сигналу від каналу вимірювання кутових швидкостей літального апарата, який **відрізняється** тим, що додатково введено апаратуру для приймання і передачі інформації з антеною.

хом притискування елементів кульового шарніра чи опори одне до одного гвинтовим механізмом.

3. Клавіатура ноутбука за п. 2, яка **відрізняється** тим, що нижній диск клавіші є збірною кульовою опорою, верхня ділянка якої має ззовні форму циліндра, а всередині - гніздо для кулі, до якої прикріплено гвинт, вкручений у основу.

G 11

G 09

- (11) **155369** (51) МПК
G09B 15/08 (2006.01)
G09B 15/06 (2006.01)
- (21) u 2023 03897 (22) 15.08.2023
(24) 22.02.2024
(72) Хиленко Володимир Васильович (UA)
(73) ХИЛЕНКО ВОЛОДИМИР ВАСИЛЬОВИЧ
вул. Татарська, буд. 38, кв. 62, м. Київ, 04107 (UA)
(54) КЛАВІАТУРА НОУТБУКА
(57) 1. Клавіатура ноутбука, що містить основу, на якій встановлені окремі клавішні секції, відповідно для правої та лівої рук, з можливістю пересування та фіксації положення кожної клавішної секції на основі, яка **відрізняється** тим, що кожна клавіша клавіатури містить паралельно встановлені верхній і нижній диски, між якими розташована пружина стиску, на вільному торці верхнього диска є певний символ, призначений для дії на диск пальцем користувача, нижній диск встановлений на основі та має різьбу по зовнішній боковій циліндричній поверхні, діаметр його більший за діаметр верхнього диска, а верхній і нижній диски охоплені ззовні по бокових циліндричних поверхнях накидною гайкою з центральним наскрізним отвором для певного символу, встановленою співвісно з дисками з боку верхнього диска з можливістю взаємодії різьби накидної гайки з різьбою на нижньому диску і притискання чи відпускання пружини стиску і, відповідно, збільшення чи зменшення висоти верхнього диска з символом над основою та фіксації визначеного положення клавіші.
2. Клавіатура ноутбука за п. 1, яка **відрізняється** тим, що нижній диск клавіші опертий на кульовий шарнір чи кульову опору, прикріплену до основи і призначену для нахилу клавіші по кульці шарніра відносно площини основи і фіксації положення клавіші шля-

- (11) **155357** (51) МПК (2024.01)
G11B 33/14 (2006.01)
B65D 85/38 (2006.01)
H05K 9/00
- (21) u 2023 02814 (22) 09.06.2023
(24) 22.02.2024
(72) Калинник Ігор Вікторович (UA)
(73) КАЛИННИК ІГОР ВІКТОРОВИЧ
вул. Шовковична, 20/15, м. Київ, 01024 (UA)
(54) ЗАХИЩЕНИЙ КОНТЕЙНЕР ДЛЯ ТРИВАЛОГО ЗБЕ-
РІГАННЯ НОСІЯ ДАНИХ
(57) 1. Захищений контейнер для тривалого зберігання носія даних, який містить корпус, що складається щонайменше з верхньої частини та нижньої частини, сполучених одна з одною з утворенням внутрішньої порожнини, в якій закріплений щонайменше один ложемент з вирізом для розташування носія даних, який **відрізняється** тим, що верхня частина корпусу та нижня частина корпусу виконані у формі півсфери з утворенням сфери у сполученому між собою стані, причому одна частина з вказаних частин корпусу має виступ, розташований по периметру основи цієї частини корпусу, на зовнішній боковій поверхні вказаного виступу виконано зовнішню різь, а інша частина з вказаних частин корпусу має виріз, розташований по периметру основи цієї частини корпусу, внутрішній діаметр вирізу відповідає зовнішньому діаметру виступу, на внутрішній боковій поверхні вказаного вирізу виконано внутрішню різь.
2. Контейнер за п. 1, який **відрізняється** тим, що верхня частина корпусу та нижня частина корпусу виконані з титану.
3. Контейнер за п. 1, який **відрізняється** тим, що верхня частина корпусу та нижня частина корпусу сполучені між собою з утворенням технічного вакууму у внутрішній порожнині корпусу.

Розділ Н:

Електрика

Н 01

- (11) **155389** (51) МПК
H01F 27/24 (2006.01)
- (21) **и 2023 04569** (22) **27.09.2023**
(24) **22.02.2024**
- (72) Ставинський Андрій Андрійович (UA), Ставинський Ростислав Андрійович (UA), Циганов Олександр Миколайович (UA), Авдеева Олена Андріївна (UA), Вахоніна Лариса Володимирівна (UA)
- (73) **МИКОЛАЇВСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ АГРАРНИЙ УНІВЕРСИТЕТ**
вул. Георгія Гонгадзе, 9, м. Миколаїв, 54008 (UA)
- (54) **ТРИФАЗНИЙ СТИКОВИЙ МАГНІТОПРОВІД**
- (57) 1. Трифазний стиковий магнітопровід, який містить стрижневі і яремні частини, що утворені спряженням ділянок поверхонь трьох С-подібних елементів з охоплюючих шарів електротехнічної сталі, який **відрізняється** тим, що два елементи розташовані боковими поверхнями в єдиній площині, а третій елемент розташований боковими поверхнями ортогонально площині двох інших елементів.
2. Трифазний стиковий магнітопровід за п. 1, який **відрізняється** тим, що розташовані боковими поверхнями в єдиній площині елементи виконані з ізотропної сталі, а третій елемент виконаний з анізотропної сталі.

Н 02

- (11) **155367** (51) МПК (2024.01)
H02G 7/00
- (21) **и 2023 03888** (22) **15.08.2023**
(24) **22.02.2024**
- (72) Штерн Юлія Олексіївна (UA)
- (73) **ШТЕРН ЮЛІЯ ОЛЕКСІЇВНА**
вул. Університетська, 118, кв. 53, м. Донецьк, 83004 (UA)
- (54) **В'ЯЗКА СПІРАЛЬНА ТИПУ ВС**
- (57) 1. В'язка спіральна, що містить елемент для закріплення проводу на ізоляторі, яка **відрізняється** тим, що як такий елемент виступає спіральне пасмо, що складається з двох чи трьох дрітків з алюмінієвого сплаву або оцинкованої сталі, які склеєні або зварені між собою.
2. В'язка спіральна за п. 1, яка **відрізняється** тим, що спіральне пасмо виконане у вигляді бокової в'язки, що однією частиною утворює петлю навколо ізолятора, за допомогою якої відбувається одиночне кріплення проводу на ізоляторі, а іншою частиною охоплює провід.

3. В'язка спіральна за п. 1, яка **відрізняється** тим, що спіральне пасмо виконане у вигляді натяжної в'язки, що має вигляд U-подібної петлі, та середньою частиною, що має звиту ділянку, охоплює шийку ізолятора, а іншими частинами - провід.

- (11) **155362** (51) МПК
H02G 7/02 (2006.01)
H02G 7/05 (2006.01)
- (21) **и 2023 03530** (22) **20.07.2023**
(24) **22.02.2024**
- (72) Штерн Юлія Олексіївна (UA)
- (73) **ШТЕРН ЮЛІЯ ОЛЕКСІЇВНА**
вул. Університетська, 118, кв. 53, м. Донецьк, 83004 (UA)
- (54) **ВУЗОЛ КРІПЛЕННЯ**
- (57) Вузол кріплення ізолюючих підвісок до опор повітряних ліній електропередач, що складається з елементів, що призначені для з'єднання з іншою арматурою і опорою, та кріпильних деталей, який **відрізняється** тим, що як елемент, що призначений для з'єднання з траверсою опори та іншою арматурою, що утворює підвіску, використовується U-подібний болт, що забезпечує шарнірне з'єднання ланцюгового типу та має можливість для подальшого з'єднання із сергою або скобою.

- (11) **155368** (51) МПК
H02G 7/02 (2006.01)
H02G 7/05 (2006.01)
- (21) **и 2023 03894** (22) **15.08.2023**
(24) **22.02.2024**
- (72) Штерн Юлія Олексіївна (UA)
- (73) **ШТЕРН ЮЛІЯ ОЛЕКСІЇВНА**
вул. Університетська, 118, кв. 53, м. Донецьк, 83004 (UA)
- (54) **РОЛИК МОНТАЖНИЙ**
- (57) Ролик монтажний, що містить ролик, дві щок та вісь, який **відрізняється** тим, що ролик має отвір посередині та розташований між двома стійками з алюмінієвого сплаву по його боках і з'єднується з ними за допомогою осі, що виконана зі сталі та встановлена через отвори у ролику і двох стійках, причому стійки з'єднані з двома щокками, що розташовані поверх стійок, а місце з'єднання ролика зі стійками закрито двома кришками, при цьому щокки за допомогою кріпильних деталей з'єднані з проміжною ланкою з алюмінієвого сплаву.

Н 04

- (11) **155363** (51) МПК
H04B 7/005 (2006.01)

(21) u 2023 03639 (22) 27.07.2023

(24) 22.02.2024

(72) Дуднік Андрій Сергійович (UA), Фесенко Андрій Олексійович (UA), Усаченко Олександр Олександрович (UA)

(73) ПРИВАТНЕ АКЦІОНЕРНЕ ТОВАРИСТВО "ВИЩИЙ НАВЧАЛЬНИЙ ЗАКЛАД "МІЖРЕГІОНАЛЬНА АКАДЕМІЯ УПРАВЛІННЯ ПЕРСОНАЛОМ"
вул. Фрометівська, 2, м. Київ, 03039 (UA)

(54) СПОСІБ ВИЯВЛЕННЯ РУХУ ОБ'ЄКТІВ ЧЕРЕЗ ЛІНІЮ ЗІТКНЕННЯ

(57) 1. Спосіб виявлення руху об'єктів, в якому використовують принаймні два датчики руху, який відрізняється тим, що використовують датчики різних типів, які пов'язані між собою через мікроконтролер, за допомогою якого автоматично формують сигнал про ви-

явлення руху об'єктів на основі альтернативних джерел - від різних типів датчиків, та за допомогою засобів зв'язку передають дані в систему обробки інформації.

2. Спосіб за п. 1, який відрізняється тим, що використовують датчик інфрачервоного випромінювання та датчик ультразвукового випромінювання.

3. Спосіб за п. 2, який відрізняється тим, що як датчик інфрачервоного випромінювання використовують інфрачервоний датчик HC-SR501, як датчик ультразвукового випромінювання - ультразвуковий датчик HC-SR04, а як контролер - мікроконтролер ArduinoNano.

СПОВІЩЕННЯ

ВИНАХОДИ

Зміна імені або повного найменування і/або адреси володільця патенту, чи зміна особи володільця патенту

| (11) Номер реєстрації, що є номером патенту | (73) Ім'я або повне найменування та адреса володільця патенту |
|---|---|
| 126932 | ЯРА ЮК ЛІМІТЕД, Pocklington Industrial Estate, Pocklington, York, YO42 1DN, United Kingdom (GB) |

Припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід у зв'язку із закінченням строку чинності

| (11) Номер реєстрації, що є номером патенту | Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід | (11) Номер реєстрації, що є номером патенту | Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід |
|---|---|---|---|
| 82685 | 09.02.2024 | 94358 | 12.02.2024 |
| 92130 | 12.02.2024 | 104277 | 12.02.2024 |

Заява володільця патенту про готовність надання будь-якій особі дозволу на використання запатентованого винаходу

| (11) Номер реєстрації, що є номером патенту | (46) Дата публікації та номер бюлетеня | (54) Назва винаходу | Ім'я або повне найменування володільця патенту та адреса для листування |
|---|--|---|---|
| 127508 | 13.09.2023, Бюл. № 37 | ПРИСТРІЙ ДЛЯ ЗАХИСТУ ДОВКІЛЛЯ ВІД ПРОТІКАННЯ ОБСАДНИХ ТРУБ У ТОВЩІ ВОДИ | НАЦІОНАЛЬНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ "ДНІПРОВСЬКА ПОЛІТЕХНІКА",
просп. Д. Яворницького, 19, м. Дніпро, 49000

НТУ "Дніпровська політехніка",
просп. Д. Яворницького, 19, м. Дніпро, 49005 |

КОРИСНІ МОДЕЛІ

Припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель у зв'язку із закінченням строку чинності

| (11) Номер реєстрації, що є номером патенту | Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель | (11) Номер реєстрації, що є номером патенту | Дата припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель |
|---|--|---|--|
| 88401 | 04.11.2023 | 91290 | 12.02.2024 |
| 91289 | 12.02.2024 | | |

Заява володільця патенту про готовність надання будь-якій особі дозволу на використання запатентованої корисної моделі

| (11) Номер реєстрації, що є номером патенту | (46) Дата публікації та номер бюлетеня | (54) Назва корисної моделі | Ім'я або повне найменування володільця патенту та адреса для листування |
|---|--|---|---|
| 154701 | 06.12.2023, Бюл. № 49 | СТРИЖНЕВИЙ ОДНОФАЗНИЙ ТРАНСФОРМАТОР ПОТУЖНОСТІ ВИСОКОЇ ЧАСТОТИ ІЗ ЗАМКНУТИМ МАГНІТОПРОВОДОМ | НАЦІОНАЛЬНИЙ ТЕХНІЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ "ДНІПРОВСЬКА ПОЛІТЕХНІКА", просп. Д. Яворницького, 19, м. Дніпро, 49000

НТУ "Дніпровська політехніка", просп. Д. Яворницького, 19, м. Дніпро, 49005 |

Передача виключних майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель

| (11) Номер реєстрації, що є номером патенту | Ім'я або повне найменування та адреса володільця патенту | Ім'я або повне найменування та адреса правонаступника володільця патенту | Реєстраційний номер рішення |
|---|---|---|-----------------------------|
| 99754, 103858 | КОНІНКЛЕЙКЕ ФІЛІПС Н.В., High Tech Campus 5, 5656 AE Eindhoven, the Netherlands (NL) | Версуні Холдінг Б.В., High Tech Campus 42, 5656 AE Eindhoven, the Netherlands (NL) | 2584 |
| 118557 | Гуменюк Віктор Олегович, вул. Перегонець, 44/5, м. Сімферополь, АР Крим, 95022, Рошка Валерій Володимирович, просп. Маяковського, 20, кв. 255, м. Київ, 02217 | Дичка Тарас Дмитрович, вул. Незалежності, буд. 15, кв. 2, смт Брошнів-Осада, Калуський р-н, Івано-Франківська обл., 77611, Мицак Віталій Ярославович, вул. Івана Франка, буд. 18, кв. 31, смт Брошнів-Осада, Калуський р-н, Івано-Франківська обл., 77611 | 2585 |
| 118629 | Гуменюк Віктор Олегович, вул. Перегонець, 44/5, м. Сімферополь, АР Крим, 95022, Рошка Валерій Володимирович, просп. Маяковського, 20, кв. 255, м. Київ, 02217 | Дичка Тарас Дмитрович, вул. Незалежності, буд. 15, кв. 2, смт Брошнів-Осада, Калуський р-н, Івано-Франківська обл., 77611, Мицак Віталій Ярославович, вул. Івана Франка, буд. 18, кв. 31, смт Брошнів-Осада, Калуський р-н, Івано-Франківська обл., 77611 | 2586 |

ЗМІСТ

| | |
|---|------------------|
| Відомості про заявки на державну реєстрацію винаходів | 2.1 |
| Розділ А: Життєві потреби людини | 2.1 |
| Розділ В: Виконання операцій. Транспортування | 2.104 |
| Розділ С: Хімія. Металургія | 2.112 |
| Розділ Е: Будівництво | 2.150 |
| Розділ F: Машинобудування. Освітлювання. Опалювання.
Зброя. Підривні роботи | 2.154 |
| Розділ G: Фізика | 2.156 |
| Розділ H: Електрика | 2.159 |
|
Відомості про державну реєстрацію винаходів |
3.1 |
| Розділ А: Життєві потреби людини | 3.1 |
| Розділ В: Виконання операцій. Транспортування | 3.6 |
| Розділ С: Хімія. Металургія | 3.10 |
| Розділ H: Електрика | 3.14 |
|
Відомості про державну реєстрацію корисних моделей |
4.1 |
| Розділ А: Життєві потреби людини | 4.1 |
| Розділ В: Виконання операцій. Транспортування | 4.5 |
| Розділ С: Хімія. Металургія | 4.11 |
| Розділ Е: Будівництво | 4.13 |
| Розділ F: Машинобудування. Освітлювання. Опалювання.
Зброя. Підривні роботи | 4.15 |
| Розділ G: Фізика | 4.18 |
| Розділ H: Електрика | 4.20 |
|
Сповіднення |
7.1.1 |
|
Винаходи |
7.1.1 |
| Зміна імені або повного найменування і/або адреси володільця патенту,
чи зміна особи володільця патенту | 7.1.1 |
| Припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на винахід
у зв'язку із закінченням строку чинності | 7.1.1 |
| Заява володільця патенту про готовність надання будь-якій особі дозволу
на використання запатентованого винаходу | 7.1.1 |

| | |
|---|--------------|
| Корисні моделі | 7.2.1 |
| Припинення чинності майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель
у зв'язку із закінченням строку чинності | 7.2.1 |
| Заява володільця патенту про готовність надання будь-якій особі дозволу
на використання запатентованої корисної моделі | 7.2.1 |
| Передача виключних майнових прав інтелектуальної власності на корисну модель | 7.2.1 |

ПРОМИСЛОВА ВЛАСНІСТЬ

ВИНАХОДИ

КОРИСНІ МОДЕЛІ

КОМПОНУВАННЯ НАПІВПРОВІДНИКОВИХ ВИРОБІВ

ДОДАТКОВА ОХОРОНА ПРАВ НА ВИНАХОДИ

Бюлетень № 8, 2024

Том 1

Відповідальний за випуск

І.Є. Матусевич

Редагування:

Добриніна І.В.
Белоус Т.П.
Грицай Н.П.
Зедгенідзе О.В.
Козирева В.Д.
Кондратська Н.Й.
Кухар І.В.

Солодовник А.О.
Харченко Р.Ч.

Комп'ютерна верстка:

Андрусенко Я.В.
Гуцалюк О.В.
Казбан М.М.
Мироненко І.М.



nipo.gov.ua



office@nipo.gov.ua



вул. Дмитра Годзенка, 1, м. Київ, Україна, 01601