

[11] رقم النشر: SA 99191266 A

[43] تاريخ النشر: 1426/11/01 هـ

الموافق: 2005/12/03 م



[19] المملكة العربية السعودية SA

مدينة الملك عبدالعزيز للعلوم والتقنية

[12] طلب براءة اختراع

[51] التصنيف الدولي : Int. CL.: A61K 031/041	[72] اسم المخترع : توشيهيكو فوجيوارا، كويشي ايواساكي، هيرويوشي هوديكوشي
[30] بيانات الأسبقية : JP 9-323182 1997/11/25	[71] مقدم الطلب : سانكيو كمبني ليمتد العنوان : 1-5 ، نيهونباشي هونشو ، 3-تشوم، تشو كو، الرمز البريدي : 8426-103 طوكيو، اليابان الجنسية : يابانية
	[74] الوكيل : مكتب سعود محمد علي الشواف للمحاماة والاستشارات القانونية ش رقم الطلب : 99191266 تاريخ الابداع : 1419/12/20 هـ الموافق : 1999/04/06 م

[54] اسم الاختراع : طريقة وتركيب لعلاج فرط حمض
اليوريك في الدم والوقاية منه

METHOD AND COMPOSITION FOR
THE TREATMENT AND PREVENTION
OF HYPERURICEMIA

[57] الملخص: يتعلق هذا الاختراع بمعززات حساسية
انسولين، مثل عقار تروجليتازون، ذات قدرة على علاج
فرط حمض اليوريك في الدم او الوقاية منه، ويمكن على
هذا الاساس، استخدامه لعلاج او الوقاية من امراض مثل
داء النقرس والحصاة البولية والاعتلال الكلوي الناتج عن
فرط حمض اليوريك في الدم ومتلازمة ليش-نيهام.

بسم الله الرحمن الرحيم

طريقة وتركيب لعلاج فرط حمض اليوريك في الدم والوقاية منه

الملخص

يتعلق هذا الاختراع بمعززات حساسية انسولين، مثل عقار تروجليتازون، ذات قدرة على علاج فرط حمض اليوريك في الدم أو الوقاية منه، ويمكن على هذا الأساس، استخدامه لعلاج أو الوقاية من أمراض مثل داء النقرس والحصاة البولية والاعتلال الكلوي الناتج عن فرط حمض اليوريك في الدم ومتلازمة ليش-نيهام.

طريقة وتركيب لعلاج فرط حمض اليوريك في الدم والوقاية منه

الوصف الكامل

خلفية الاختراع :

يتعلق الاختراع الراهن بتركيب وطريقة لعلاج فرط حمض اليوريك في الدم والوقاية منه، حيث يكون العامل الفعال على شكل مادة محسنة لمقاومة الانسولين، والتي تسمى عادة "معززات حساسية الانسولين".

٥ ان فرط حمض اليوريك في الدم هو مرض يتميز بمستوى مرتفع بدرجة غير اعتيادية لحمض اليوريك في البلازما. وتتشعب البلازما بحمض اليوريك عند تركيز ٧,٠ ملي جرام/ديسيلتر. وإذا وصل مستوى حمض اليوريك في الدم إلى هذا المستوى أو زاد عنه بسبب خلل أيضي مقترن بحمض اليوريك، فإن الحالة الناتجة تسمى "فرط حمض اليوريك في الدم". وعندما يزيد تركيز حمض اليوريك عن مستوى معين فإنه يترسب على شكل يورات أحادي الصوديوم وقد يترسب في أنسجة متنوعة كالتجويف المفصلي أو الكلية. وقد يسبب هذا الترسيب داء النقرس أو خلل في الجهاز البولي أو اعتلال وعائي. وقد يحدث فرط حمض اليوريك في الدم بسبب الافراغ المنخفض لحمض اليوريك أو بسبب انتاجه المفرط أو بسبب تشكيلة من كلا السببين، وقد ينتج أيضا من امراض اخرى، مثلا من وجود حالة انزيمية شاذة في أيض البورين. وهذا يدعى "الاسباب الاولى". كذلك قد يحدث فرط حمض اليوريك في الدم بسبب امراض اخرى مثل حدوث خلل في أعضاء تكوين خلايا الدم وخلل في الجهاز البولي وإعطاء دواء مثل بيرازيناميد أو ثيازيد. وهذا يدعى "الاسباب الثانوية".

وتشمل امثلة الامراض التي يسببها فرط حمض اليوريك في الدم داء النقرس (ويشمل التهاب المفاصل النقرسي والنقرس الرملي المزمن)، والحصاة البولية، والاعتلال الكلوي الناتج عن فرط حمض اليوريك في الدم (الاعتلال الكلوي النقرسي المزمن والاعتلال الكلوي الحاد الناتج عن فرط حمض اليوريك في الدم)، ومتلازمة ليش-نيهام.

وقد يتمثل العلاج الأولي لأعراض فرط حمض اليوريك في الدم، وعلى الأخص النقرس، في إعطاء عامل مسكن للألم مثل كولتشييسين و/أو عامل مسكن للألم مضاد للالتهابات مثل اندومثاسين. ويتمثل الإجراء المتبع لعلاج مشكلة فرط حمض اليوريك في الدم على المدى البعيد في التحكم بالحمية، مثلاً بتحديد تناول الكحول، أو بالتحكم في السعرات الحرارية الداخلة. بيد أنه، إذا لم يعمل هذا العلاج الغذائي جيداً بدرجة كافية، يمكن علاج المرض بإعطاء عقاقير، على سبيل المثال الاعمدة الوقائي لعامل مسكن للألم مثل كولاتشييسين أو بواسطة منشط إفراغ حمض اليوريك مثل بروبنيسيد أو كبريتين بيرازون أو كيتوفنيل بوتازون أو بوكولوم أو بنزوبرومارون، أو بواسطة مثبط تخليق حمض اليوريك مثل ألوبيورينول.

١٠. وفي السنوات الأخيرة طُورت معززات حساسية الانسولين للوقاية من مرض السكري أو علاجه. ويعني اصطلاح "معزز حساسية الانسولين" المستخدم في هذا البيان مركباً يحسن الفعالية الضعيفة للانسولين بصرف النظر عن وجود الانسولين ذي المنشأ الداخلي. ويشمل اصطلاح "معزز حساسية الانسولين" تشكيلة واسعة من المركبات، وتشمل الامثلة النموذجية مختلف مركبات ثيازوليدين ديون ومركبات اوكرازوليدين ديون ومركبات ايزوكسازوليدين ديون ومركبات اوكسا ثنائي زوليدين ديون. وقد وصفت هذه المركبات، على سبيل المثال، في طلب البراءة الدولية رقم ٩٤/٠١٤٣٣ (المناظر لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ٦-٨٠٦٦٧)، وطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ٤-٦٩٣٨٣، وطلب البراءة الدولية رقم ٩٢/٠٢٥٢٠ (المناظر لنشرة البراءات باللغة اليابانية وفق معاهدة التعاون الدولية بشأن البراءات رقم هيه ٦-٥٠٠٥٣٨)، وطلب البراءة الدولية رقم ٩١/٠٧١٠٧ (المناظر لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ٣-١٧٠٤٧٨ وينظر نشرة البراءات اليابانية رقم هيه ٧-٨٨٦٢)، والبراءة الامريكية رقم ٣١٧ ١٣٢ ٥ (المناظرة لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ٣-٩٠٠٧١)، والبراءة الامريكية رقم ٤٠٥ ٨٩٧ ٤ (المناظرة لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ٢-٢٩٢٢٧٢)، وطلب البراءة الدولية رقم ٨٩/٠٨٦٥١ (المناظر لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ١-٢٧٢٥٧٤)، والبراءات الامريكية أرقام ٧٠٧ ٦١٠.

- ٥ و ٧٥٤ ١٢٠ ٥ و ٥٢٢ ٢٢٣ ٥ (المناظرة لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ١-٥٢٣٢٧٢٥٧٣)، والبراءات الامريكية أرقام ٩٥٣ ٠٠٢ ٥ و ٤٤٣ ١٩٤ ٥ و ٩٢٥ ٢٣٢ ٥ و ٤٤٥ ٢٦٠ ٥ (المناظرة لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ١-١٣١١٦٩)، والبراءة الامريكية رقم ٩١٨ ٠٩١ ٤ (المناظرة لطلب البراءة اليابانية رقم شو ٦٤-١٣٠٧٦ ٥)، والبراءتين الامريكيتين رقم ٣٩٣ ٨٩٧ ٤ و ٩٤٨ ٩٠٠ ٤ (المناظرتين لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم شو ٦٤-٥٦٦٧٥ المناظر لنشرة البراءات اليابانية رقم هيه ٥-٥٨٢٣)، والبراءة الامريكية رقم ٢٥٥ ٨٧٣ ٤ (المناظرة لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم شو ٦٤-٣٨٠٩٠)، والبراءة الامريكية رقم ٠٥٢ ٧٠٣ ٤ (المناظرة لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم شو ٦١-٢٧١٢٨٧ المناظر لنشرة البراءات اليابانية رقم هيه ٥-٨٦٩٥٣)، والبراءة الامريكية رقم ٧٧٧ ٦٨٧ ٤ (المناظرة لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم شو ٦١-٢٦٧٥٨٠ المناظر لنشرة البراءات اليابانية رقم هيه ٥-٣١٠٧٩)، والبراءة الامريكية رقم ٦١٠ ٧٢٥ ٤ (المناظرة لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم شو ٦١-٨٥٣٧٢ المناظر لنشرة البراءات اليابانية رقم هيه ٥-٦٦٩٥٦)، والبراءة الامريكية رقم ٩١٢ ٥٧٢ ٤ (المناظرة لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم شو ٦٠-٥١١٨٩ المناظر لنشرة البراءات اليابانية رقم هيه ١٥-٣١٠٧٩-٢)، والبراءة الامريكية رقم ٩٠٢ ٤٦١ ٤ (المناظرة لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم شو ٥٨-١١٨٥٧٧ المناظر لنشرة البراءات اليابانية رقم هيه ٢-٥٧٥٤٦)، والبراءات الامريكية أرقام ٢٠٠ ٢٨٧ ٤ و ٦٠٥ ٣٤٠ ٤ و ١٤١ ٤٣٨ ٤ و ٧٧٩ ٤٤٤ ٤ (المناظرة لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم شو ٥٥-٢٢٦٣٦ المناظر لنشرة البراءات اليابانية رقم شو ٦٢-٤٢٩٠٣)، وطلب البراءة الاوروبية رقم ٠٩٨ ٧٠٨ ٠ ٢. (المناظرة لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ٩-٤٨٧٧٩) وطلب البراءة الاوروبية رقم ٣٩٨ ٦٧٦ ٠ (المناظر لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ٧-٣٣٠٧٢٨)، وطلب البراءة الدولية رقم ٩٥/١٨١٢٥، وطلب البراءة الاوروبية رقم ٦٠٠ ٧٤٥ ٠، وطلب البراءة الاوروبية رقم ٣٣٢ ٣٣٢ ٠ (المناظر لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ١-١)

٢٧٢٥٧٤)، وطلب البراءة الأوروبية رقم ٩٨٣ ٦٠٤ ٠ (المناظر لطلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ٦-٢٤٧٩٤٥).

فمثلا، يكون مركب ٥-[٤-٦-هيدروكسي-٨،٧،٥،٢-رابع مثيل كرومانيل (٢)-
مثوكسي)بنزيل]-ثيازوليدين-٤،٢-ديون (المسمى لاحقا في هذا البيان عقار "تروجليتازون")
٥ على شكل مشتق ثيازوليدين ذي قابلية على تعزيز تأثير الانسولين وهو معروف في علاج
السكري و/أو الوقاية منه [تتظر مقالة فوجيوارا ومن معه في مجلة "السكري"، المجلد ٣٧،
الصفحة ١٤٥٩ (١٩٨٨)؛ ومقالة هوفمان سي.ايه. ومن معه في مجلة "العناية بمرضى
السكري"، المجلد ١٥، الصفحة ١٠٧٥ (١٩٩٢)]. وقد أبلغ أيضا أن لهذا المركب تأثير مضاد
لأكسدة ولذلك يستعمل كعلاج لمرض السكري المعتمد على الانسولين (مرض
١٠ السكري نوع ١ : (IDMM)) [تتظر مجلة "تونيوبيو (السكري)"، المجلد ٣٧ العدد (٢)،
الصفحات ١٢٧-١٢٩ (١٩٩٤)].

بيد أنه لم يبلغ في السابق عن صلاحية أي مركب من المركبات أعلاه في علاج
فرط حمض اليوريك في الدم و/أو الوقاية منه.

ويوجد، على سبيل المثال، تقرير اعتمد على قيم فحوصات اكلينيكية تخص العلاقة
١٥ بين اعطاء عقار CS-045 (تروجليتازون) وحمض اليوريك. واستنادا إلى هذا التقرير، كان
مستوى حمض اليوريك قبل اعطاء عقار تروجليتازون يساوي 4.7 ± 1.7 ملي جرام/ديسيلتر
والذي انخفض بدرجة طفيفة إلى 4.4 ± 1.4 ملي جرام/ديسيلتر بعد اعطاء العقار. ويقع هذا
الانخفاض ضمن التغيرات الطبيعية المتوقعة، ولا يوجد أي تنويه عن فعالية اعطاء عقار
تروجليتازون يكون في علاج فرط حمض اليوريك في الدم أو الوقاية منه [تتظر مجلة "رينشو
٢٠ اياكو (الطب الاكلينيكي)"، المجلد ٩، الملحق ٣ (نشرة يوليو)، الصفحة ١٤ (١٩٩٤)].

كذلك توجد تقارير تخص العلاقة بين فرط حمض اليوريك في الدم ومقاومة
الانسولين. وتنوه هذه التقارير عن العلاقة ولا تقدم أي افتراض عن فعالية معزز حساسية
الانسولين في علاج فرط حمض اليوريك في الدم أو الوقاية منه [تتظر مجلة "تونيوبيو
(السكري)"، المجلد ٤٠، العدد الاضافي، الصفحة ٢٣٩ (١٩٩٧)، ومجلة "سوجو رينشو

(المستوصفات في كل مكان)"، المجلد ٤٦ العدد (٨)، الصفحات ٢١٢٨-٢١٣٠ (١٩٩٧) ومجلة "مبيو"، المجلد ١٤ العدد (٩)، الصفحات ٩٠-٩٦ (١٩٩٧).

وعلى سبيل المثال، تم الإبلاغ عن أن مركب ١-(٣-بروموبنزو[b] فورانيل (٢)-كبريتونيل)-هايدانتوين (طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ٦-٢١١٦٥٧) أو مشتقات بنزوبيران (طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم شو ٦٣-١٠٧٩٧١) مثل خلاصات اثيل]](٥-كلورو-٣-(٢-مثيل فنييل)-٤-اوكسو-H٤-١-بنزوبيرانيل(٧)) اوكسي} تكون فعالة في الوقاية من فرط حمض اليوريك في الدم وعلاجه. بيد أن هذه المركبات تختلف في بنيتها من جميع الوجوه عن مركبات الاختراع الراهن.

وقد اكتشف اصحاب الاختراع الراهن بشكل يبعث على الدهشة الكبيرة أن بعض اصناف محددة من مركبات تعمل كمعززات حساسية الانسولين تكون ذات قابلية أيضا على علاج فرط حمض اليوريك في الدم و/أو الوقاية منه.

الوصف العام للاختراع

يتمثل هدف الاختراع الراهن في تقديم طريقة لعلاج فرط حمض اليوريك في الدم أو الوقاية منه.

١٥ ويتمثل هدف آخر للاختراع الراهن في تزويد مركب لعلاج فرط حمض اليوريك في الدم أو الوقاية منه.

وسوف تتضح أهداف ومزايا أخرى للاختراع الراهن من الوصف التالي.

وعلى هذا الاساس، يقدم الاختراع الراهن طريقة لعلاج فرط حمض اليوريك في الدم أو الوقاية منه في كائن لبون يعاني من فرط حمض اليوريك في الدم. وتشتمل الطريقة على ٢٠ اعطاء الكائن اللبون المذكور معزز حساسية انسولين يكون فعالا في تخفيض أو منع فرط حمض اليوريك في الدم.

كما يزود الاختراع الراهن مركبا لعلاج فرط حمض اليوريك في الدم أو الوقاية منه في كائن لبون يعاني من فرط حمض اليوريك في الدم. ويحتوي المركب على مقدار فعال من معزز حساسية انسولين.

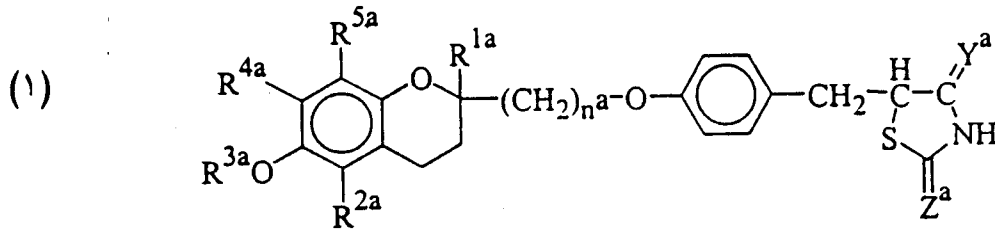
الوصف التفصيلي

ويفضل، على وجه التحديد، اختيار معززات حساسية الانسولين المستخدمة في الاختراع الراهن من المجموعة التي تشتمل على مركبات ثيازوليدين ديون ومركبات ايمينوثيازوليدينون ومركبات ثاني ايمينو ثيازوليدين ومركبات ثيوكسو ثيازوليدينون ومركبات ايمينوثالث ازول ومركبات اوكسازوليدين ديون ومركبات ايزوكسازوليدين ديون ومركبات اوكسا ثاني زوليدين ديون، وتفضل منها مركبات ثيازوليدين ديون. كذلك تشمل المركبات املاحها المقبولة صيدليا.

وفيما يلي امثلة على معززات حساسية الانسولين التي يمكن استخدامها في الاختراع الراهن.

١٠. اولا : يصف طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم شو ٥١١٨٩-٦٠ (نشرة البراءات اليابانية رقم هيه ٣١٠٩٧-٢)، والبراءة الامريكية رقم ٩١٢ ٥٧٢ ٤ وطلب البراءة الاوروبية رقم ١٣٩٤٢١ ما يلي :

(١) مشتقات ثيازوليدين التي تمثلها الصيغة (١) التالية :



١٥ حيث :

يكون R^{1a} و R^{2a} متماثلين أو مختلفين، ويمثل كل منهما ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٥ ذرات كربون؛

وتمثل R^{3a} ذرة هيدروجين أو مجموعة اسيل اليفاتية تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو مجموعة الكيل كربونيل حلقي تحتوي من ٦ إلى ٨ ذرات كربون، أو مجموعة ٢. بنزويل أو نفطويل تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل χ المعرفة في أدناه، أو مجموعة أسيل حلقي مخططة حيث يحتوي

القسم المخطط منها من ٤ إلى ٧ ذرات حلقية منها ١ إلى ٣ على شكل ذرات متباينة تختلر من المجموعة التي تشتمل على ذرات النيتروجين والاكسجين والكبريت، أو مجموعة فنيل خليل، أو مجموعة فنيل بروبيونيل أو مجموعة فنيل خليل أو فنيل بروبيونيل بها بديل واحد على الأقل من ذرة هالوجين، أو مجموعة سينامويل، أو مجموعة الكوكسي كربونيل ٥ تحتوي من ٢ إلى ٧ ذرات كربون، أو مجموعة بنزيلوكسي كربونيل؛

ان البديل χ المذكور هو عبارة عن مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة هيدروكسي، أو ذرة هالوجين، أو مجموعة امينو، أو مجموعة الكيل امينو تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة ثاني الكيل امينو تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون في كل مجموعة الكيل، أو ١٠ مجموعة نيترو؛

ويكون R^{4a} و R^{5a} متماثلين أو مختلفين ويمثل كل منهما ذرة هيدروجين، أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٥ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٥ ذرات كربون؛ أو يمثل R^{4a} و R^{5a} معا مجموعة الكيلين ديوكسي تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون؛ ويكون Y^a و Z^a متماثلين أو مختلفين ويمثل كل منهما ذرة اكسجين أو مجموعة ايمينو؛ ١٥ وتمثل n^a عددا صحيحا من ١ إلى ٣.

وأملأها المقبولة صيدليا.

وبالنسبة لمركبات الصيغة (١) فقد وصفت التفاصيل، مثل تعاريف R^{1a} و R^{2a} و R^{3a} و R^{4a} و R^{5a} و Y^a و Z^a و n^a وأنواع الملح المقبول صيدليا، وعملية تحضير مركبات الصيغة (١) وامثلة على المركب وامثلة على تحضير المركب، في طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم شو ٢٠ ٥١١٨٩-٦٠ (نشرة البراءات اليابانية رقم هيه ٣١٠٧٩٠٠٢) وفي البراءة الامريكية رقم ٤٥٧٢٩١٢ وفي نشرة البراءات الاوروبية رقم ١٣٩٤٢١، والتي ادمجت محتوياتها في هذا البيان كمرجع.

وعندما تمثل R^{1a} أو R^{2a} أو R^{4a} أو R^{5a} ، على وجه التحديد، مجموعة الكيل فانها قد تكون مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٥ ذرات

كربون، وتشمل امثلتها مجاميع المثيل والاثيل والبروبيل والايزوبروبيل والبيوتيل والايزوبيوتيل والبيوتيل الثانوي والبيوتيل الثلاثي والبنثيل و ١-مثيل بوتيل و ٢-مثيل بوتيل و ٣-مثيل بوتيل و ١-اثيل بروبييل و ٢-اثيل بروبييل. ويفضل من مجاميع الالكيل هذه المجاميع التي تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، والأفضل من بينها مجموعة المثيل.

٥ وعندما تمثل R^{3a} مجموعة اسيل اليفاتية تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، فانها قد تكون مجموعة مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة، وتشمل الامثلة المحددة مجاميع الفورميل والخليل والبروبيونيل والبيوتيريل والايزوبيوتيريل والبيفالويل والفالريل والايزوفالريل والهكسانويل.

وعندما تمثل R^{3a} مجموعة الكيل حلقي كربونيل، فانها تحتوي من ٦ إلى ٨ ذرات ١. كربون (أي من ٥ إلى ٧ ذرات كربون في مجموعة الالكيل الحلقي). وتشمل امثلة مجاميع من هذا القبيل مجاميع بنتيل حلقي كربونيل وهكسيل حلقي كربونيل وهبتيل حلقي كربونيل.

وعندما تمثل R^{3a} مجموعة اسيل حلقيه مغلطة، فانها تكون مجموعة تتصل بها مجموعة حلقيه مغلطة مع مجموعة كربونيل. ويحتوي الجزء الحلقي المغلط من ٤ إلى ٧ ذرات حلقيه، ويفضل ٥ أو ٦ ذرات حلقيه منها ١ إلى ٣ ذرات، والأفضل ذرة واحدة أو ١٥ ذرتان، والأفضل على الاطلاق ذرة واحدة، على شكل ذرة متباينة تختار من المجموعة التي تشتمل على ذرات النيتروجين والاكسجين والكبريت. وعندما توجد ٣ ذرات متباينة في المجموعة الحلقيه المغلطة، حينها يفضل أن تكون كلها ذرات نيتروجين أو تكون ذرة واحدة أو ذرتان عبارة عن ذرة نيتروجين. وبالمقابل تكون ذرتان أو ذرة واحدة عبارة عن ذرة اكسجين و/أو ذرة كبريت. ويفضل أن تكون المجموعة الحلقيه المغلطة مجموعة عطرية. ٢. وتشمل امثلة مجاميع اسيل حلقيه مغلطة مفضلة مجاميع الفورميل (والأفضل ٢-فورميل) والثويل (والأفضل ٣-ثويل) و ٣-بيريدين كربونيل (نيكوتينويل) و ٤-بيريدين كربونيل (ايزونيكوتينويل).

وعندما تمثل R^{3a} مجموعة الكوكسي كربونيل، فانها قد تكون مجموعة الكوكسي كربونيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون في جزء

الالكوكسي، أي تحتوي على ما مجموعه ٢ إلى ٧ ذرات كربون، مثل مجاميع الميثوكسي كربونيل والاثوكسي كربونيل والبروبوكسي كربونيل والايزوبروبوكسي كربونيل والبيوتوكسي كربونيل والايزوبيوتوكسي كربونيل والبيوتوكسي كربونيل والثلاثي والبنثيلوكسي كربونيل والهكسيلوكسي كربونيل، ويفضل منها مجاميع الالكوكسي كربونيل التي ٥ تحتوي من ٢ إلى ٤ ذرات كربون، والأفضل من بينها مجموعة الاثوكسي كربونيل.

وعندما يمثل البديل χ مجموعة الكيل، فإنها قد تكون مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، وتشمل أمثلتها المجاميع المذكورة أمثلتها بالنسبة لـ R^{1a} و R^{2a} .

وعندما يمثل البديل χ مجموعة الكوكسي، فإنها قد تكون مجموعة الكوكسي مستقيمة ١٠ السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، وتشمل أمثلتها مجاميع الميثوكسي والاثوكسي والبروبوكسي والايزوبروبوكسي والبيوتوكسي والايزوبيوتوكسي والبيوتوكسي والثلاثي، والأفضل من بينها مجموعة الميثوكسي. وعندما يمثل البديل χ ذرة هالوجين فإنها قد تكون، على سبيل المثال، ذرة فلور أو كلور أو بروم أو يود.

١٥ وعندما يمثل البديل χ مجموعة الكيل أمينو تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، فإنها قد تكون مجموعة مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة، مثل مجموعة الميثيل أمينو أو الاثيل أمينو أو البروبيل أمينو أو الايزوبروبيل أمينو أو البوتيل أمينو أو الايزوبوتيل أمينو أو البوتيل أمينو الثانوي أو البوتيل أمينو الثلاثي، ويفضل من بينها مجموعة الميثيل أمينو.

وعندما يمثل البديل χ مجموعة ثاني الكيل أمينو تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون ٢٠ في كل جزء الكيل، فإنها قد تكون مجاميع مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة مثل مجاميع الثاني ميثيل أمينو والثاني إيثيل أمينو والثاني بروبيل أمينو والثاني ايزوبروبيل أمينو والثاني بوتيل أمينو والثاني ايزوبوتيل أمينو والثاني بوتيل أمينو الثلاثي و N -ميثيل N -إيثيل أمينو و N -ميثيل N -بروبيل أمينو و N -ميثيل N -إيزوبروبيل أمينو و N -ميثيل N -بوتيل أمينو و N -ميثيل N -إيزوبوتيل أمينو و N -ميثيل N -بوتيل أمينو الثانوي و N -

مثيل-N-بوتيل امينو ثلاثي و-N-اثيل-N-بروبيل امينو و-N-اثيل-N-ايزوبروبيل امينو و-N-اثيل-N-بوتيل امينو و-N-اثيل-N-ايزوبوتيل امينو و-N-اثيل-N-بوتيل امينو ثانوي و-N-اثيل-N-بوتيل امينو ثلاثي و-N-بروبيل-N-ايزوبروبيل امينو و-N-بروبيل-N-بوتيل امينو ثانوي و-N-بروبيل-N-بوتيل امينو ثلاثي و-N-ايزوبروبيل-N-ايزوبروبيل-N-بوتيل امينو و-N-ايزوبروبيل-N-ايزوبوتيل امينو ثانوي و-N-ايزوبروبيل-N-بوتيل امينو ثلاثي و-N-ايزوبوتيل-N-بوتيل امينو ثانوي و-N-ايزوبوتيل-N-بوتيل امينو ثلاثي و-N-بوتيل ثنائي و-N-بوتيل امينو ثلاثي، ويفضل من بينها مجموعة ثاني مثيل امينو.

١٠. وعندما تمثل R^{4a} أو R^{5a} مجموعة الكوكسي، فإنها قد تكون مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٥ ذرات كربون، وتشمل أمثلتها مجاميع الميثوكسي والاثوكسي والبروبوكسي والايزوبروبوكسي والبيوتوكسي والايزوبيوتوكسي والبيوتوكسي الثانوي والبيوتوكسي الثلاثي والبنثيلوكسي، ويفضل منها مجاميع الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، والأفضل من بينها مجموعة الميثوكسي.

١٥. وعندما تمثل R^{4a} أو R^{5a} معاً مجموعة الكيلين ديوكسي، فإنها تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، وتشمل أمثلتها مجاميع المثيلين ديوكسي والاثيلين ديوكسي والبروبيلين ديوكسي وثالث مثيلين ديوكسي ورابع مثيلين ديوكسي، ويفضل منها مجموعتا المثيلين ديوكسي والاثيلين ديوكسي.

وتشمل الأمثلة المفضلة لمركبات الصيغة (١) مايلي :

٢. (٢) مركبات، حيث تمثل R^{1a} مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.
 (٣) مركبات، حيث تمثل R^{2a} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون.

(٤) مركبات، حيث تمثل R^{3a} ذرة هيدروجين أو مجموعة اسيل اليفاتية تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو مجموعة بنزويل أو نפטويل تخلو من البدائل أو مجموعة الكوكسي كربونيل تحتوي من ٢ إلى ٤ ذرات كربون.

(٥) مركبات، حيث تمثل R^{4a} مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.

٥ (٦) مركبات، حيث تمثل R^{5a} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون.

(٧) مركبات حيث :

تمثل R^{1a} مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.

وتمثل R^{2a} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون.

١٠ وتمثل R^{3a} ذرة هيدروجين أو مجموعة اسيل اليفاتية تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات

كربون أو مجموعة بنزويل أو نפטويل تخلو من البدائل أو مجموعة الكوكسي كربونيل تحتوي من ٢ إلى ٤ ذرات كربون.

وتمثل R^{4a} مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.

وتمثل R^{5a} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون.

١٥ (٨) مركبات، حيث تمثل R^{3a} ذرة هيدروجين أو مجموعة خليل أو مجموعة بنزويل أو مجموعة اثوكسي كربونيل.

(٩) مركبات، حيث :

تمثل R^{1a} مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.

وتمثل R^{2a} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون.

٢٠ وتمثل R^{3a} ذرة هيدروجين أو مجموعة بنزويل أو مجموعة اثوكسي كربونيل.

وتمثل R^{4a} مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.

وتمثل R^{5a} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون.

(١٠) مركبات، حيث تمثل فيها R^{1a} مجموعة مثيل.

(١١) مركبات، حيث تمثل R^{2a} ذرة هيدروجين أو مجموعة مثيل.

(١٢) مركبات، حيث تمثل R^{3a} ذرة هيدروجين أو مجموعة خليل أو مجموعة اثوكسي كربونيل.

(١٣) مركبات، حيث تمثل R^{4a} مجموعة مثيل أو بوتيل ثلاثي.

(١٤) مركبات، حيث تمثل R^{5a} ذرة هيدروجين أو مجموعة مثيل.

٥ (١٥) مركبات، حيث :

تمثل R^{1a} مجموعة مثيل.

وتمثل R^{2a} ذرة هيدروجين أو مجموعة مثيل.

وتمثل R^{3a} ذرة هيدروجين أو مجموعة خليل أو مجموعة اثوكسي كربونيل.

وتمثل R^{4a} مجموعة مثيل أو بوتيل ثلاثي.

١٠ وتمثل R^{5a} ذرة هيدروجين أو مجموعة مثيل.

(١٦) مركبات تختار من الآتي :

(أ) ٥-٤-٦-هيدروكسي-٨،٧،٥،٢-رابع مثيل كرومانيل (٢) مثوكسي) بنزيل]

ثيازوليدين-٤،٢-ديون (عقار تروجليتازون).

(ب) ٥-٤-٦-هيدروكسي-٢-٧-بوتيل ثالث كرومانيل (٢) مثوكسي) بنزيل]

١٥ ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

(ج) ٥-٤-٦-هيدروكسي-٢-٨،٧،٥-ثالث مثيل كرومانيل (٢) مثوكسي) بنزيل]

ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

(د) ٥-٤-٦-هيدروكسي-٢-ايزوبوتيل-٨،٧،٥-ثالث مثيل كرومانيل (٢) مثوكسي)

بنزيل]-ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

٢٠ (هـ) ٥-٤-٦-خليلوكسي-٨،٧،٥،٢-رابع مثيل كرومانيل (٢) مثوكسي) بنزيل]

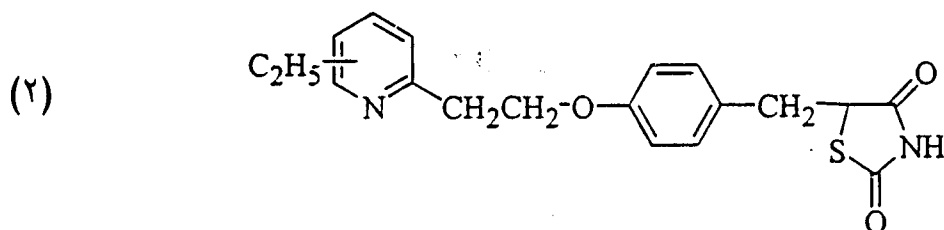
ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

(و) ٥-٤-٦-اثوكسي كربونيلوكسي-٨،٧،٥،٢-رابع مثيل كرومانيل (٢) مثوكسي)

بنزيل]-ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

ثانياً : يصف طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم شو ٦١-٢٦٧٥٨٠ (نشرة البراءات اليابانية رقم هيه ٥-٦٦٩٥٦) والبراءة الامريكية رقم ٧٧٧ ٦٨٧ ٤ ما يلي :

(١) مشتقات ثيازوليدين بالصيغة (٢) التالية :



٥ و املاحها المقبولة صيدليا.

وبالنسبة لمركبات الصيغة (٢)، فقد وصفت التفاصيل مثل أنواع الملح المقبول صيدلياً وعملية التحضير وامثلة على المركبات وامثلة على التحضير، في طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم شو ٦١-٢٦٧٥٨٠ (نشرة البراءات اليابانية رقم هيه ٥-٦٦٩٥٦) والبراءة الامريكية رقم ٦٨٧ ٧٧٧ ٤ والتي ادمجت محتوياتها في هذا البيان للرجوع اليها.

١٠. وتشمل الامثلة المفضلة لمركبات الصيغة (٢) ما يلي :

(٢) مركبات تختار من الآتي :

(۱) ۵-۴-۲-۳-ایٹیل (۲-بیریڈیل) اٹوکسی [بنزیل} نیا زوالیدین-۲، ۴-دیون.

(ب) ۵-۴-۲-۴-ایٹیل-۲-بیریڈیل) اٹوکسی] بنزیل { نیا زولیدین-۲، ۴-دیون.

(ج) ۵-۴-۲-۵-اٹیل-۲-بیریڈیل) اٹوکسی] بنزیل {ٹيازوليدين-۲،۴-ديون (والذي يدعى

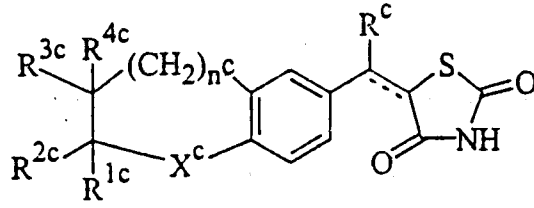
١٥ لاحقاً في هذا البيان عقار "بيوجلينازون".

(د) ۵- [۴- [۲- [۶- ائیل- ۲- بیریدیل) ائوکسی] (بزیل)؛ ائازولیدین- ۲، ۴- دیون.

ثالثا : يصف طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم شو ٦١-٢٧١٢٨٧ (نشرة البراءات اليابانية رقم هيه ٥-٨٦٩٥٣) والبراءة الامريكية رقم ٥٢ ٧٠٣ ٤ ما يلي :

(١) مركبات وفق الصيغة (٣) التالية :

(٣)

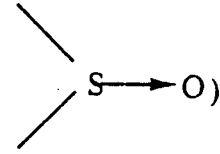


حيث :

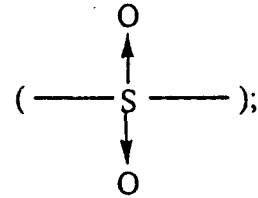
تمثل --- رابطة أحادية أو مزدوجة؛

وتمثل n^c صفر أو ١ أو ٢؛وتمثل X^c ذرة أكسجين أو كبريت أو مجموعة كبريتينيل

٥



أو مجموعة كبريتونيل

وتمثل R^c ذرة هيدروجين أو مجموعة ميثيل أو مجموعة اثيل؛وتمثل R^{1c} مجموعة الكيل حلقي تحتوي من ٥ إلى ٧ ذرات كربون، أو مجموعة الكيل

١٥

حلقي تحتوي من ٥ إلى ٧ ذرات كربون بها بديل من مجموعة ميثيل، أو مجموعة بيريديل، أو

مجموعة ثينيل أو مجموعة فوريل أو مجموعة نفطيل أو مجموعة ثاني فنييل أولي أو مجموعة

رابع هيدروفورانييل أو مجموعة رابع هيدروثينيل، أو مجموعة رابع هيدروبيرانييل، أو مجموعة

وفق الصيغة C₆H₄W^{2c} حيث :تمثل W^{2c} ذرة هيدروجين أو مجموعة هيدروكسي أو ذرة هالوجين (مثلا ذرة فلور

١٥

أو كلور أو بروم) أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو مجموعة الكوكسي

تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو مجموعة الكيل ثيو تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.

أو مجموعة وفق الصيغة $alk-W^{1C}$ ، حيث :

تمثل alk مجموعة الكيلين تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو مجموعة اثيليدين أو مجموعة ايزوبروبيليدين؛ وتمثل W^{1C} ذرة هيدروجين، أو مجموعة هيدروكسي، أو مجموعة الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكيل ثيو تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة بيريديل، أو مجموعة فوريل، أو مجموعة ثينيل، أو مجموعة رابع هيدروفوريل، أو مجموعة رابع هيدروثينيل، أو مجموعة نفطيل، أو مجموعة الكيل حلقي تحتوي من ٥ إلى ٧ ذرات كربون، أو مجموعة وفق الصيغة $C_6H_4W^{2C}$ حيث تكون W^{2C} كما تم تعريفها في أعلاه؛

وتمثل R^{2C} ذرة هيدروجين أو مجموعة ثيل؛

١٠. وتمثل R^{3C} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون أو مجموعة وفق الصيغة $C_6H_4W^{2C}$ حيث تكون W^{2C} كما تم تعريفها في أعلاه، أو مجموعة بنزيل؛

وتمثل R^{4C} ذرة هيدروجين؛

أو تشكل R^{1C} و R^{2C} معاً مجموعة الكيلين تحتوي من ٤ إلى ٦ ذرات كربون؛

١٥. ويمثل كل من R^{3C} و R^{4C} ذرة هيدروجين؛

أو تشكل R^{3C} و R^{4C} معاً مجموعة الكيلين تحتوي من ٤ إلى ٦ ذرات كربون، ويمثل

كل من R^{1C} و R^{2C} ذرة هيدروجين؛

أو تشكل R^{2C} و R^{3C} معاً مجموعة الكيلين تحتوي من ٣ إلى ٤ ذرات كربون، ويمثل

كل من R^{1C} و R^{4C} ذرة هيدروجين؛

٢٠. وأملاحها المقبولة صيدلياً.

وبالنسبة لمركبات الصيغة (٣)، فقد وصفت التفاصيل مثل تعاريف R^{1C} و R^{2C} و R^{3C} و

W^{1C} و W^{2C} و alk ، وأنواع الملح المقبول صيدلياً وعملية تحضير مركبات الصيغة (٣) وأمثلة

على التحضير، في طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم شو ٦١-٢٧١٢٨٧ (نشرة البراءات

اليابانية رقم هيه ٥-٨٦٩٥٣) وفي البراءة الامريكية رقم ٥٢ ٧٠٣ ٤، والتي ادمجت محتوياتها في هذا البيان للرجوع اليها.

وعندما تمثل R^{1C} أو W^{1C} مجموعة الكيل حلقية، مثلا، فانها قد تكون مجموعة بنتيل حلقية أو هكسيل حلقية أو هبتيل حلقية.

٥. وعندما تمثل W^{2C} مجموعة الكيل أو مجموعة الكوكسي أو تمثل W^{1C} مجموعة

الكوكسي، فانها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج امثلتها في أعلاه بالنسبة للبديل χ .

وعندما تمثل W^{1C} أو W^{2C} مجموعة الكيل ثيو، فانها قد تكون مجموعة الكيل ثيو

مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، وتشمل امثلتها

مجاميع المثلث ثيو والاثيل ثيو والبروبيل ثيو والايذوبروبيل ثيو والبوتيل ثيو والايذوبوتيل ثيو

١. والبوتيل ثيو الثانوي والبوتيل ثيو الثلاثي، والأفضل، من بينها مجموعة المثلث ثيو.

وعندما تمثل alk مجموعة الكيلين تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، فانها قد تكون

مجموعة مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، وتشمل

امثلتها مجاميع المثلثين والمثلث مثلين والاثيلين والاثيليدين والبروبيلين والايذوبروبيليدين

والبروبيليدين وثالث مثلين ورابع مثلين و١-مثلث ثالث مثلين و٢-مثلث ثالث

١٥ مثلين و٣-مثلث ثالث مثلين وبنتامثيلين وهكسامثيلين و١،١-ثاني مثلث ثالث مثلين

و٢،٢-ثاني مثلث ثالث مثلين و١،١-ثاني مثلث رابع مثلين و٢،٢-ثاني مثلث رابع مثلين،

ويفضل منها مجاميع الالكيلين مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة التي تحتوي من ١ إلى ٤

ذرات كربون، والأفضل من بينها مجموعة المثلثين أو الاثيلين.

وعندما تمثل R^{3C} مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، فانها قد تكون

٢. مجموعة مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، ويفضل

من ١ إلى ٤ ذرات كربون، وتشمل امثلتها مجاميع المثلث والاثيل والبروبيل والايذوبروبيل

والبوتيل والايذوبوتيل والبوتيل الثانوي والبوتيل الثلاثي والبنتيل والايذوبنتيل والنيوبنتيل

و٢-مثلث بوتيل و١-اثيل بروبييل والهكسيل و٤-مثلث بنتيل و٣-مثلث بنتيل و٢-مثلث بنتيل

و١-مثلث بنتيل و٣،٣-ثاني مثلث بوتيل و٢،٢-ثاني مثلث بوتيل و١،١-ثاني مثلث بوتيل

و ٢،١-ثاني مثيل بوتيل و ٣،١-ثاني مثيل بوتيل و ٣،٢-ثاني مثيل بوتيل و ٢-اثيل بوتيل. وتفضل منها مجاميع الالكيل التي تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، وعلى الأخص مجاميع المثيل والاثيل والبروبيل والايزوبروبيل والبوتيل والايزوبوتيل، والأفضل على الإطلاق منها مجموعة المثيل.

٥. وعندما تمثل R^{1C} مع R^{2C} أو تمثل R^{2C} مع R^{3C} أو تمثل R^{3C} مع R^{4C} مجموعة الكيلين تحتوي من ٤ إلى ٦ ذرات كربون، فانها قد تكون مجموعة مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة، وتشمل امثلتها مجاميع رابع مثيلين و ١-مثيل ثالث مثيلين و ٢-مثيل ثالث مثيلين و ٣-مثيل ثالث مثيلين و بنتا مثيلين وهكسا مثيلين و ١،١-ثاني مثيل ثالث مثيلين و ٢،٢-ثاني مثيل ثالث مثيلين و ١،١-ثاني مثيل رابع مثيلين و ٢،٢-ثاني مثيل رابع مثيلين.

١٠. وعندما تمثل W^{1C} أو W^{2C} مجموعة الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو عندما تمثل W^{2C} ذرة هالوجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، فانها قد تكون كما ذكرت امثلتها في أعلاه بالنسبة للبديل χ .

وتشمل الامثلة المفضلة لمركبات الصيغة (٣) ما يلي :

(٢) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل R^C ذرة هيدروجين، وتمثل --- ١٥ رابطة أحادية، وتمثل n^e صفرا أو ١.

(٣) المركب الموصوف في (٢)، حيث تمثل كل من R^{2C} و R^{3C} و R^{4C} ذرات هيدروجين، وتمثل R^{1C} ذرة هيدروجين أو مجموعة هكسيل حلقي أو مجموعة وفق الصيغة $C_6H_4W^{2C}$ (حيث تمثل W^{2C} ذرة هيدروجين أو ذرة فلور أو ذرة كلور أو ذرة بروم أو مجموعة مثيل أو مجموعة ميثوكسي) أو مجموعة وفق الصيغة $alk-W^{1C}$ (حيث تمثل alk مجموعة الكيلين تحتوي من ١ إلى ٢٠ ذرات كربون أو مجموعة اثيليدين أو مجموعة ايزوبروبيليدين، وتمثل W^{1C} ذرة هيدروجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو مجموعة هكسيل حلقي أو مجموعة وفق الصيغة $C_6H_4W^{2C}$ حيث تكون W^{2C} كما تم تعريفها في أعلاه).

(٤) المركب الموصوف في (٣)، حيث تمثل X^e ذرة اكسجين وتمثل R^{1C} مجموعة هكسيل حلقي أو مجموعة هكسيل حلقي مثيل أو مجموعة بنزيل أو مجموعة فلوروبنزيل أو مجموعة

الكيل تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو مجموعة هيدروكسي مثيل أو مجموعة ميثوكسي مثيل أو مجموعة اثوكسي اثيل.

(٥) المركب الموصوف في (٤)، حيث تمثل R^{1C} مجموعة بنزيل.

(٦) المركب الموصوف في (٥) والذي يكون ٥-[(٢-بنزيل-٣،٢-ثاني هيدروبنزوفورانييل

٥ ((٥) مثيل] ثيازوليدين-٤،٢-ديون أو ٥-[(٢-بنزيل-٤،٣-ثاني هيدرو- H_2 -بنزوبيرانيل

(٦) ((٦) مثيل] ثيازوليدين-٤،٢-ديون (عقار انجليتازون) أو ملح، ويفضل أن يكون ملح

الصوديوم الخاص بهما.

(٧) المركب الموصوف في (٢)، حيث تشكل R^{2C} و R^{3C} معا مجموعة رابع مثيلين وتمثل كل

من R^{1C} و R^{4C} ذرة هيدروجين وتمثل X^c ذرة اكسجين.

١٠ (٨) المركب الموصوف في (٢)، حيث :

أ- تشكل R^{1C} و R^{2C} معا مجموعة بنتامثيلين، ويمثل كل من R^{3C} و R^{4C} ذرة هيدروجين وتمثل

X^c ذرة الكسجين، أو

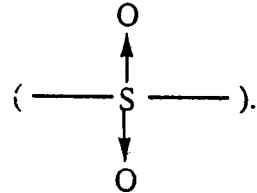
ب- تشكل R^{3C} و R^{4C} معا مجموعة بنتامثيلين، ويمثل كل من R^{1C} و R^{2C} ذرة هيدروجين

وتمثل X^c ذرة اكسجين.

١٥ (٩) المركب الموصوف في (٣)، حيث تمثل n^c صفرا وتمثل R^{1C}

ذرة هيدروجين أو

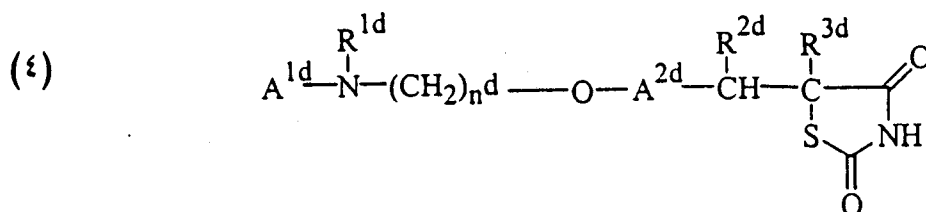
مجموعة مثيل أو مجموعة بنزيل وتمثل X^c ذرة كبريت أو مجموعة كبريتونيل.



رابعا : يصف طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ١-١٣١١٦٩ أو البراءات الامريكية

٢٠ أرقام ٩٥٣ ٠٠٢ ٥ أو ٤٤٣ ١٩٤ ٥ أو ٩٢٥ ٢٣٢ ٥ أو ٤٤٥ ٢٦٠ ٥ ما يلي :

(١) مركب وفق الصيغة (٤) التالية :



حيث :

- تمثل A^{1d} مجموعة عطرية حلقية مخططة بها بدائل أو تخلو من البدائل.
 وتمثل R^{1d} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل أو مجموعة اسيل أو مجموعة االكيل
 ٥ (ويمكن ان يحتوي شق الاريل في مجموعة الارالكيل المذكورة على بدائل أو يخلو من البدائل)
 أو مجموعة اريل بها بدائل أو تخلو من البدائل.
 ويمثل كل من R^{2d} و R^{3d} ذرة هيدروجين أو تشكلاان معا رابطة.
 وتمثل A^{2d} حلقة بنزين تحتوي على ما لا يزيد مجموعه عن ٥ بدائل.
 وتمثل n^d عددا صحيحا من ٢ إلى ٦؛

١٠ واملحها المقبولة صيدليا.

- وبالنسبة لمركبات الصيغة (٤)، فقد وصفت التفاصيل مثل تعاريف A^{1d} و R^{1d} و R^{2d} و R^{3d} و A^{2d} و n^d ، وانواع الملح المقبول صيدليا وعملية تحضير مركبات الصيغة (٤) وامثلة على التحضير والمركبات المفضلة، في طلب البراءة اليابانية كوكاي هيه ١-١٣١١٦٩ أو البراءات الامريكية ارقام ٠٠٢ ٩٥٣ ٥ أو ٤٤٣ ١٩٤ ٥ أو ٢٣٢ ٩٢٥ ٥ أو ٤٤٥ ٢٦٠ ٥
 ١٥ والتي ادمجت محتوياتها في هذا البيان للرجوع اليها.

- وعندما تمثل A^{1d} مجموعة عطرية حلقية مخططة بها بدائل أو تخلو من البدائل،
 مثلا، فانها قد تكون حلقة عطرية أحادية تحتوي من ٥ إلى ٧ ذرات حلقية، منها ١ إلى ٣ على شكل ذرات متباعدة تختار من المجموعة التي تشتمل على ذرات النيتروجين والاكسجين والكبريت، أو قد تكون على شكل نظام حلقي منصهر حيث تكون فيه حلقة واحدة على الاقل
 ٢٠ من الحلقات عبارة عن مجموعة عطرية حلقية مخططة، كما هي معرفة في أعلاه، وتكون الحلقة الاخرى أو كل حلقة اخرى على شكل مجموعة عطرية حلقية مخططة أو مجموعة

اريل كربوحلقي. وعندما توجد ٣ ذرات متباينة في المجموعة العطرية الحلقية المخططة، يفضل ان تكون كلها ذرات نيتروجين أو تكون ذرة واحدة أو ذرتان منها على شكل ذرة نيتروجين. وبالمقابل تكون ذرتان منها أو ذرة واحدة على شكل ذرة اكسجين و/أو ذرة كبريت. وتشمل امثلة مجاميع عطرية حلقية مخططة أحادية الحلقة من هذا القبيل مجاميع

٥ الفوريل والثينيل والبيروليل والازبينيل والبيرازوليل والايמידازوليل والاوكسازوليل والايروكسازوليل والثيازوليل والايروثيازوليل و ٣،٢،١-اوكسا ثاني زوليل وثالث زوليل ورابع زوليل وثيا ثاني زوليل والبيرانيل والبيريديل والبيريدازينيل والبيريميدينيل والبيرازينيل. وتكون المجاميع المفضلة عبارة عن مجاميع عطرية حلقية مخططة خماسية أعضاء تكوين الحلقة إلى سباعية أعضاء تكوين الحلقة تحتوي على ذرة نيتروجين واحدة على الأقل، ويجوز أن تحتوي على ذرة نيتروجين أو اكسجين أو كبريت اضافية واحدة. وتشمل امثلة مجاميع من هذا القبيل مجاميع البيروليل والازبينيل والبيرازوليل والايמידازوليل والاوكسازوليل والايروكسازوليل والثيازوليل والايروثيازوليل و ٣،٢،١-اوكسا ثاني زوليل وثالث زوليل ورابع زوليل وثيا ثاني زوليل والبيريديل والبيريدازينيل والبيريميدينيل والبيرازينيل. والمجاميع الأكثر تفضيلاً هي مجاميع البريديل والايמידازوليل والاوكسازوليل والبيرازينيل والثيازوليل.

١٥ ويمكن أن تشكل شتى المجاميع العطرية الحلقية المخططة المذكورة أعلاه حلقة مصهورة مع مجموعة حلقية أخرى. وتشمل امثلة أنظمة الحلقة المصهورة من هذا القبيل مجاميع الاندوليل والبنزوفوريل والبنزوئينيل والبنزوكسازوليل والبنزوإيميدازوليل والايروكوينوليل والكوينوليل والكوينوكسالييل.

وقد تخلو هذه المجاميع العطرية المخططة من البدائل أو قد يكون بها بديل واحد أو ٢. أكثر يختار من المجموعة التي تشتمل على بدائل π المذكورة أمثلتها في أدناه. ولا يوجد تحديد معين لعدد البدائل، باستثناء التحديد المفروض بعدد المواقع القابلة للاستبدال، وأحياناً التحديد المفروض بمحددات تجسمية. بيد ان المفضلاً، عموماً هو من ١ إلى ٣ بدائل، حيثما تكون المجموعة بها بدائل.

وتختار البدائل π من المجموعة التي تشتمل على الآتي :

- ذرات هالوجين مثل ذرات الفلور أو الكلور أو البروم أو اليود.
- مجاميع الكيل تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، مثل المجاميع المعرفة والمذكورة أمثلتها في أعلاه بالنسبة لـ R^{3c} .
- مجاميع هالوكيل تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون حيث تستبدل اية مجموعة من مجاميع الالكيل، كما تم تعريفها وإدراج أمثلتها في أعلاه بالنسبة لـ R^{3c} ، بذرة واحدة من ذرات الهالوجين المذكورة أعلاه أو أكثر من ذرة واحدة، مثلا مجاميع الفلورومثيل والكلورومثيل والبرومومثيل واليودومثيل وثالث فلورومثيل وثالث كلورومثيل و٢-فلورواثيل و٢-كلورواثيل و٢-برومواثيل و٢-يودواثيل و٢،٢،٢-ثالث فلورواسيل و٢،٢،٢-ثاني فلورواسيل و٢،٢،٢-ثالث كلورواثيل و٢،٢،٢-ثاني كلورواثيل و٢،٢-ثاني برومواثيل و٣-فلوروبروبيل و٤-كلوروبروبيل و٥-فلوروبروبيل و٦-فلوروهكسيل؛
- مجاميع الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون والتي قد تكون مجاميع مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، ويفضل من ١ إلى ٤ ذرات كربون، وتشمل أمثلتها مجاميع الميثوكسي والاثوكسي والبروبوكسي والايزوبروبوكسي والبيوتوكسي والايزوبيوتوكسي والبيوتوكسي الثانوي والبيوتوكسي الثلاثي والبنزيلوكسي والايزوبنزيلوكسي والنيوبنزيلوكسي و٢-مثيل بوتوكسي و١-اثيل بروبوكسي والهكسيلوكسي و٤-مثيل بنتيلوكسي و٣-مثيل بنتيلوكسي و٢-مثيل بنتيلوكسي و١-مثيل بنتيلوكسي و٣،٣-ثاني مثيل بوتوكسي و٢،٢-ثاني مثيل بوتوكسي و١،١-ثاني مثيل بوتوكسي و٢،١-ثاني مثيل بوتوكسي و٣،١-ثاني مثيل بوتوكسي و٣،٢-ثاني مثيل بوتوكسي و٢-اثيل بوتوكسي، ويفضل منها مجاميع الالكوكسي التي تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، وعلى الأخص مجاميع الميثوكسي والاثوكسي والبروبوكسي والايزوبروبوكسي والايزوبيوتوكسي، والأفضل من بينها مجموعة الميثوكسي؛
- مجاميع اسيل كربوكسيلية اليفاتية تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، مثل المجاميع التي تم تعريفها وإدراج أمثلتها في أدناه بالنسبة لـ R^{1d} ؛

- مجاميع الكان كبريتونيل تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون مثل مجاميع الميثان كبريتونيل والاثان كبريتونيل والبروبان كبريتونيل والايزوبروبان كبريتونيل والبوتان كبريتونيل والايزوبوتان كبريتونيل والبوتان كبريتونيل الثانوي والبيوتان كبريتونيل الثلاثي والبنتان كبريتونيل والايزوبنتان كبريتونيل والنيوبنتان كبريتونيل و٢-مثيل بوتان كبريتونيل و١-اثيل بروبان كبريتونيل وهكسان كبريتونيل و٤-مثيل بنتان كبريتونيل و٣-مثيل بنتان كبريتونيل و ٥ ٢-مثيل بنتان كبريتونيل و ١-مثيل بنتان كبريتونيل و٣،٣-ثاني مثيل بوتان كبريتونيل و٢،٢-ثاني مثيل بوتان كبريتونيل و ١،١-ثاني مثيل بوتان كبريتونيل و ٢،١-ثاني مثيل بوتان كبريتونيل و ٣،١-ثاني مثيل بوتان كبريتونيل و ٣،٢-ثاني مثيل بوتان كبريتونيل و ٢-اثيل بوتان كبريتونيل؛

١٠ - مجاميع هالوكان كبريتونيل تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون على سبيل المثال مجاميع الفلورميثان كبريتونيل والكلوروميثان كبريتونيل والبروموميثان كبريتونيل واليودوميثان كبريتونيل وثالث فلوروميثان كبريتونيل وثالث كلوروميثان كبريتونيل و٢-فلوروايثان كبريتونيل و٢-كلوروايثان كبريتونيل و٢-بروموايثان كبريتونيل و٢-يودوايثان كبريتونيل و٢،٢،٢-ثالث فلوروايثان كبريتونيل و٢،٢-ثاني فلوروايثان كبريتونيل و٢،٢،٢-ثالث كلوروايثان كبريتونيل و٢،٢-ثاني كلوروايثان كبريتونيل و٢،٢-ثاني بروموايثان كبريتونيل و٣-فلوروبروبان كبريتونيل و٤-كلوروبوتان كبريتونيل و٥-فلوروبنتان كبريتونيل و٦-فلوروهكسان كبريتونيل؛

- مجاميع هيدروكسي ومجاميع كربوكسي؛

- مجاميع الكوكسي كربونيل تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون في جزء الالكوكسي، مثل ٢٠ مجاميع الميثوكسي كربونيل والاثوكسي كربونيل والبروبوكسي كربونيل والايزوبروبوكسي كربونيل والبيوتوكسي كربونيل والايزوبيوتوكسي كربونيل والبيوتوكسي الثلاثي والنيوبيوتوكسي كربونيل و٢-مثيل بوتوكسي كربونيل و ١-اثيل بروبوكسي كربونيل والهكسيلوكسي كربونيل و ٤-مثيل بنتيلوكسي كربونيل و ٣-مثيل بنتيلوكسي كربونيل و ٢-مثيل

بنتيلوكسي كربونيل و ١-مثيل بنتيلوكسي كربونيل و ٣،٣-ثاني مثيل بوتوكسي كربونيل و ٢،٢-ثاني مثيل بوتوكسي كربونيل و ١،١-ثاني مثيل بوتوكسي كربونيل و ٢،١-ثاني مثيل بوتوكسي كربونيل و ٣،١-ثاني مثيل بوتوكسي كربونيل و ٣،٢-ثاني مثيل بوتوكسي كربونيل و ٢ إلى ٥ ذرات كربون، وعلى الاخص مجاميع المثوكسي كربونيل والاثوكسي كربونيل والبروبوكسي كربونيل والايزوبروبوكسي كربونيل والبوتوكسي كربونيل والايزوبوتوكسي كربونيل، والأفضل منها مجموعة المثوكسي كربونيل؛

٥ - مجاميع اسيل امينو تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، حيث يمكن ان يكون جزء الاسيل فيها أي من مجاميع الاسيل الحاوية من ١ إلى ٦ ذرات كربون المدرجة في المجاميع الممثلة

١٠. بـ R^{1d} ؛

- مجاميع الكان كبريتونيل امينو تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، حيث يمكن ان يكون جزء الالكان كبريتونيل فيها أي من مجاميع الالكان كبريتونيل المذكورة امثلتها أعلاه؛

- مجاميع هالوالكان كبريتونيل امينو تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، حيث يمكن ان يكون جزء الهالوالكان كبريتونيل فيها أي من مجاميع الهالوالكان كبريتونيل المذكورة امثلتها أعلاه؛

١٥ - مجاميع امينو ومجاميع سيانو؛

- مجاميع الكيلين ديوكسي مثل تلك المجاميع المعرفة والمذكورة امثلتها أعلاه بالنسبة لـ R^{4a} ؛

- مجاميع الكيلين تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون (لتشكيل مجموعة الكيل حلقي مصهورة مع حلقة الاريل أو الحلقة المخلطة) والتي يمكن ان تكون أي من مجاميع الالكيلين المعرفة والمذكورة امثلتها أعلاه بالنسبة لـ alk ، ومجاميع ذات وزن جزيئي أعلى، مثل مجاميع

٢٠. الهكسامثيلين والاوكتامثيلين.

وعندما تمثل R^{1d} مجموعة الكيل، فانها يفضل ان تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، ويمكن ان تكون أي من تلك المجاميع المعرفة والمذكورة امثلتها أعلاه بالنسبة لـ R^{3C} .

وعندما تمثل R^{1d} أي مجموعة اسيل، فانها قد تكون، على سبيل المثال، ما يلي :

- مجموعة اسيل اليفاتية، ويفضل مجموعة الكانويل تحتوي من ١ إلى ٢٥ ذرة كربون، والأفضل من ١ إلى ٢٠ ذرة كربون، والاكثر تفضيلاً من ١ إلى ٦ ذرات كربون، والأفضل على الإطلاق من ١ إلى ٤ ذرات كربون، (مثل مجاميع الفورميل والخلييل والنيروبونيل والبوتيريل والايروبوتيريل والبيفالويل والفالريل والايروفالريل والهكسانويل والهيبتانويل والاوكتانويل واللاورويل والميريستويل وثالث ديكانويل والبالميثيل والسيتارويل، ويفضل منها ٥ مجموعة الخلييل)؛ أو مجموعة الكانويل مهجنة تحتوي من ٢ إلى ٦ ذرات كربون، وعلى الاخص مجموعة خلييل مهجنة (مثل مجاميع الكلوروكسيل وثاني كلوروكسيل وثالث كلوروكسيل وثالث فلوروكسيل)؛ أو مجموعة الكوكسي الكانويل منخفضة الوزن الجزيئي حيث يحتوي جزء الالكوكسي فيها من ١ إلى ٥ ذرات كربون، ويفضل من ١ إلى ٣ ذرات ١٠ كربون ويحتوي جزء الالكانويل فيها من ٢ إلى ٦ ذرات كربون ويفضل ان يكون مجموعة خلييل (مثل مجموعة الميثوكسي خلييل)؛ أو نظير غير مشبع لمجموعة من هذا القبيل، وعلى الاخص مجموعة الالكانويل أو الالكينويل الحاوية من ٣ إلى ٦ ذرات كربون [مثل مجاميع الاكريلويل والمثاكريلويل والبروبيلويل والكروتونويل والايروكروتونويل و (E)-٢-مثيل-٢-بوتانويل]؛

١٥ - مجموعة اسيل عطرية، ويفضل مجموعة اريل كربونيل حيث يحتوي جزء الاريل فيها من ٦ إلى ١٤ ذرة كربون حلقية، والأفضل من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون حلقية، والاكثر تفضيلاً ٦ أو ١٠ ذرات كربون حلقية، والأفضل على الإطلاق ٦ ذرات كربون حلقية وتكون عبارة عن مجموعة كربون حلقية تخلو من البدائل أو تحتوي من ١ إلى ٥ بدائل، ويفضل من ١ إلى ٣ بدائل، تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل π ، المعرفة أعلاه، ويفضل : مجموعة ٢٠ تخلو من البدائل (مثل مجاميع البنزويل و α -نפטويل و β -نפטويل)؛ أو مجموعة اريل كربونيل مهجنة (مثل مجاميع ٢-بروموبنزويل و ٤-كلوروبنزويل)؛ أو مجموعة اريل كربونيل بها بديل من الكيل منخفض الوزن الجزيئي، حيث يحتوي فيها بديل الالكيل أو كل بديل الكيل من ١ إلى ٥ ذرات كربون، ويفضل من ١ إلى ٤ ذرات كربون (مثل مجموعات ٢، ٤، ٦-ثالث مثيل بنزويل و ٤-تولويل)؛ أو مجموعة اريل كربونيل بها بديل من الكوكسي منخفض الوزن

- الجزئي، حيث يفضل ان يحتوي فيها بديل الالكوكسي أو كل بديل الكوكسي من ١ إلى ٥ ذرات كربون، ويفضل من ١ إلى ٤ ذرات كربون (مثل مجموعة ٤-انيسويل)؛ أو مجموعة اريل كربونيل بها بديل نيترو (مثل مجاميع ٤-نيتروبنزويل و ٢-نيتروبنزويل)؛ أو مجموعة اريل كربونيل بها بديل من الكوكسي كربونيل منخفض الوزن الجزيئي، حيث يفضل ان يحتوي فيها بديل الالكوكسي كربونيل أو كل بديل الكوكسي كربونيل من ٢ إلى ٦ ذرات كربون [مثل مجموعة ٢- (مثنوكسي كربونيل) بنزويل]؛ أو مجموعة اريل كربونيل بها بديل من اريل، حيث يكون بديل الاريل فيها كما هو معرف في أعلاه باستثناء عدم استبدال نفس مجموعة الاريل هذه بمجموعة اريل (مثل مجموعة ٤-فينيل بنزويل) اذا وجد بديل من مجموعة اريل اخرى.
- مجموعة الكوكسي كربونيل، وعلى الاخص المجاميع التي تحتوي من ٢ إلى ٧ ذرات ١٠ كربون، والأفضل من ٢ إلى ٥ ذرات كربون والتي قد تخلو من البدائل (مثل مجاميع المثنوكسي كربونيل والاثوكسي كربونيل والبوتوكسي كربونيل الثلاثي والايروبوتوكسي كربونيل) أو بها بديل من ذرة هالوجين أو مجموعة سيليل بها ثلاثة بدائل، مثلاً مجموعة ثلاث (الكيل سيليل) منخفضة الوزن الجزيئي (مثل مجاميع ٢،٢،٢-ثالث كلورواثوكسي كربونيل و ٢-ثالث مثيل سيليل اثوكسي كربونيل)؛
- ١٥ - مجموعة الكنييلوكسي كربونيل حيث يحتوي جزء الالكيل فيها من ٢ إلى ٦ ذرات كربون ويفضل من ٢ إلى ٤ ذرات كربون (مثل مجاميع الفينيلوكسي كربونيل والاليلوكسي كربونيل)؛
- مجموعة اركيلوكسي كربونيل، حيث يكون جزء الارالكيل فيها كما تم تعريفه وإدراج امثلته فيما يلي، والذي يفضل فيه ان تحتوي حلقة الاريل، اذا كانت بها بدائل، على بديل واحد أو بديلين من الكوكسي أو نيترو منخفض الوزن الجزيئي (مثل مجاميع البنزيلوكسي كربونيل و ٢٠ و ٤-مثنوكسي بنزيلوكسي كربونيل و ٣،٤-ثاني مثنوكسي كربونيل و ٢-نيتروبنزيلوكسي كربونيل و ٤-نيتروبنزيلوكسي كربونيل).

وعندما تمثل R^{1d} مجموعة اركيل، يفضل ان تكون على شكل مجموعة يحتوي شق الكيل فيها من ١ إلى ٦ ذرات كربون به بديل من مجموعة اريل واحدة على الاقل، ويفضل من ١ إلى ٣ مجاميع اريل والتي نفسها يمكن ان يكون بها بديل واحد أو اكثر، ويفضل من ١

إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل π المعرفة أعلاه. وتشمل الامثلة المفضلة لمجاميع الأريل الكيل مجاميع الكيل تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، والأكثر تفضيلاً من ١ إلى ٣ ذرات كربون، والأفضل على الإطلاق ذرة كربون واحدة أو ذرتين والتي تحتوي من ١ إلى ٣ مجاميع أريل، والتي قد تخلو من البدائل (مثل مجاميع البنزيل والفنيل و١-فنيل ٥ إيثيل و٣-فنيل بروبييل و α -نفطيل مثيل و β -نفطيل مثيل، وثاني فنيل مثيل وثالث فنيل مثيل و α -نفطيل ثاني فنيل مثيل و٩-انثريل مثيل) أو بها على جزء الأريل بدائل من مجموعة الكيل منخفض الوزن الجزيئي أو مجموعة الكوكسي منخفض الوزن الجزيئي أو مجموعة نيتر أو ذرة هالوجين أو مجموعة سيانو أو مجموعة كيلين ديوكسي تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون، ويفضل مجموعة مثيلين ديوكسي [مثل مجموعة ٤-مثيل بنزيل ١٠ و٢، ٤، ٦-ثالث مثيل بنزيل و٣، ٤، ٥-ثالث مثيل بنزيل و٤-مثوكسي بنزيل و٤-مثوكسي فنيل ثاني فنيل مثيل و٢-نيتروبنزيل و٤-نيتروبنزيل و٤-كلوروبنزيل و٤-بروموبنزيل و٤-سيانوبنزيل و٤-سيانوبنزيل ثاني فنيل مثيل وثنائي(٢-نيتروفنيل) مثيل وبيرونيل].

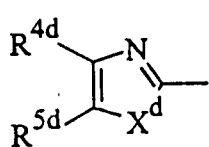
وعندما تمثل R^{1d} مجموعة أريل بها بدائل أو تخلو من البدائل فإنها تكون مجموعة ١٥ أريل كربو حلقية تحتوي من ٦ إلى ١٤ ذرة كربون حلقية، والأفضل من ٦ إلى ١٠ ذرة كربون حلقية، والأفضل على الإطلاق ٦ أو ١٠ ذرات كربون حلقية. وقد تحتوي المجموعة على حلقة عطرية أحادية أو قد تحتوي على حلقتين عطريتين مصهورتين أو أكثر. وقد تخلو المجموعة من البدائل أو يكون بها بديل واحد أو أكثر يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل π المعرفة أعلاه. ولا يوجد تحديد معين لعدد البدائل باستثناء التحديد المفروض بعدد ٢٠ المواقع القابلة للاستبدال، والمفروض أحياناً بمحددات تجسمية. بيد أن المفضل عموماً هو من ١ إلى ٣ بدائل، حيثما تكون المجموعة بها بدائل. وتشمل أمثلة المجاميع التي تخلو من البدائل مجاميع الفنيل و١-نفطيل و٢-نفطيل والاندنيل والفنانثرنيل والانثراسنيل، ويفضل من بينها مجاميع الفنيل والنفطيل، والأكثر تفضيلاً مجموعة الفنيل.

وتشمل امثلة المجاميع التي بها بدائل مجاميع ٢-مئوكسي فنييل و٣-مئوكسي فنييل
٤-مئوكسي فنييل و٤،٢-ثاني مئوكسي فنييل و٣،٢-ثاني مئوكسي فنييل و٥،٢-ثاني مئوكسي
فنييل و٤،٣-ثاني مئوكسي فنييل و٥،٣-ثاني مئوكسي فنييل و٦،٢-ثاني مئوكسي فنييل
و٥،٤،٣-ثالث مئوكسي فنييل و٥،٤،٢-ثالث مئوكسي فنييل و٤،٣،٢-ثالث مئوكسي فنييل
و٥،٣،٢-ثالث مئوكسي فنييل و٦،٣،٢-ثالث مئوكسي فنييل و٦،٤،٢-ثالث مئوكسي فنييل
و٢-اثوكسي فنييل و٣-اثوكسي فنييل و٤-اثوكسي فنييل و٢-
ايزوبروبوكسي فنييل و٣-ايزوبروبوكسي فنييل و٤-ايزوبروبوكسي فنييل و٢-
مئيل فنييل و٣-مئيل فنييل و٤-مئيل فنييل و٤،٢-ثاني مئيل فنييل و٣،٢-ثاني مئيل فنييل و٥،٢-
ثاني مئيل فنييل و٤،٣-ثاني مئيل فنييل و٥،٣-ثاني مئيل فنييل و٦،٢-ثاني مئيل فنييل و٥،٤،٣-
١. ثالث مئيل فنييل و٥،٤،٢-ثالث مئيل فنييل و٤،٣،٢-ثالث مئيل فنييل و٥،٣،٢-ثالث مئيل فنييل
و٦،٣،٢-ثالث مئيل فنييل و٦،٤،٢-ثالث مئيل فنييل و٢-كلوروفنييل و٣-كلوروفنييل و٤-
كلوروفنييل و٤،٢-ثاني كلوروفنييل و٣،٢-ثاني كلوروفنييل و٥،٢-ثاني كلوروفنييل و٤،٣-ثاني
كلوروفنييل و٥،٣-ثاني كلوروفنييل و٦،٢-ثاني كلوروفنييل و٥،٤،٣-ثالث كلوروفنييل
و٥،٤،٢-ثالث كلوروفنييل و٤،٣،٢-ثالث كلوروفنييل و٥،٣،٢-ثالث كلوروفنييل
١. و٦،٣،٢-ثالث كلوروفنييل و٦،٤،٢-ثالث كلوروفنييل و٢-فلوروفنييل و٣-فلوروفنييل و٤-
فلوروفنييل و٤،٢-ثاني فلوروفنييل و٣،٢-ثاني فلوروفنييل و٤،٣-ثاني فلوروفنييل و٥،٣-ثاني
فلوروفنييل و٦،٢-ثاني فلوروفنييل و٥،٤،٣-ثالث فلوروفنييل و٥،٤،٢-ثالث فلوروفنييل و٢-
ثالث فلورومئيل فنييل و٣-ثالث فلورومئيل فنييل و٤-ثالث فلورومئيل فنييل و٤،٢-ثنائي (ثالث
فلورومئيل) فنييل و٣،٢-ثنائي (ثالث فلورومئيل) فنييل و٤،٣-ثنائي (ثالث فلورومئيل) فنييل
٢. و٥،٣-ثنائي (ثالث فلورومئيل) فنييل و٦،٢-ثنائي (ثالث فلورومئيل) فنييل و٥،٤،٣-ثلاثي
(ثالث فلورومئيل) فنييل و٥،٤،٢-ثلاثي (ثالث فلورومئيل) فنييل و٢-خلايميدوفنييل و٣-
خلايميدوفنييل و٤-خلايميدوفنييل و٢-مئوكسي كربونيل فنييل و٣-مئوكسي كربونيل فنييل و٤-
مئوكسي كربونيل فنييل.

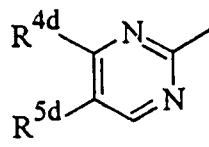
وعندما تمثل A^{2d} حلقة بنزين تحتوي على ما لا يزيد عن ٥ بدائل، فإن هذه البدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل π المعرفة أعلاه. وتشمل الامثلة المفضلة لمركبات الصيغة (٤) ما يلي :

(٢) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل A^{1d} مجموعة عطرية حلقية مخططة ذات ٥ حلقة أحادية أو حلقة مصهورة بها بدائل أو تخلو من البدائل تحتوي على ٤ ذرات متباينة أو أقل تختار من ذرات الاكسجين والكبريت والنيتروجين.

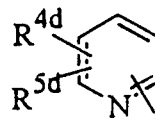
(٣) المركبات الموصوفة في (١) أو (٢)، حيث تمثل A^{1d} مجموعة وفق الصيغة (ا) أو (ب) أو (ج) التالية :



(a)



(b)

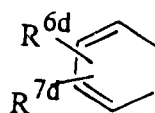


(c)

١٠ حيث تمثل كل من R^{4d} و R^{5d} بشكل مستقل ذرة هيدروجين أو مجموعة اريل بها بدائل أو تخلو من البدائل؛ أو تشكل R^{4d} و R^{5d} مع ذرات الكربون المتصلة بها حلقة بنزينوقد تحتوي كل ذرة من ذرات الكربون في حلقة البنزين على بدائل أو تخلو من البدائل؛ وفي المجموعة الممثلة بالصيغة (ا) تمثل X^d ذرة اكسجين أو كبريت.

(٤) المركبات الموصوفة في (٣) حيث تمثل كل من R^{4d} و R^{5d} بشكل مستقل ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل أو مجموعة فنيل بها بدائل أو تخلو من البدائل.

١٥ (٥) المركبات الموصوفة في (٣) حيث تشكل R^{4d} و R^{5d} مع مجموعة وفق الصيغة (د) التالية :

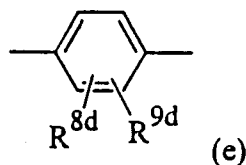


(d)

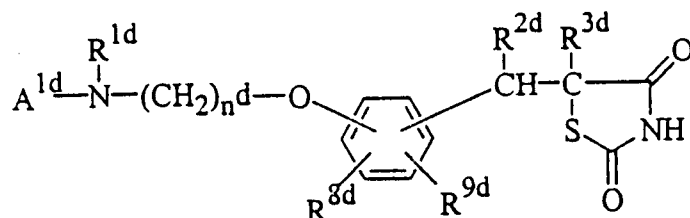
حيث تمثل كل من R^{6d} و R^{7d} بشكل مستقل ذرة هيدروجين أو ذرة هالوجين أو مجموعة الكيل بها بدائل أو تخلو من البدائل أو مجموعة الكوكسي.

٢٠

- (٦) المركبات الموصوفة في (٥) حيث يمثل كل من R^{6d} و R^{7d} ذرة هيدروجين.
- (٧) المركبات الموصوفة في أي فقرة من الفقرات (١) إلى (٦) حيث تمثل A^{2d} مجموعة وفق الصيغة (هـ) التالية :



- ٥ حيث تمثل كل من R^{8d} و R^{9d} بشكل مستقل ذرة هيدروجين أو ذرة هالوجين أو مجموعة الكيل بها بدائل أو تخلو من البدائل أو مجموعة الكوكسي.
- (٨) المركبات الموصوفة في (٧) حيث تمثل كل من R^{8d} و R^{9d} بشكل مستقل ذرة هيدروجين.
- (٩) المركبات الموصوفة في (١) وفق الصيغة (و) التالية :



- [حيث تكون A^{1d} و R^{1d} و R^{2d} و R^{3d} و n^d كما تم تعريفها في الصيغة (٤) للفقرة (١) وتكون R^{8d} و R^{9d} كما هي معرفة في الصيغة (هـ) للفقرة (٧)]، وأملحها المقبولة صيدليا.
- (١٠) المركبات الموصوفة في أية فقرة من الفقرات (١) إلى (٩)، حيث تمثل n^d عددا صحيحا يساوي ٢ أو ٣.
- ١٥ (١١) المركبات الموصوفة في أية فقرة من الفقرات (١) إلى (١٠)، حيث تمثل R^{1d} مجموعة مثيل.
- (١٢) المركبات الموصوفة في (١) والتي تختار من الاتي :
- (أ) ٥-(٤-٢)-N-مثيل-N-(٢-بنزو ثيازوليل) امينو [اثوكسي] بنزيل) ثيازوليدين-٢،٤-ديون.

(ب) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٢-بيريميدينيل (امينو) ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

(ج) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٢-٥،٤-ثنائي مئيل ثيازوليل ((٢)) امينو [ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين ٤،٢-ديون.

٥ (د) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٢-٥،٤-ثنائي مئيل ثيازوليل (٢) امينو [ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
(هـ) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٢-٤-فنييل ثيازوليل ((٢)) امينو [ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

(و) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٢-٤-فنييل-٥-مئيل ثيازوليل ((٢)) امينو [ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

١٠ (ز) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٢-٤-٥-فنييل ثيازوليل ((٢)) امينو [ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

(ح) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٢-٥-فنييلوكسازوليل ((٢)) امينو [ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

(ط) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٢-٥،٤-ثاني مئيلوكسازوليل ((٢)) امينو [ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

(ي) ٥-٤-٢-N-٢-بيريميدينيل (امينو) ائوكسي [بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
(ك) ٥-٤-٢-N-٢-٤-خليل-N-٢-بيريميدينيل امينو ((٢)) ائوكسي [بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

(ل) ٥-٤-٢-N-٢-٤-بنزوثيريازوليل (٢)-N-بنزيل امينو [ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

(م) ٥-٤-٢-N-٣-٤-مئيل-N-٢-٤-بنزوكسازوليل امينو ((٢)) بروبوكسي [بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

(م) ٥-٤-٢-N-٢-٤-٢-٤-مئيل-N-٢-٤-بيريديل امينو ((٢)) ائوكسي [بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون
(والذي يدعى لاحقا في هذا البيان عقار "روسيجليتازون").

(١٣) المركب الموصوف في (١) حيث يكون ٥-{-٤-٢-N-مئيل-N-بيريدل امينو-} (٢)

اوكسي] بنزيل} ثيازوليدين-٢،٤-ديون (عقار "روسيجليتازون").

وبالنسبة للفقرات (٢) إلى (١١) فقد تم وصف تفاصيل مثل تعريف R^{4d} و R^{5d} و R^{6d}

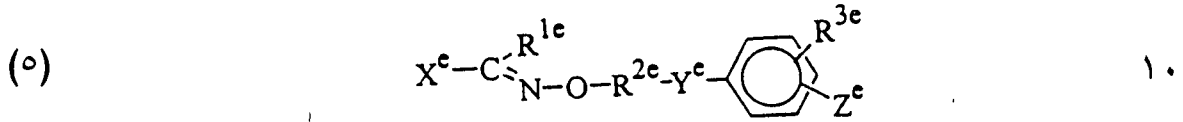
و R^{7d} و R^{8d} و R^{9d} ، في طلب البراءة اليابانية كوكاي هيه رقم ١-١٣١١٦٩ أو البراءات
٥ الامريكية ارقام ٩٥٣ ٠٠٢ ٥ أو ٤٤٣ ٤٤٤ ١٩٤ ٥ أو ٩٢٥ ٢٣٢ ٥ أو ٤٤٥ ٢٦٠ ٥ والتي

ادمجت محتوياتها في هذا البيان للرجوع اليها.

خامسا : يصف طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ٩-٤٨٧٧٩ ونشرة البراءات الاوروبية

رقم ٧٠٨٠٩٨ ما يلي :

مشتقات اوكسيم وفق الصيغة (٥) التالية :



واملاحها المقبولة صيدليا.

حيث :

تمثل R^{1e} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة
تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون.

١٥ وتمثل R^{2e} مجموعة الكيلين مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٢ إلى ٦
ذرات كربون.

وتمثل R^{3e} ذرة هيدروجين، أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة
تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة
السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو
٢٠ متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين، أو مجموعة نيترو، أو
مجموعة امينو أو مجموعة أول الكيل امينو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من
١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة ثاني الكيل امينو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة

يحتوي كل شق الكيل فيها من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون، أو مجموعة االكيل تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون.
وتمثل X^e مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل α ، المعرفة في أدناه، أو مجموعة عطرية مخططة تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل α ، المعرفة في أدناه.

ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة ما يلي :

- أ - مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون،
أو
- ب - مجموعة هالوالكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات
١٠ كربون، أو
- ج - مجموعة هيدروكسي، أو
- د - مجموعة اسيلوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات
كربون، أو
- هـ - مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات
١٥ كربون، أو
- و - مجموعة الكيلين ديوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤
ذرات كربون، أو
- ز - مجموعة االكيلوكسي تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرات كربون، أو
- ح - مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات
٢٠ كربون، أو
- ط - مجموعة الكيل كبريتونيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤
ذرات كربون، أو
- ي - ذرة هالوجين، أو
- ك - مجموعة نيترو، أو

- ل - مجموعة امينو، أو
- م - مجموعة أول الكيل امينو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو
- ن - مجموعة ثنائي الكيل امينو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة حيث يحتوي كل شق ٥ الكيل فيها من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو
- س - مجموعة اراكيل تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون، أو
- ع - مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرة كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β المعرفة في أدناه، أو
- ف - مجموعة اريلوكسي تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها بديل ١٠ واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β المعرفة في أدناه، أو
- ص - مجموعة اريل ثيو تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β المعرفة في أدناه، أو
- ق - مجموعة اريل كبريتونيل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β المعرفة في أدناه، أو
- ١٥ ر - مجموعة اريل كبريتونيل امينو تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β المعرفة في أدناه، حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين في شق الامينو من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو
- ش - مجموعة عطرية مخططة، أو
- ٢٠ ت - مجموعة اريلوكسي مخططة، أو
- ث - مجموعة اريل ثيو مخططة، أو
- خ - مجموعة اريل كبريتونيل مخططة، أو

ذ - مجموعة كبريتونيل امينو عطرية مخططة حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين في شق الامينو من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون.

و يمثل البديل β المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو مجموعة هالوالكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين، أو مجموعة الكيلين ديوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.

و تمثل Y^e ذرة الكسجين أو ذرة كبريت أو مجموعة وفق الصيغة $N-R^{4e} >$ (حيث تمثل R^{4e} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون أو مجموعة أسيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون).

و تمثل Z^e مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسو ثيازوليدينيدينيل (٥)-مثيل، أو ٤،٢-ثاني اوكسو ثيازوليدينيدينيل (٥) مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسو اوكسا ثاني ازوليدينيدينيل (٢)-مثيل أو ٥،٣-ثاني اوكسو اوكسا ثاني ازوليدينيدينيل (٢)-مثيل.

وبالنسبة لمركبات الصيغة (٥)، فقد وصفت تفاصيل مثل تعاريف R^{1e} و R^{2e} و R^{3e} و R^{4e} و α و β و X^e و Y^e و Z^e وأنواع الملح المقبول صيدليا وعملية تحضير مركبات الصيغة (٥)، وأمثلة المركبات وأمثلة على تحضيرها، في طاب انبراء اليابانية كوكاي رقم هيه ٩-٤٨٧٧٩ ونشرة البراءات الاوروبية رقم ٧٠٨٠٩٨ والتي أدمجت محتوياتها في هذا البيان للرجوع إليها.

٢٠. فعلى سبيل المثال، عندما تمثل R^{3e} أو البديل α أو البديل β مجموعة الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو ذرة هالوجين، أو عندما تمثل R^{3e} أو البديل α مجموعة اول الكيل امينو أو ثاني الكيل امينو، فانها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج امثلتها أعلاه بالنسبة للبديل χ .

وعندما تمثل R^{3e} أو البديل α أو البديل β مجموعة الكيلين ديوكسي، فإنها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج امثلتها أعلاه بالنسبة لـ R^{4a} و R^{5a} .

وعندما تمثل R^{3e} أو البديل α مجموعة الكيل ثيو، فإنها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج امثلتها أعلاه بالنسبة لـ W^{2c} .

٥. وعندما تمثل R^{3e} أو البديل α أو البديل β أو R^{4e} مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، فإنها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج امثلتها أعلاه بالنسبة لـ R^{3e} .

وعندما تمثل X^e أو البديل α مجموعة نظرية مخططة، فإنها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج امثلتها أعلاه بالنسبة لـ A^{1d} .

وعندما تمثل R^{3e} أو البديل α مجموعة اركيل، أو تمثل R^{3e} أو X^e أو البديل α ١. مجموعة اريل، فإنها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج امثلتها أعلاه بالنسبة لـ R^{1d} .

وعندما تمثل R^{2e} مجموعة الكيلين مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٢ إلى ٦ ذرات كربون، فإنها قد تختار من مجاميع الالكيلين المعرفة والمذكورة امثلتها أعلاه بالنسبة لـ alk.

وعندما يمثل البديل α أو البديل β مجموعة هالوالكيل، فقد يكون جزء الالكيل مجموعة ١٥ مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، ويفضل من ١ إلى ٣ ذرات كربون. ولا يوجد تحديد معين على عدد ذرات الهالوجين، باستثناء التحديد المفروض بعدد المواقع القابلة للاستبدال؛ بيد أن المفضل عموماً هو من ١ إلى ٣ ذرات هالوجين. وتشمل امثلة مجاميع من هذا القبيل مجاميع ثالث فلورومثيل وثالث كلورومثيل وثاني فلورومثيل وثاني كلورومثيل وثاني برومومثيل والفلورومثيل والكلورومثيل والبرومومثيل واليودومثيل و٢،٢،٢-ثالث كلورواثيل و٢،٢،٢-ثالث فلورواثيل و٢-برومواثيل و٢-كلورواثيل و٢-فلورواثيل و٢-يودواثيل و٢،٢-ثاني برومواثيل و٣-بروموبروبيل و٣-كلوروبروبيل و٣-فلوروبروبيل و٣-يودوبروبيل و٤-بروموبوتيل و٤-كلوروبوتيل و٤-فلوروبوتيل و٤-يودوبوتيل و٥-بروموبنتيل و٥-كلوروبنتيل و٥-فلوروبنتيل و٥-يودوبنتيل و٦-يودوبنتيل

بروموهكسيل و٦-كلوروهكسيل و٦-فلوروهكسيل و٦-يودوهكسيل، ويفضل منها مجاميع ثالث فلورومثيل و٢-برومواثيل و٢-كلورواثيل و٢-فلورواثيل.

وعندما يمثل البديل α مجموعة اسيلوكسي، فانها تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، وقد تكون مجموعة اليفاتية مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة. وتشمل امثلة مجاميع من هـ هذا القبيل مجاميع الفورميلوكسي والخليلوكسي والبروبيونيلوكسي والبوتيريلوكسي والايذوبوتيريلوكسي.

وعندما يمثل البديل α مجموعة اراكيلوكسي أو اريلوكسي أو اريل ثيو أو اريل كبريتونيل أو اريل كبريتونيل امينو أو اريلوكسي مخطط أو اريل ثيو مخطط أو اريل كبريتونيل مخطط أو اريل كبريتونيل امينو مخطط، فان جزء الاريل أو الاريل ١. المخطط قد يكون كما تم تعريفه وأدرجت امثله أعلاه.

وعندما يمثل البديل α مجموعة اسيل تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون، فانها يفضل أن تكون مجموعة عطرية اليفاتية أو كربوكسيلية، وتشمل امثلتها ما يلي :

- مجاميع اسيل اليفاتية، ويفضل : مجاميع الكانويل تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون، والأفضل من ١ إلى ٦ ذرات كربون، والأفضل على الاطلاق من ١ إلى ٤ ذرات كربون، مثلا ١٥ مجاميع الخليل والبروبيونيل والبوتيريل والايذوبوتيريل والبيفالويل والفالريل والايذوفالريل والهكسانويل والهيبتانويل والاوكتانويل، ويفضل منها مجموعة الخليل؛ ومجاميع الكانويل مهلجنة تحتوي من ٢ إلى ٦ ذرات كربون، وخاصة مجاميع خليل مهلجنة مثل مجاميع الكلوروكسيل وثاني كلوروكسيل وثالث كلوروكسيل وثالث فلوروكسيل؛ ومجاميع الكوكسي الكانويل منخفض الوزن الجزيئي حيث يحتوي جزء الالكوكسي فيها من ٢. ١ إلى ٥ ذرات كربون، ويفضل من ١ إلى ٣ ذرات كربون، ويحتوي جزء الالكانويل من ٢ إلى ٦ ذرات كربون، ويفضل أن يكون مجموعة خليل، مثلا مجموعة مئوكسي خليل؛ ونظائر غير مشبعة لمجاميع من هذا القبيل، وبالاخص مجاميع الكنويل أو الكينويل تحتوي من ٣ إلى ٦ ذرات كربون، مثل مجاميع اكريلويل ومئاكريلويل وبروبيولويل وكروتونويل وايزوكروتونويل و(E)-٢-مئيل-٢-بوتونيل.

- مجاميع اسيل عطرية، ويفضل مجاميع اريل كربونيل مثل مجاميع البنزويل و α -نفطويل و β -نفطويل؛ ومجاميع اريل كربونيل مهجنة مثل مجاميع ٢- بروموبنزويل و ٤-كلوروبنزويل؛ ومجاميع اريل كربونيل بها بديل من الكيل منخفض الوزن الجزيئي مثل مجموعة ٤-تولويل؛ ومجاميع اريل كربونيل بها بديل من الكوكسي منخفض الوزن الجزيئي مثل مجموعة ٤-انيسويل؛ ومجاميع اريل كربونيل بها بديل من نيترو مثلاً مجاميع ٤-نيتروبنزيل و ٢-نيتروبنزويل؛ ومجاميع اريل كربونيل بها بديل من الكوكسي كربونيل منخفض الوزن الجزيئي، مثلاً مجموعة ٢- (مكوكسي كربونيل) بنزويل.

وتشمل الامثلة المفضلة لمركبات الصيغة (٥) ما يلي :

١. (٢) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل R^{1e} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.
- (٣) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل R^{1e} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون.
- (٤) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل R^{1e} ذرة هيدروجين أو مجموعة مثيل أو ١٥ مجموعة اثيل.

- (٥) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل R^{1e} مجموعة مثيل أو مجموعة اثيل.
- (٦) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل R^{2e} مجموعة الكيلين مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٢ إلى ٥ ذرات كربون.
- (٧) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل R^{2e} مجموعة الكيلين مستقيمة السلسلة أو ٢. متفرعة السلسلة تحتوي ٢ أو ٣ ذرات كربون.
- (٨) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل R^{2e} مجموعة اثيلين أو ثالث مثيلين أو مثيل اثيلين.

- (٩) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل R^{2e} مجموعة اثيلين.

(١٠) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل R^{3e} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة مثوكسي أو مجموعة اثوكسي أو مجموعة مثيل ثيو أو مجموعة اثيل ثيو أو ذرة هالوجين.

(١١) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل R^{3e} ذرة هيدروجين.

٥ (١٢) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل X^e مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل α أو مجموعة عطرية مخططة تحتوي من ٥ إلى ١٠ ذرات حلقية (والتي قد تحتوي على حلقة واحدة أو على حلقتين) منها ١ إلى ٣ ذرات حلقية تكون ذرات متباينة تختار من المجموعة التي تشتمل على ذرات النيتروجين والاكسجين والكبريت والتي تخلو من البدائل ١٠ أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البديل α .

ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة ما يلي :

أ - مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو

ب - مجموعة هالوالكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات ١٥ كربون، و/أو

ج - مجموعة هيدروكسي، و/أو

د - مجموعة اسيلوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

هـ - مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات ٢٠ كربون، و/أو

و - مجموعة الكيلين ديوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

ز - مجموعة اركيلوكسي تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون، و/أو

- ح - مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو
- ط - مجموعة الكيل كبريتونيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو
- هـ - ذرة هالوجين، و/أو
- ك - مجموعة الكيل تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون، و/أو
- ل - مجموعة فنيل تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو
- م - مجموعة فنوكسي تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو
- ١٠ - مجموعة فنيل ثيو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو
- س - مجموعة فنيل كبريتونيل تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو
- ١٥ ع - مجموعة فنيل كبريتونيل امينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين في شق الامينو من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو
- ف - مجموعة فوريل أو ثينيل أو اوكسازوليل أو ايزوكسازوليل أو ثيازوليل أو بيريديل أو بيريديلوكسي أو بيريديل ثيو أو بيريديل كبريتونيل، و/أو
- ٢٠ ص - مجموعة ايميدازوليل حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو

ق - مجموعة بيريديل كبريتونيل امينو حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين في شق الامينو من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون.

و يمثل البديل β المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو مجموعة هالوالكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين، أو مجموعة الكيلين ديوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.

(١٣) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل X^e مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل α أو مجموعة عطرية مغلقة تحتوي من ٥ إلى ١٠ ذرات حلقية (والتي قد تحتوي على حلقة واحدة أو على حلقتين) منها ١ إلى ٣ ذرات حلقية على شكل ذرات متباعدة تختار من المجموعة التي تشتمل على ذرات النيتروجين والاكسجين والكبريت والتي تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل α .

١٥ ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة ما يلي :

أ - مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو

ب - مجموعة هالوالكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

٢٠ ج - مجموعة هيدروكسي، و/أو

د - مجموعة الكانويوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

هـ - مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

- و - مجموعة الكيلين ديوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو
- ز - مجموعة اركيلوكسي تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون، و/أو
- ح - مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو ٥
- ط - مجموعة الكيل كبريتونيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو
- ي - ذرة فلور أو كلور أو بروم ، و/أو
- ك - مجموعة اركيل تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون، و/أو
- ١٠ ل - مجموعة فنيل تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو
- م - مجموعة فنوكسي تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو
- ن - مجموعة فنيل ثيو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو ١٥
- س - مجموعة فنيل كبريتونيل تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو
- ع - مجموعة فنيل كبريتونيل امينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين في شق الامينو من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٢٠ ذرات كربون، و/أو ٦
- ف - مجموعة فوريل أو ثينيل أو اوكسازوليل أو ايزوكسازوليل أو ثيازوليل أو بيريديل أو بيريديلوكسي أو بيريديل ثيو أو بيريديل كبريتونيل، و/أو

ص - مجموعة إيميدازوليل حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو ق - مجموعة بيريديل كبريتونيل أمينو حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين في شق الأمينو من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون.

ويمثل البديل β المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو مجموعة هالوالكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين، أو مجموعة الكيلين ديوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.

(١٤) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل X^e مجموعة فنيل أو نفطيل أو إيميدازوليل أو أوكسازوليل أو بيريديل أو اندوليل أو كوينوليل أو ايزوكوينوليل والتي تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل α . ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة ما يلي :

١٥ أ - مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو

ب - مجموعة هالوالكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

ج - مجموعة هيدروكسي، أو

٢٠ د - مجموعة الكانويوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

هـ - مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

و - مجموعة مثيلين ديوكسي، و/أو

- ز - مجموعة اركيلوكسي تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون، و/أو
- ح - مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو
- ط - مجموعة الكيل كبريتونيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو
- هـ - ذرة فلور أو كلور أو بروم، و/أو
- ك - مجموعة اركيل تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون، و/أو
- ل - مجموعة فنيل تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على مجاميع المثل وثالث فلورومثيل ومثوكسي وفلورو ومثيلين ديوكسي، و/أو
- ١٠ م - مجموعة فنوكسي تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على مجاميع المثل وثالث فلورومثيل ومثوكسي وفلورو ومثيلين ديوكسي، و/أو
- ن - مجموعة فنيل ثيو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على مجاميع المثل وثالث فلورومثيل ومثوكسي وفلورو ومثيلين ديوكسي، و/أو
- س - مجموعة فنيل كبريتونيل تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على مجاميع المثل وثالث فلورومثيل ومثوكسي وفلورو ومثيلين ديوكسي، و/أو
- ١٥ - المجموعة التي تشتمل على مجاميع المثل وثالث فلورومثيل ومثوكسي وفلورو ومثيلين ديوكسي، و/أو
- ع - مجموعة فنيل كبريتونيل امينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على مجاميع المثل وثالث فلورومثيل ومثوكسي وفلورو ومثيلين ديوكسي، وحيث تخلو فيها ذرة النيتروجين في شق الامينو من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو
- ٢٠ ف - مجموعة فوريل أو ثينيل أو اوكسازوليل أو ايزوكسازوليل أو ثيازوليل أو بيريديل أو بيريديلوكسي أو بيريديل ثيو أو بيريديل كبريتونيل، و/أو
- ص - مجموعة ايميدازوليل حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو

ق - مجموعة بيريديل كبريتونيل امينو حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين في شق الامينو من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون.

٥ (١٥) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل X^e مجموعة فنيل أو نفطيل أو إيميدازوليل أو أو اوكسازويل أو بيريديل أو اندوليل أو كوينوليل أو ايزوكوينوليل والتي تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل α . ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة ما يلي :

١ - مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو

١٠ ب - مجموعة هالوالكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو

ج - مجموعة هيدروكسي، أو

د - مجموعة الكانويلوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

١٥ هـ - مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

و - مجموعة مثيلين ديوكسي أو بنزيلوكسي أو فنثيلوكسي أو نفطيل مثوكسي، و/أو

ز - مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

٢٠ ح - مجموعة الكيل كبريتونيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

ط - ذرة فلور أو كلور أو بروم، و/أو

ي - مجموعة بنزيل، و/أو

ك - مجموعة فنيل تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على مجاميع المثل وثالث فلورومثيل ومثوكسي وفلورو ومثيلين ديوكسي، و/أو

ل - مجموعة فنوكسي تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على مجاميع المثل وثالث فلورومثيل ومثوكسي وفلورو ومثيلين ديوكسي، و/أو

هـ م - مجموعة فنيل ثيو أو فنيل كبريتونيل أو فنيل كبريتونيل امينو أو N -مثيل فنيل كبريتونيل امينو أو فوريل أو ثينيل أو اكسازوليل أو ايزوكسازوليل أو ثيازوليل أو بيريديل أو بيريديلوكسي أو بيريديل ثيو أو بيريديل كبريتونيل أو بيريديل كبريتونيل امينو أو N -مثيل بيريديل كبريتونيل امينو، و/أو

ن - مجموعة ايميدازوليل حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين من البدائل أو بها بديل من مجموعة ١٠ الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون.

(١٦) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل X^e مجموعة فنيل أو نفطيل أو بيريديل أو اندوليل أو كوينوليل أو ايزوكوينوليل تخلو من البدائل، أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل α .

ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة ما يلي :

١٥ أ - مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون، و/أو

ب - مجموعة ثالث فلورومثيل أو ثنائي فلورومثيل أو فلورومثيل أو هيدروكسي أو فورميلوكسي أو خلاتوكسي، و/أو

ج - مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات ٢٠ كربون، و/أو

د - مجموعة مثيلين ديوكسي أو بنزيلوكسي أو مثيل ثيو أو اثيل ثيو أو مثيل كبريتونيل أو اثيل كبريتونيل، و/أو

هـ - ذرة فلور أو كلور أو بروم، و/أو

و - مجموعة بنزيل و/أو فنيل و/أو ٤-مثيل فنيل و/أو ٤-ثالث فلورومثيل فنيل و/أو ٤-مثنوكسي فنيل و/أو ٤-فلوروفنيل و/أو ٢، ٤-مثيلين ديوكسي فنيل و/أو فنيل ثيو و/أو فنيل كبريتونيل و/أو فنيل كبريتونيل امينو و/أو N-مثيل فنيل كبريتونيل امينو و/أو فوريل و/أو اوكسازوليل و/أو ثيازوليل و/أو ايميدازوليل و/أو N-مثيل ايميدازوليل و/أو بيريديل و/أو بيريديلوكسي و/أو بيريديل ثيو و/أو بيريديل كبريتونيل و/أو بيريديل كبريتونيل امينو و/أو N-مثيل بيريديل كبريتونيل امينو.

(١٧) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل X^e مجموعة فنيل أو نفطيل أو بيريديل أو كوينوليل أو ايزوكوينوليل تخلو من البدائل أو بها بديل من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل α .

١٠ ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة مجموعة مثيل و/أو اثيل و/أو ايزوبروبيل و/أو ثالث فلورو مثيل و/أو هيدروكسي و/أو خلاتوكسي و/أو مثنوكسي و/أو اثوكسي و/أو ايزوبروبوكسي و/أو مثيلين ديوكسي و/أو بنزيلوكسي و/أو مثيل ثيو و/أو اثيل ثيو و/أو مثيل كبريتونيل و/أو اثيل كبريتونيل و/أو ذرة كلور و/أو مجموعة بنزيل و/أو فنيل و/أو فنوكسي و/أو فنيل ثيو و/أو فنيل كبريتونيل و/أو فنيل كبريتونيل امينو و/أو N-مثيل فنيل كبريتونيل امينو و/أو بيريديل و/أو بيريديلوكسي و/أو بيريديل ثيو و/أو بيريديل كبريتونيل و/أو بيريديل كبريتونيل امينو و/أو N-مثيل بيريديل كبريتونيل امينو.

(١٨) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل X^e مجموعة فنيل تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل α .

٢٠ ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة مجموعة مثيل و/أو هيدروكسي و/أو خلاتوكسي و/أو ذرة كلور و/أو مجموعة بنزيل و/أو فنيل و/أو فنوكسي و/أو فنيل ثيو و/أو فنيل كبريتونيل و/أو فنيل كبريتونيل امينو و/أو N-مثيل فنيل كبريتونيل امينو و/أو بيريديل و/أو بيريديلوكسي و/أو بيريديل ثيو و/أو بيريديل كبريتونيل.

(١٩) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل X^e مجموعة بيريديل تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل α .

ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة مجموعة مثوكسي و/أو اثوكسي و/أو ايزوبروبوكسي و/أو بنزيلوكسي و/أو مثيل ثيو و/أو مثيل كبريتونيل و/أو اثيل كبريتونيل و/أو بنزيل و/أو فنيل و/أو فنوكسي و/أو فنيل ثيو و/أو فنيل كبريتونيل و/أو فنيل كبريتونيل امينو و/أو N-مثيل فنيل كبريتونيل امينو.

٥ (٢٠) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل Y^e ذرة اكسجين أو ذرة كبريت أو مجموعة وفق الصيغة $N-R^{4e} >$ (حيث تمثل R^{4e} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون أو مجموعة الكانويل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٢ إلى ٥ ذرات كربون).

(٢١) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل Y^e ذرة اكسجين.

١٠ (٢٢) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل Z^e مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسوثيريازوليدينيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسوزوليدينيل (٥)-مثيل أو ٥،٣-ثاني اوكسواوكسا ثاني زوليدينيل (٢)-مثيل.

(٢٣) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل Z^e مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسوثيريازوليدينيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسواوكسازوليدينيل (٥)-مثيل.

١٥ (٢٤) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل Z^e مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسوثيريازوليدينيل (٥)-مثيل.

(٢٥) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل R^{1e} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.

وتمثل R^{2a} مجموعة الكيلين مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٢ إلى ٥

٢٠ ذرات كربون.

وتمثل R^{3e} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو مجموعة مثوكسي أو مجموعة اثوكسي أو مجموعة مثيل ثيو أو مجموعة اثيل ثيو أو ذرة هالوجين.

وتمثل X^e مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل α أو مجموعة عطرية مغلطة تحتوي من ٥ إلى ١٠ ذرات حلقية (والتي قد تحتوي على حلقة واحدة أو حلقتين) منها ١ إلى ٣ ذرات حلقية تكون على شكل ذرات متباينة تختار من المجموعة التي تشتمل على ذرات النيتروجين والاكسجين والكبريت والتي تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل α .

ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة ما يلي :

١ - مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون،
و/أو

١٠ ب - مجموعة هالوكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

ج - مجموعة هيدروكسي، و/أو

د - مجموعة سيلوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

١٥ هـ - مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

و - مجموعة الكيلين ديوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

ز - مجموعة اركيلوكسي تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون، و/أو

٢٠ ح - مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

ط - مجموعة الكيل كبريتونيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

ي - ذرة هالوجين ، و/أو

- ك - مجموعة االكيل تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون، و/أو
- ل - مجموعة فنيل تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو
- م - مجموعة فنوكسي تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو
- ٥ ن - مجموعة فنيل ثيو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو
- س - مجموعة فنيل كبريتونيل تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو
- ١٠ ع - مجموعة فنيل كبريتونيل امينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، وحيث تخلو فيها ذرة النيتروجين في شق الامينو من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو
- ف - مجموعة فوريل أو ثينيل أو اوكسازوليل أو ايزوكسازوليل أو ثيازوليل أو بيريديل أو بيريديلوكسي أو بيريديل ثيو أو بيريديل كبريتونيل، و/أو
- ١٥ ص - مجموعة ايميدازوليل حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو
- ق - مجموعة بيريديل كبريتونيل امينو حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين في شق الامينو من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٢٠ ذرات كربون.
- ويمثل البديل β المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو مجموعة هالوالدهل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة

السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو ذرة هالوجين، أو مجموعة الكيلين ديوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.

وتمثل Y^e ذرة اكسجين، أو ذرة كبريت، أو مجموعة وفق الصيغة $N-R^{4e} >$ (حيث

تمثل R^{4e} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١

٥ إلى ٣ ذرات كربون أو مجموعة الكانويل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٢ إلى ٥ ذرات كربون).

وتمثل Z^e مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسو-ثيازوليدينيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني

اوكسو اوكسا ثيازوليدينيل (٥)-مثيل، أو ٥،٣-ثاني اوكسو اوكسا ثاني ازوليدينيل (٢)-مثيل.

(٢٦) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

١٠. تمثل R^{1e} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.

وتمثل R^{2e} مجموعة الكيلين مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٢ إلى ٥ ذرات كربون.

وتمثل R^{3e} ذرة هيدروجين.

١٥. وتمثل X^e مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون والتي تخلو من البدائل

أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تحتوي على البدائل α أو مجموعة عطرية

مخلطة تحتوي من ٥ إلى ١٠ ذرات حلقية (والتي قد تحتوي على حلقة واحدة أو حلقيتين)

منها ١ إلى ٣ ذرات حلقية عبارة عن ذرات متباينة تختار من المجموعة التي تشتمل على

ذرات النيتروجين والاكسجين والكبريت والتي تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار

٢٠. من المجموعة التي تشتمل على البديل α .

ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة ما يلي :

١ - مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون،

و/أو

- ب - مجموعة هالوالكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو
- ج - مجموعة هيدروكسي، و/أو
- د - مجموعة الكانويوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو
- هـ - مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو
- و - مجموعة الكيلين ديوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو
- ١٠ ز - مجموعة اركيلوكسي تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون، و/أو
- ح - مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو
- ط - مجموعة الكيل كبريتونيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو
- ١٥ ي - ذرة فلور أو كلور أو بروم، و/أو
- ك - مجموعة اركيل تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون، و/أو
- ل - مجموعة فنيل تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو
- م - مجموعة فنوكسي تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو
- ٢٠ ن - مجموعة فنيل ثيو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو
- س - مجموعة فنيل كبريتونيل تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، و/أو

ع - مجموعة فنيل كبريتونيل امينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β ، وحيث تخلو فيها ذرة النيتروجين في شق الامينو من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو

٥ ف - مجموعة فوريل أو ثينيل أو اوكسازوليل أو ايزوكسازوليل أو ثيازوليل أو بيريديل أو بيريديلوكسي أو بيريديل ثيو أو بيريديل كبريتونيل، و/أو

ص - مجموعة ايميدازوليل حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو
ق - مجموعة بيريديل كبريتونيل امينو حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين في شق الامينو من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون.

ويمثل البديل β المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو مجموعة هالوالكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين، أو مجموعة الكيلين ديوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون. وتمثل Y^e ذرة اكسجين.

وتمثل Z^e مركب ٤،٢-ثاني اوكسوثيريازوليدينيل (٥) مثيل أو مركب ٤،٢-ثاني اوكسوثيريازوليدينيل (٥) مثيل.

٢٠ (٢٧) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

تمثل R^{1e} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون.

وتمثل R^{2e} مجموعة الكيلين مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي على ٢ أو ٣ ذرات كربون.

وتمثل R^{3e} ذرة هالوجين.

وتمثل X^e مجموعة فنيل أو نفطيل أو ايميدازوليل أو اوكسازوليل أو بيريديل أو اندوليل أو كوينوليل أو ايزوكوينوليل والتي تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل α .

ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة ما يلي :

أ - مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو

ب - مجموعة هالوكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

١٠ ج - مجموعة هيدروكسي، و/أو

د - مجموعة الكانويوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

هـ - مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

١٥ و - مجموعة مثيلين ديوكسي، و/أو

ز - مجموعة اركيلوكسي تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون، و/أو

ح - مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

ط - مجموعة الكيل كبريتونيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، و/أو

ي - ذرة فلور أو كلور أو بروم، و/أو

ك - مجموعة اركيل تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون، و/أو

ل - مجموعة فنيل (قد يكون بها بدائل من مجموعة فنيل أو ثالث فلوروفنيل أو ميثوكسي أو فلورو أو مثيلين ديوكسي)، و/أو

- م - مجموعة فنوكسي (يمكن ان يستبدل شق الفنيل بمجموعة مثيل أو ثالث فلورومثيل أو مئوكسي أو فلورو أو مئيلين ديوكسي)، و/أو
- ن - مجموعة فنيل ثيو (يمكن ان يستبدل شق الفنيل بمجموعة مثيل أو ثالث فلورومثيل أو مئوكسي أو فلورو أو مئيلين ديوكسي)، و/أو
- ٥ س - مجموعة فنيل كبريتونيل (يمكن ان يستبدل شق الفنيل بمجموعة مثيل أو ثالث فلورومثيل أو مئوكسي أو فلورو أو مئيلين ديوكسي)، و/أو
- ع - مجموعة فنيل كبريتونيل امينو (يمكن ان يستبدل شق الفنيل بمجموعة مثيل أو ثالث فلورومثيل أو فلورو أو مئيلين ديوكسي وقد تستبدل ذرة النيتروجين في شق الفنيل بمجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون)، و/أو
- ١٠ ف - مجموعة فوريل أو ثينيل أو اوكسازوليل أو ايزوكسازوليل أو ثيازوليل أو بيريديل أو بيريديلوكسي أو بيريديل ثيو أو بيريديل كبريتونيل، و/أو
- ص - مجموعة ايميدازوليل حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، و/أو
- ق - مجموعة بيريديل كبريتونيل امينو حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين في شق الامينو من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ١٥ ذرات كربون.

وتمثل Y^e ذرة اكسجين.

وتمثل Z^e مركب ٤،٢-ثاني اوكسوثيرازوليدينيل (٥) مثيل.

(٢٨) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

٢٠ تمثل R^{1e} ذرة هيدروجين أو مجموعة مئيل أو مجموعة اثيل.

وتمثل R^{2e} مجموعة اثيلين أو ثالث مئيلين أو مئيل اثيلين.

وتمثل R^{3e} ذرة هيدروجين.

وتمثل X^e مجموعة فنيل أو نفطيل أو إيميدازوليل أو أوكسازوليل أو بيريديل أو اندوليل أو كوينوليل أو إيزوكوينوليل والتي تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل α .

ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة ما يلي :

٥ أ - مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون،
و/أو

ب - مجموعة هالوالكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات
كربون، و/أو

ج - مجموعة هيدروكسي، و/أو

١٠ د - مجموعة الكانويوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات
كربون، و/أو

هـ - مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات
كربون، و/أو

و - مجموعة مثيلين ديوكسي أو بنزيلوكسي أو فنثيلوكسي أو نفطيل مثوكسي، و/أو

١٥ ز - مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات
كربون، و/أو

ح - مجموعة الكيل كبريتونيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤
ذرات كربون، و/أو

ط - ذرة فلور أو كلور أو بروم، و/أو

٢٠ ي - مجموعة بنزيل، و/أو

ك - مجموعة فنيل (التي قد يكون بها بديل من مجموعة مثيل أو ثالث فلورومثيل أو مثوكسي
أو فلورو أو مثيلين ديوكسي)، و/أو

ل - مجموعة فنوكسي (حيث يمكن استبدال شق الفنيل بمجموعة مثيل أو ثالث فلورومثيل أو
مثوكسي أو فلورو أو مثيلين ديوكسي)، و/أو

م - مجموعة فنيل ثيو أو فنيل كبريتونيل امينو أو N -مثيل فنيل كبريتونيل امينو أو فوريل أو ثينيل أو اوكسازوليل أو ايزوكسازوليل أو ثيازوليل أو بيريديل أو بيريديلوكسي أو بيريديل ثيو أو بيريديل كبريتونيل أو بيريديل كبريتونيل امينو أو N -مثيل بيريدينيل كبريتونيل امينو، و/أو ق- مجموعة ايميدازوليل حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين في شق الامينو من البدائل أو بها ٥ بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون.

وتمثل Y^e ذرة اكسجين.

وتمثل Z^e مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسوثيرازوليدينيل (٥) مثيل.

(٢٩) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

١٠ تمثل R^1 ذرة هيدروجين أو مجموعة مثيل أو مجموعة اثيل.

وتمثل R^2 مجموعة اثيلين أو ثالث مثيلين أو مثيل اثيلين.

وتمثل R^3 ذرة هيدروجين.

وتمثل X^e مجموعة فنيل أو نفطيل أو بيريديل أو اندوليل أو كوينوليل أو ايزوكوينوليل

والتي تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على

١٥ البدائل α .

ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة ما يلي :

أ - مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون،

و/أو

ب - مجموعة ثالث فلورومثيل أو ثاني فلورومثيل أو فلورومثيل أو هيدروكسي أو

٢٠ فورميلوكسي أو خيلوكسي، و/أو

ج - مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات

كربون، و/أو

د - مجموعة مثيلين ديوكسي أو بنزيلوكسي أو مثيل ثيو أو اثيل ثيو أو مثيل كبريتونيل أو

اثيل كبريتونيل، و/أو

هـ - ذرة فلور أو كلور أو بروم، و/أو

و - مجموعة بنزيل و/أو فنيل و/أو ٤-مثيل فنيل و/أو ٤-ثالث فلورومثيل فنيل و/أو ٤-مثوكسي فنيل و/أو ٤-فلوروفنيل و/أو ٤،٣-مثيلين ديوكسي فنيل و/أو فنوكسي و/أو فنيل ثيو و/أو فنيل كبريتونيل و/أو فنيل كبريتونيل امينو و/أو N-مثيل فنيل كبريتونيل امينو و/أو فوريل و/أو ثينيل و/أو اوكسازوليل و/أو ثيازوليل و/أو ايميدازوليل و/أو N-مثيل ايميدازوليل و/أو بيريديل و/أو بيريديلوكسي و/أو بيريديل ثيو و/أو بيريديل كبريتونيل و/أو بيريديل كبريتونيل امينو و/أو N-مثيل بيريديل كبريتونيل امينو.

وتمثل Y^e ذرة اكسجين.

وتمثل Z^e مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسوثيرازوليدينيل (٥) مثيل.

١٠ (٣٠) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

تمثل R^{1e} ذرة هيدروجين أو مجموعة مثيل أو مجموعة اثيل.

وتمثل R^{2e} مجموعة اثيلين.

وتمثل R^{3e} ذرة هيدروجين.

وتمثل X^e مجموعة فنيل أو نفطيل أو بيريديل أو كوينوليل أو ايزوكوينوليل والتي

١٥ تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل α .

ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة مجموعة مثيل و/أو اثيل و/أو ايزوبروبيل و/أو

ثالث فلورومثيل و/أو هيدروكسي و/أو خيلوكسي و/أو مثوكسي و/أو اثوكسي و/أو

ايزوبروبوكسي و/أو مثيلين ديوكسي و/أو بنزيلوكسي و/أو مثيل ثيو و/أو اثيل ثيو و/أو مثيل

كبريتونيل و/أو اثيل كبريتونيل و/أو ذرة كلور و/أو مجموعة بنزيل و/أو فنيل و/أو فنوكسي

٢٠ و/أو فنيل ثيو و/أو فنيل كبريتونيل و/أو فنيل كبريتونيل امينو و/أو N-مثيل فنيل كبريتونيل

امينو و/أو بيريديل و/أو بيريديل ثيو و/أو بيريديل كبريتونيل و/أو بيريديل كبريتونيل امينو

و/أو N-مثيل بيريديل كبريتونيل امينو.

وتمثل Y^e ذرة اكسجين.

وتمثل Z^e مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسوثيرازوليدينيل (٥) مثيل.

(٣١) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

تمثل R^1 مجموعة مثيل أو مجموعة اثيل.

وتمثل R^2 مجموعة اثيلين.

وتمثل R^3 ذرة هيدروجين.

٥ وتمثل X^e مجموعة فنيل تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من

المجموعة التي تشتمل على البدائل α .

ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة مجموعة مثيل و/أو هيدروكسي و/أو خلاتوكسي

و/أو ذرة كلور و/أو مجموعة بنزيل و/أو فنيل و/أو فنوكسي و/أو فنيل ثيو و/أو فنيل

كبريتونيل و/أو فنيل كبريتونيل امينو و/أو N -مثيل فنيل كبريتونيل امينو و/أو بيريديل و/أو

١٠ بيريديلوكسي و/أو بيريديل ثيو و/أو بيريديل كبريتونيل.

وتمثل Y^e ذرة اكسجين.

وتمثل Z^e مجموعة ٢،٤-ثاني اوكسو ثيازوليدينيل (٥) مثيل.

(٣٢) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

تمثل R^1 مجموعة مثيل أو مجموعة اثيل.

١٥ وتمثل R^2 مجموعة اثيلين.

وتمثل R^3 ذرة هيدروجين.

وتمثل X^e مجموعة بيريديل تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من

المجموعة التي تشتمل على البدائل α .

ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة مجموعة مثوكسي و/أو اثوكسي و/أو

٢٠ ايزوبروبوكسي و/أو بنزيلوكسي و/أو مثيل ثيو و/أو اثيل ثيو و/أو مثيل كبريتونيل و/أو اثيل

كبريتونيل و/أو بنزيل و/أو فنيل و/أو فنوكسي و/أو فنيل ثيو و/أو فنيل كبريتونيل و/أو فنيل

كبريتونيل امينو و/أو N -مثيل فنيل كبريتونيل امينو.

وتمثل Y^e ذرة اكسجين.

وتمثل Z^e مجموعة ٢،٤-ثاني اوكسو ثيازوليدينيل (٥) مثيل.

(٣٣) المركبات الموصوفة في (١) والتي تختار من المركبات التالية :

١ (أ) ٥-٤-٢- (١-ثاني فنييل (٤)-اثيليدين) امينو اوكسي { اوكسي (بنزيل) ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

٥ (ب) ٥-٤-٢- (١-٤-فنييل كبريتونيل فنييل) اثيليدين [امينو اوكسي { اوكسي (بنزيل) ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

٥ (ج) ٥-٤-٢- (١-٤-بيريديل (٢) فنييل) اثيليدين [امينو اوكسي { اوكسي (بنزيل) ثيازوليدين-٤،٢-ديون (الذي يدعى لاحقا في هذا البيان " المركب أ ").

٥ (د) ٥-٤-٢- (١-٤-بيريديل (٣) فنييل) اثيليدين [امينو اوكسي { اوكسي (بنزيل) ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

١٠ (هـ) ٥-٤-٢- (١-٤-بيريديل (٤) فنييل) اثيليدين [امينو اوكسي { اوكسي (بنزيل) ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

٥ (و) ٥-٤-٢- (١-٢-فنييل-٥-بيريديل) اثيليدين [امينو اوكسي { اوكسي (بنزيل) ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

٥ (ز) ٥-٤-٢- (١-٢-مئوكسي-٥-بيريديل) اثيليدين [امينو اوكسي { اوكسي (بنزيل) ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

٥ (ح) ٥-٤-٢- (١-٢-اوكسي-٥-بيريديل) اثيليدين [امينو اوكسي { اوكسي (بنزيل) ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

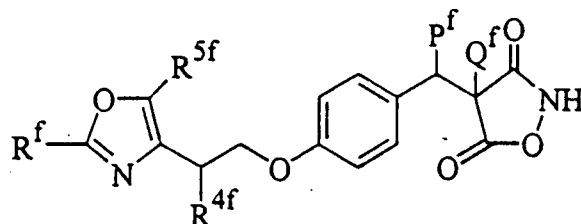
٥ (ط) ٥-٤-٢- (١-٢-ايزوبروبوكسي-٥-بيريديل) اثيليدين [امينو اوكسي { اوكسي (بنزيل) ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

٢٠ (ي) ٥-٤-٢- (١-٢-بنزيل-٥-بيريديل) اثيليدين [امينو اوكسي { اوكسي (بنزيل) ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

سادسا : يصف طلب البراءة الدولية رقم ٩٥/١٨١٢٥ ما يلي :

(١) مشتق ايزوكسازوليدين ديون بالصيغة (٦) التالية :

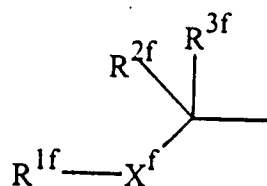
(٦)



حيث :

تمثل R^f مجموعة هيدروكربونية عطرية قد تحتوي على بدائل، أو مجموعة هيدروكربونية اليقاتية حلقية قد تحتوي على بدائل، أو مجموعة حلقية مغلطة قد تحتوي على بدائل، أو مجموعة حلقية مغلطة منصهرة قد تحتوي على بدائل، أو مجموعة وفق الصيغة (١٦) التالية :

(١٦)



(حيث تمثل R^{1f} مجموعة هيدروكربونية عطرية والتي قد يكون بها بدائل، أو مجموعة هيدروكربونية اليقاتية حلقية قد يكون بها بدائل أو مجموعة حلقية مغلطة قد يكون بها بدائل أو مجموعة حلقية مغلطة منصهرة قد يكون بها بدائل، وتكون R^{2f} و R^{3f} متماثلة أو مختلفة، ويمثل كل منهما ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل منخفض الوزن الجزيئي، وتمثل X^f ذرة اكسجين أو ذرة كلور أو مجموعة امينو ثانوية).

وتمثل R^{4f} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل منخفض الوزن الجزيئي.

وتمثل R^{4f} مجموعة الكيل منخفض الوزن الجزيئي.

ويمثل كل من P^f و Q^f ذرة هيدروجين أو يشكلان معا رابطة؛ ١٥

واملاحها المقبولة صيدليا.

وبالنسبة لمركبات الصيغة (٦)، فقد وصفت تفاصيل مثل تعاريف R^f و R^{1f} و R^{2f} و R^{3f} و R^{4f} و R^{5f} و P^f و Q^f وانواع الملح المقبول صيدليا وعملية تحضير مركبات الصيغة (٦)،

وأمثلة المركبات وأمثلة على التحضير، في نشرة البراءات الدولية رقم ٩٥/١٨١٢٥ والتي أدمجت محتوياتها في هذا البيان للرجوع إليها.

وتشمل أمثلة أخرى محددة للمجاميع الهيدروكربونية العطرية التي قد يمثلها R^f و

R^{1f} ، مجاميع الأريل المعرفة والمذكورة أمثلتها أعلاه بالنسبة لـ R^{1d} .

٥ وعندما تمثل R^f أو R^{1f} مجموعة حلقية مخططة أو مجموعة حلقية مخططة منصهرة، فإنها قد تكون أية مجموعة من المجاميع الحلقية المخططة العطرية أو المجاميع الحلقية المخططة المصهورة المعرفة والمذكورة أمثلتها أعلاه بالنسبة لـ A^{1d} . ويمكن بشكل بديل أن تمثل R^f أو R^{1f} مجموعة حلقية مخططة لاعطرية (ويفضل أن تكون مشبعة)، وقد تحتوي هذه المجموعة من ٥ إلى ٧ ذرات حلقية، منها ١ إلى ٣ ذرات قد تكون ذرات متباينة ١٠. تختار من المجموعة التي تشتمل على ذرات النيتروجين والأكسجين والكبريت، ويفضل أن تكون واحدة منها على الأقل ذرة نيتروجين. وتشمل أمثلة مجاميع من هذا القبيل مجاميع البيروليدينيل والبييريدينيل والبييرازينيل و-N-مثيل بييرازينيل والمورفولينيل والثيومورفولينيل والاكسازوليدينيل والثيازوليدينيل وثاني زوليدينيل والاكسولانيل والثيولانيل وفوق هيدروبيريدل.

١٥ وعندما تمثل R^f أو R^{1f} مجموعة هيدروكربونية اليافاتية حلقية، فإنها يفضل أن تكون مجموعة الكيل حلقية، ويفضل أن تحتوي من ٣ إلى ٨ ذرات كربون حلقية، وتشمل أمثلتها مجاميع البروبيل الحلقية والبوتيل والبنثيل الحلقية والهكسيل الحلقية والهيبتيل الحلقية والاوكتيل الحلقية، ويفضل منها مجموعة البنثيل الحلقية ومجموعة الهكسيل الحلقية. ويمكن أن تكون بشكل بديل مجموعة الكنيل حلقية، ويفضل أن تحتوي من ٥ إلى ٨ ذرات كربون حلقية، مثلاً ٢٠. مجموعة بنتيل حلقية أو هكسنيل حلقية أو هيبتيل حلقية أو اوكتينيل حلقية.

ويمكن أن تخلو أية مجموعة من المجاميع أعلاه التي تمثلها R^f أو R^{1f} من البدائل أو بها يكون بها بدائل. فإذا كان بها بدائل يمكن استبدال المجموعة بأية مجموعة تستخدم عادة في هذا المجال، مثلاً تلك المجاميع المعرفة والمذكورة أمثلتها أعلاه بالنسبة للبدائل α .

وعندما تمثل R^{2f} أو R^{3f} أو R^{4f} أو R^{5f} مجموعة الكيل، فإنها تكون مجموعة الكيل منخفض الوزن الجزيئي يفضل ان تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، والأفضل من ١ إلى ٤ ذرات كربون، وقد تكون كما هي معرفة ومذكورة أمثلتها بالنسبة لـ R^{3c} والبدائل γ . وتشمل الأمثلة المفضلة لمركبات الصيغة (٦) ما يلي :

٥ (٢) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل R^f ذرة هيدروجين وتمثل R^{5f} مجموعة الكيل منخفض الوزن الجزيئي.

(٣) المركب الموصوف في (٢)، حيث تمثل R^f مجموعة فنيل قد يكون بها بدائل، أو مجموعة عطرية حلقية مغلطة خماسية أو سداسية أعضاء تكوين الحلقة والتي قد يكون بها بدائل وتحتوي على ذرة متباينة واحدة أو ذرتين متباينتين تختار من المجموعة التي تشتمل على ١ ذرات الكبريت والاكسجين والنيتروجين، أو مجموعة عطرية حلقية مغلطة مصهورة والتي قد يكون بها بدائل وتشكل من انصهار الحلقة العطرية المغلطة الموصوفة أعلاه مع حلقة بنزين.

(٤) المركب الموصوف في (٣)، حيث تمثل R^f مجموعة فنيل أو مجموعة عطرية حلقية مغلطة خماسية أو سداسية أعضاء تكوين الحلقة تحتوي من ١ إلى ٢ ذرة متباينة تختار من ١٥ المجموعة التي تشتمل على ذرات الكبريت والاكسجين والنيتروجين، أو مجموعة عطرية حلقية مغلطة منصهرة تشكل من انصهار الحلقة العطرية المغلطة الموصوفة أعلاه مع حلقة بنزين.

(٥) المركب الموصوف في (٣)، حيث تمثل R^f مجموعة فنيل أو مجموعة عطرية حلقية مغلطة منصهرة تشكل من انصهار حلقة بنزين مع حلقة مغلطة خماسية أو ٢ سداسية أعضاء تكوين الحلقة تحتوي على ذرة كبريت.

(٦) المركب الموصوف في (٢)، حيث تمثل R^f مجموعة فنيل أو مجموعة بنزوثينيل أو مجموعة ١-مethyl-١-(٢-بيريديل ثيو) مثيل.

(٧) المركب الموصوف في (٢)، حيث تمثل R^f مجموعة فنيل.

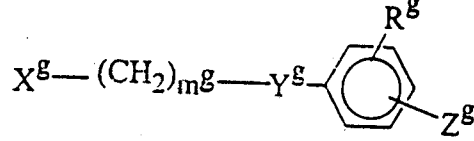
(٨) المركب الموصوف في (٢)، حيث تمثل R^f مجموعة وفق الصيغة (١٦) التالية :



سابعا : يصف طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ٧-٣٣٠.٧٢٨ أو نشرة البراءات الأوروبية رقم ٦٧٦٣٩٨ ما يلي :

(١) مركب حلقي مخطط وفق الصيغة (٧) التالية :

(٧)



حيث :

تمثل X^g مجموعة اندول حلقية أو اندولين حلقية أو ازاندول حلقية أو ازاندولين حلقية
 ٥ أو إيميدازوبيريدين حلقية أو إيميدازوبيريدين حلقية تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣
 بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البديل δ المعرف في أدناه.
 وتمثل Y^g ذرة أكسجين أو ذرة كبريت.

وتمثل Z^g مجموعة ٤،٢-ثاني أوكسوإيازوليدينيدينيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني
 أوكسوإيازوليدينيدينيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني أوكسوإوكسازوليدينيدينيل (٥)-مثيل أو ٥،٣-ثاني
 ١٠ أوكسوإوكسانثينيدينيل (٢)-مثيل أو N -هيدروكسي يوريدومثيل.

وتمثل R^g ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة
 تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة
 السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين، أو مجموعة هيدروكسي أو
 مجموعة نيترو أو مجموعة أمينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من
 المجموعة التي تشتمل على البدائل ϵ ، المعرفة في أدناه، أو مجموعة ألكيل مستقيمة
 ١٥ السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون.

ويمثل البديل ϵ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي
 من ١ إلى ٨ ذرات كربون، أو مجموعة ألكيل تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرات كربون، أو
 مجموعة أريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون، أو مجموعة أسيل اليفاتية مستقيمة
 ٢٠ السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ١١ ذرة كربون، أو مجموعة أسيل عطرية
 اليفاتية تحتوي من ٨ إلى ١٢ ذرة كربون أو مجموعة أسيل عطرية تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة
 كربون.

وتمثل m^g عددا صحيحا من ١ إلى ٥.

ويمثل البديل δ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خيلوكسي أو مجموعة فنيل ثيو أو مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة نيترو أو مجموعة امينو تخلص من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ε ، المعرفة أعلاه، أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلص من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل φ ، أو مجموعة اركيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون تخلص من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل φ .

ويمثل البديل φ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة نيترو أو مجموعة فنيل أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة امينو تخلص من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ε ، المعرفة أعلاه؛ واملحها المقبولة صيدليا.

وبالنسبة لمركبات الصيغة (٧)، فقد وصفت تفاصيل مثل تعاريف R^8 و X^8 و Y^8 و m^8 و Z^8 والبدائل δ و ε و φ ، وأنواع الملح المقبول صيدليا، وعملية تحضير مركبات الصيغة ٢٠ (٧)، وامثلة على المركبات وامثلة على التحضير، في طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ٧-٣٣٠٧٢٨ أو نشرة البراءات الاوروبية رقم ٦٧٦٢٩٨، والتي ادمجت محتوياتها في هذا البيان كمرجع.

وعلى سبيل المثال، عندما يمثل R^8 أو البديل δ أو البديل φ مجموعة الكيل أو الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، فانها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج امثلتها

أعلاه بالنسبة للبديل χ . وعندما تمثل R^8 أو البديل ε مجموعة أراكيل، فإنها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج أمثلتها أعلاه بالنسبة لـ R^{1d} . وعندما يمثل البديل δ مجموعة الكيل ثيو، فإنها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج أمثلتها أعلاه بالنسبة لـ W^{2c} . وعندما يمثل البديل δ أو البديل ε مجموعة أريل، فإنها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج أمثلتها أعلاه بالنسبة لـ R^{1d} . وعندما

٥ يمثل البديل ε مجموعة أسيل اليفاتية مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ١١ ذرة كربون، أو مجموعة أسيل عطرية اليفاتية تحتوي من ٨ إلى ١٢ ذرة كربون، أو مجموعة أسيل عطرية تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون، فإنها قد تختار من المجموعة المماثلة المعرفة والمذكورة أمثلتها أعلاه بالنسبة لـ R^{1d} .

وتشمل الأمثلة المفضلة لمركبات الصيغة (٧) ما يلي :

- ١٠ (٢) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل X^8 مجموعة اندول حلقية أو اندولين حلقية أو إذا اندول حلقية أو إيميدازوبيريدين حلقية أو إيميدازوبيريدين حلقية والتي تخلق من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تحتوي على البدائل δ ، المعرفة أدناه.
- ويمثل البديل δ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة ١٥ تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خلاتوكسي أو مجموعة فنيل ثيو أو مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة نيترو أو مجموعة أمينو تخلق من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ε ، المعرفة أدناه، أو مجموعة أريل تحتوي من ٦ إلى ١٠
- ٢٠ ذرات كربون تخلق من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل φ ، المعرفة أدناه، أو مجموعة أراكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون تخلق من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل φ المعرفة أدناه.

ويمثل البديل φ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة نيترو أو مجموعة فنيل أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة امينو تخلص من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ε ، المعرفة أدناه؛

٥ ويمثل البديل ε المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون، أو مجموعة االكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون، أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون أو مجموعة اسيل اليفاتية مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ١١ ذرة كربون، أو مجموعة اسيل عطرية اليفاتية تحتوي من ٨ إلى ١٢ ذرة كربون أو مجموعة اسيل عطرية ١٠ تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون.

(٣) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل X^B مجموعة اندول حلقية أو اندولين حلقية أو ايميدازوبيريدين حلقية أو ايميدازوبيريدين حلقية والتي تخلص من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تحتوي على البدائل δ ، المعرفة أدناه.

ويمثل البديل δ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خيلوكسي أو مجموعة فنيل ثيو أو مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة نيترو أو مجموعة امين تخلص من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ε ، المعرفة أدناه، أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلص من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل φ ، المعرفة أدناه، أو مجموعة االكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون تخلص من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل φ المعرفة أدناه.

ويمثل البديل φ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة نيترو أو مجموعة فنيل أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة امينو تخلص من البدائل أو بها ٥ بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ε ، المعرفة أدناه؛

ويمثل البديل ε المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون، أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون، أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون أو مجموعة اسيل اليفاتية مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ١١ ذرة كربون، أو ١٠ مجموعة اسيل اليفاتية عطرية تحتوي من ٨ إلى ١٢ ذرة كربون أو مجموعة اسيل عطرية تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون.

(٤) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل X^8 مجموعة اندول حلقية أو اندولين حلقية أو ايميدازوبيريبيدين حلقية والتي تخلص من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تحتوي على البدائل δ ، المعرفة أدناه.

١٥ ويمثل البديل δ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خيلوكسي أو مجموعة فنيل ثيو أو مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو ٢٠ مجموعة نيترو أو مجموعة امينو تخلص من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ε ، المعرفة أدناه، أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلص من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل φ ، المعرفة أدناه، أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة

تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون والتي تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل φ المعرفة أدناه.

ويمثل البديل φ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة نيترو أو مجموعة فنيل أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة امينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ε ، المعرفة أدناه؛

ويمثل البديل ε المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون، أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون، أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون أو مجموعة اسيل اليفاتية مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ١١ ذرة كربون، أو مجموعة اسيل عطرية اليفاتية تحتوي من ٨ إلى ١٢ ذرة كربون أو مجموعة اسيل عطرية تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون.

(٥) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل X^8 مجموعة اندولين حلقية أو ايميدازوبيريديدين حلقية والتي تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تحتوي على البدائل δ ، المعرفة أدناه.

ويمثل البديل δ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة هالوجين أو مجموعة فنيل γ أو مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة فنيل.

(٦) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل X^8 مجموعة ايميدازوبيريديدين حلقية والتي تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تحتوي على البدائل δ ، المعرفة أدناه.

ويمثل بديل δ المذكور مجموعة مثيل أو اثيل أو ايزوبروبيل أو ميثوكسي أو اثوكسي أو بروبوكسي أو ايزوبروبوكسي أو بنزيلوكسي أو ذرة فلور أو ذرة كلور أو مجموعة فنييل ثيو أو اثيل ثيو أو فنييل.

(٧) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل R^8 ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو ذرة هالوجين. (٨) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل R^8 ذرة هالوجين أو مجموعة ميثوكسي أو مجموعة اثوكسي أو ذرة فلور أو ذرة كلور.

(٩) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل R^8 ذرة هيدروجين أو مجموعة ميثوكسي.

١٠ (١٠) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل R^8 ذرة هيدروجين.

(١١) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل Y^8 ذرة اكسجين.

(١٢) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل Z^8 مجموعة ٢،٤-ثاني اوكسو ثيازوليدينيلاينيل (٥)-مثيل، أو ٢،٤-ثاني اوكسو ثيازوليدينيلاينيل (٥)-مثيل، أو ٢،٤-ثاني اوكسو اوكسازوليدينيلاينيل (٥)-مثيل.

١٥ (١٣) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل Z^8 مجموعة ٢،٤-ثاني اوكسو ثيازوليدينيلاينيل (٥)-مثيل، أو ٢،٤-ثاني اوكسو ثيازوليدينيلاينيل (٥)-مثيل.

(١٤) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل Z^8 مجموعة ٢،٤-ثاني اوكسو ثيازوليدينيلاينيل (٥)-مثيل.

(١٥) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

٢٠ تمثل X^8 مجموعة اندول حلقية أو اندولين حلقية أو ازاندول حلقية أو ايميدازوبيريدين

حلقية أو ايميدازوبيريدين حلقية والتي تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل δ المعرفة في أدناه.

وتمثل Y^8 ذرة اكسجين أو ذرة كبريت.

وتمثل Z^8 مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسوثيريازوليدينيدينيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسوثيريازوليدينيدينيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسو اوكسا زوليدينيدينيل (٥)-مثيل أو ٥،٣-ثاني اوكسو اوكسا ثاني زوليدينيدينيل (٢)-مثيل أو N -هيدروكسي يوريدومثيل.

وتمثل R^8 ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة

٥ تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين.

وتمثل m^8 عددا صحيحا من ١ إلى ٥.

ويمثل البديل δ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة ١٠ تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خيلوكسي أو مجموعة فنيل ثيو أو مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة نيترو أو مجموعة امينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ε ، المعرفة أدناه، أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ١٥ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل φ ، المعرفة أدناه، أو مجموعة اركيل مستقيمة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل φ ، المعرفة أدناه.

ويمثل البديل φ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي ٢٠ من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة نيترو أو مجموعة فنيل أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة امينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ε ، المعرفة أدناه؛

ويمثل البديل ε المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون، أو مجموعة االكيل تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون، أو مجموعة اريل تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو مجموعة اسيل اليفاتية مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ١١ ذرة كربون، أو مجموعة اسيل عطرية اليفاتية تحتوي من ٨ إلى ١٢ ذرة كربون أو مجموعة اسيل عطرية تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون.

(١٦) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

تمثل X^8 مجموعة اندول حلقية أو اندولين حلقية أو ايميدازوبيريدين حلقية أو ايميدازو بيريميدين حلقية والتي تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي ١٠. تشتمل على البدائل δ المعرفة في أدناه.

وتمثل Y^8 ذرة اكسجين.

وتمثل Z^8 مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسو ثيازوليدينيليدنيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسو ثيازوليدينيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسو اوكسازوليدينيل (٥)-مثيل.

وتمثل R^8 ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة ١٥ تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين. وتمثل m^8 عددا صحيحا من ١ إلى ٥.

ويمثل البديل δ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة ٢٠ تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خيلوكسي أو مجموعة فنيل ثيو أو مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة نيترو أو مجموعة امينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ε ، المعرفة أدناه، أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠

ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل φ ، المعرفة أدناه، أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل φ ، المعرفة أدناه.

٥ ويمثل البديل ε المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون، أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون، أو مجموعة أريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون، أو مجموعة أسيل اليفاتية مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٨ إلى ١٢ ذرة كربون، أو مجموعة أسيل عطرية تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون.

١٠ ويمثل البديل φ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة نيترو أو مجموعة فنيل أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة أمينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ε ، المعرفة أعلاه؛

١٥ (١٧) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

تمثل X^8 مجموعة اندول حلقية أو اندولين حلقية أو إيميدازوبيريدين حلقية أو إيميدازو بيريميدين حلقية والتي تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل δ المعرفة في أدناه.

وتمثل Y^8 ذرة أكسجين.

٢٠ وتمثل Z^8 مجموعة ٤،٢-ثاني أوكسو ثيازوليدينيلايدنيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني أوكسو ثيازوليدينيلايدنيل (٥)-مثيل.

وتمثل R^8 ذرة هيدروجين أو مجموعة ميثوكسي أو مجموعة إيثوكسي أو ذرة فلور أو ذرة كلور.

وتمثل m^8 عددا صحيحا من ١ إلى ٥.

ويمثل البديل δ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خيلوكسي أو مجموعة فنيل ثيو أو مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة نيترو أو مجموعة امينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ϵ ، المعرفة أدناه، أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ϕ ، المعرفة أدناه، أو مجموعة اركيل مستقيمة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ϕ ، المعرفة أدناه.

ويمثل البديل ϵ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون، أو مجموعة اركيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرات كربون، أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون، أو مجموعة اسيل اليفاتية مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ١١ ذرة كربون، أو مجموعة اسيل عطرية اليفاتية تحتوي من ٨ إلى ١٢ ذرة كربون أو مجموعة اسيل عطرية تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون.

ويمثل البديل ϕ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة نيترو أو مجموعة فنيل أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة امينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ϵ ، المعرفة أعلاه؛

(١٨) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

تمثل X^8 مجموعة أو اندولين حلقية أو إيميدازوبيريدين حلقية والتي تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل δ المعرفة في أدناه. وتمثل Y^8 ذرة أكسجين.

وتمثل Z^8 مجموعة ٢، ٤-ثاني أوكسو ثيازوليدينيل (٥)-مثيل.

وتمثل R^8 ذرة هيدروجين أو مجموعة ميثوكسي. ٥

وتمثل m^8 عددا صحيحا من ١ إلى ٥.

ويمثل البديل δ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة هالوجين أو مجموعة فنيل ١. ثيو أو مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة فنيل.

(١٩) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

تمثل X^8 مجموعة إيميدازوبيريدين حلقية تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل δ المعرفة في أدناه.

وتمثل Y^8 ذرة أكسجين. ١٥

وتمثل Z^8 مجموعة ٢، ٤-ثاني أوكسو ثيازوليدينيل (٥)-مثيل.

وتمثل R^8 ذرة هيدروجين.

وتمثل m^8 عددا صحيحا من ١ إلى ٥.

وتمثل البديل δ المذكور مجموعة مثيل أو مجموعة اثيل أو مجموعة إيزوبروبيل أو ٢. مجموعة ميثوكسي أو مجموعة ايثوكسي أو مجموعة بروموكسي أو مجموعة إيزوبروبوكسي أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة فلور أو ذرة كلور أو مجموعة فنيل ثيو أو مجموعة مثيل ثيو أو مجموعة اثيل ثيو أو مجموعة فنيل.

(٢٠) المركبات الموصوفة في (١) والتي تختار من المركبات التالية :

١) ٥-٤-٣-مئيل ايميدازو [b-٥،٤] بيريدينيل (٢-مئوكسي) بنزيل {ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

ب) ٥-٤-٣-مئيل ايميدازو [b-٥،٤] بيريدينيل (٢-مئوكسي) بنزيل {ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

٥ ج) ٥-٤-٣-مئيل ايميدازو [b-٥،٤] بيريدينيل (٢-مئوكسي) بنزيل {ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

د) ٥-٤-٣-مئيل ايميدازو [b-٥،٤] بيريدينيل (٢-مئوكسي) بنزيل {ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

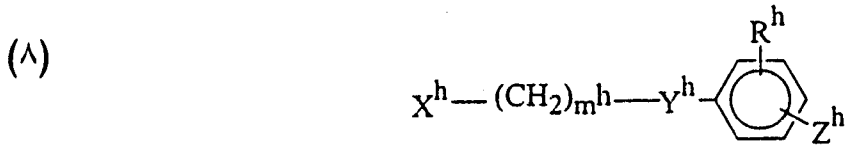
هـ) ٥-٤-٣-مئيل ايميدازو [b-٥،٤] بيريدينيل (٢-مئوكسي) بنزيل {١٠ ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

و) ٥-٤-٣-مئيل ايميدازو [b-٥،٤] بيريدينيل (٢-مئوكسي) بنزيل {ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

ز) ٥-٤-١-مئيل اندولينيل (٢-مئوكسي) بنزيل {ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

ثامنا : تصف نشرة البراءات الاوروبية رقم ٧٤٥١٠٠ مايلى :

١٥ (١) مركب حلقي مخطط منصهر وفق الصيغة (٨) التالية :



حيث :

تمثل X^h مجموعة بنزو ايميدازول حلقيه تملو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل

تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل γ المعروفة في أدناه.

٢٠ وتمثل Y^h ذرة اكسجين أو ذرة كبريت.

وتمثل Z^h مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسو ثيازوليدينيلايدنيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسو ثيازوليدينيلايدنيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسو اوكسازوليدينيلايدنيل (٥)-مثيل أو ٥،٣-ثاني اوكسو اوكسا ثاني زوليدينيلايدنيل (٢)-مثيل أو N -هيدروكسي يوريدومثيل.

وتمثل R^h ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة ٥ تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين، أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة امينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل η ، المعرفة في أدناه، أو مجموعة االكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون.

١٠. ويمثل m^h عددا صحيحا من ١ الى ٥.

ويمثل البديل γ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خلاتوكسي أو مجموعة فنيل ثيو أو مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة نيترو أو مجموعة امينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل η ، المعرفة أدناه، أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل λ ، المعرفة أدناه، أو مجموعة االكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل λ ، المعرفة أدناه.

ويمثل البديل η المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون، أو مجموعة االكيل تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرات كربون، أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون، أو مجموعة اسيل اليفاتية مستقيمة

السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ١١ ذرة كربون، أو مجموعة اسيل عطرية اليقاتية تحتوي من ٨ إلى ١٢ ذرة كربون أو مجموعة اسيل عطرية تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون.

ويمثل البديل λ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة نيترو أو مجموعة فنييل أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة امينو تخلص من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل η ، المعرفة أعلاه؛ واملحها المقبولة صيدليا.

١٠. وبالنسبة لمركبات الصيغة (٨)، فقد وصفت تفاصيل مثل تعاريف R^h و X^h و Y^h و Z^h والبدائل γ و η و λ و m^h وأنواع الملح المقبول صيدليا، وعملية تحضير مركبات الصيغة (٨)، وامثلة على المركبات وامثلة على التحضير، في نشرة البراءات الاوروبية رقم ٧٤٥٦٠٠، والتي ادمجت محتوياتها في هذا البيان كمرجع.

وعندما يمثل R^h أو البديل γ أو البديل λ مجموعة الكيل أو الكوكسي فانها تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، وقد تكون أي من المجاميع المناظرة المعرفة والمذكورة امثلتها أعلاه بالنسبة للبديل χ . وعندما تمثل R^h أو البديل γ أو البديل η مجموعة االكيل، فانها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج امثلتها أعلاه بالنسبة لـ R^{1d} . وعندما يمثل البديل γ أو البديل η ذرة هالوجين، فانها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج امثلتها أعلاه بالنسبة للبديل χ . وعندما يمثل البديل γ مجموعة الكيل ثيو، فانها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج امثلتها أعلاه بالنسبة لـ W^{2c} . وعندما يمثل البديل γ مجموعة اريل، فانها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج امثلتها أعلاه بالنسبة لـ R^{1d} . وعندما يمثل البديل η مجموعة اسيل اليقاتية مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ١١ ذرة كربون، أو مجموعة اسيل عطرية اليقاتية تحتوي من ٨ إلى ١٢ ذرة كربون أو مجموعة اسيل عطرية تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون، فانها قد تختار من المجاميع المماثلة المعرفة والمذكورة امثلتها أعلاه بالنسبة لـ R^{1d} .

وعندما يمثل البديل η مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون، فإنها قد تكون مجموعة مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة، وتشمل أمثلتها مجاميع المثلث والاثني والبروبيل والايزوبروبيل والبوتيل والايزوبوتيل والبوتيل الثانوي والبوتيل الثلاثي والبنثيل والايزوبنتيل والنيوبنتيل و٢-مثيل بوتيل و١-اثيل بروبييل والهكسيل و٤-مثيل بنتيل و٣-مثيل بنتيل و٢-مثيل بنتيل و١-مثيل بنتيل و٣،٣-ثاني مثيل بوتيل و٢،٢-ثاني مثيل بوتيل و١،١-ثاني مثيل بوتيل و٢،١-ثاني مثيل بوتيل و٣،١-ثاني مثيل بوتيل و٣،٢-ثاني مثيل بوتيل و٢-اثيل بوتيل والهبتيل والاوكتيل. وتفضل منها مجاميع الالكيل التي تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، وعلى الأخص مجاميع المثلث والاثني والبروبيل والايزوبروبيل والبوتيل والايزوبوتيل، والأفضل على الإطلاق مجموعة المثلث.

١٠. وتشمل الامثلة المفضلة لمركبات الصيغة (٨) مايلى :

(٢) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل R^h ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو ذرة هالوجين.

(٣) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل Y^h ذرة اكسجين.

١٥ (٤) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل Z^h مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسوثيرازوليدينيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسوثيرازوليدينيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسو اوكسازوليدينيل (٥)-مثيل.

(٥) المركب الموصوف في (١)، حيث :

تمثل R^h ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو ذرة هالوجين.

وتمثل Y^h ذرة اكسجين.

وتمثل Z^h مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسوثيرازوليدينيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسو اوكسازوليدينيل (٥)-مثيل.

- (٦) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل Z^h مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسوثيريازوليدينيل (٥)-
 مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسوثيريازوليدينيل (٥)-مثيل.
- (٧) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل R^h ذرة هيدروجين أو مجموعة مثيل أو مجموعة
 ميثوكسي أو مجموعة اثوكسي أو ذرة فلور أو ذرة كلور.
- ٥ (٨) المركب الموصوف في (١)، حيث يمثل m^h عددا صحيحا من ١ إلى ٥.
- (٩) المركب الموصوف في (١)، حيث :
 تمثل Y^h ذرة اكسجين.
- وتمثل Z^h مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسوثيريازوليدينيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني
 اوكسوثيريازوليدينيل (٥)-مثيل.
- ١٠ وتمثل R^h ذرة هيدروجين أو مجموعة مثيل أو مجموعة ميثوكسي أو مجموعة اثوكسي
 أو ذرة فلور أو ذرة كلور.
- ويمثل m^h عددا صحيحا من ١ إلى ٣.
- (١٠) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل X^h مجموعة بنزايميدازول حلقية تـخلو من
 البدائل أو بها من ١ إلى ٥ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل γ المعرفة
 ١٥ أدناه.
- ويمثل البديل γ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي
 من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة
 تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة بنزايوكسي أو ذرة هالوجين أو مجموعة بنتيل
 ثيو أو مجموعة الكيل ثيومستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات
 ٢٠ كربون، أو مجموعة ثالث ميثيل ثيو أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خـلـيـوكسي أو
 مجموعة بنزيل أو مجموعة فنيل.
- (١١) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل Z^h مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسو اوكسازوليدينيل
 (٥)-مثيل.

(١٢) المركب الموصوف في (١) حيث تمثل R^h ذرة هيدروجين أو مجموعة مثيل أو مجموعة ميثوكسي.

(١٣) المركب الموصوف في (١)، حيث :

تمثل X^h مجموعة مجموعة بنزايميدازول حلقة تخلص من البدائل أو بها من ١ إلى ٥ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل γ المعرفة أدناه.

ويمثل البديل γ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة هالوجين أو مجموعة فنيل ثيو أو مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات ١٠ كربون، أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خيلوكسي أو مجموعة بنزيل أو مجموعة فنيل.

وتمثل Y^h ذرة اكسجين.

وتمثل Z^h مجموعة ٢، ٤-ثاني اوكسواوكسازوليدينيل (٥)-مثيل.

وتمثل R^h ذرة هيدروجين أو مجموعة مثيل أو مجموعة ميثوكسي.

وتمثل m^h عددا صحيحا من ١ إلى ٣. ١٥

(١٤) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل X^h مجموعة بنزايميدازول حلقة تخلص من البدائل أو بها من ١ إلى ٥ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل γ المعرفة أدناه.

وتمثل البديل γ المذكور مجموعة مثيل أو مجموعة اثيل أو مجموعة ايزوبروبيل أو مجموعة ميثوكسي أو مجموعة ايثوكسي أو مجموعة بروبوكسي أو مجموعة ايزوبروبوكسي أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة فلور أو ذرة كلور أو مجموعة فنيل ثيو أو مجموعة مثيل ثيو أو مجموعة اثيل ثيو أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خيلوكسي أو مجموعة بنزيل أو مجموعة فنيل.

(١٥) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل R^h ذرة هيدروجين.

(١٦) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل m^h العدد ١ أو ٢.

(١٧) المركب الموصوف في (١)، حيث :

تمثل X^h مجموعة بنزايميدازول حلقية تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٥ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل γ المعرفة أدناه.

٥ ويمثل البديل γ المذكور مجموعة مثيل أو مجموعة اثيل أو مجموعة ايزوبروبيل أو مجموعة ميثوكسي أو مجموعة اثوكسي أو مجموعة بروبوكسي أو مجموعة ايزوبروبوكسي أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة فلور أو ذرة كلور أو مجموعة فنيل ثيو أو مجموعة مثيل ثيو أو مجموعة اثيل ثيو أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خيلوكسي أو مجموعة بنزيل أو مجموعة فنيل.

١٠ وتمثل Y^h ذرة اكسجين.

وتمثل Z^h مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسوثيا زوليدينيل (٥)-مثيل.

وتمثل R^h ذرة هيدروجين.

وتمثل m^h العدد ١ أو ٢.

(١٨) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل X^h مجموعة بنزايميدازول حلقية تخلو من ١٥ البدائل أو بها من ١ إلى ٥ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل γ المعرفة أدناه.

ويمثل البديل γ المذكور مجموعة مثيل أو مجموعة ميثوكسي أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خيلوكسي أو مجموعة بنزيل.

(١٩) المركب الموصوف في (١)، حيث تمثل m^h العدد ١.

٢٠ (٢٠) المركب الموصوف في (١)، حيث :

تمثل X^h مجموعة بنزايميدازول حلقية تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٥ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل γ المعرفة أدناه.

ويمثل البديل γ المذكور مجموعة مثيل أو مجموعة ميثوكسي أو مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خيلوكسي أو مجموعة بنزيل.

وتمثل Y^h ذرة اكسجين.

وتمثل Z^h مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسو ثيازوليدينيل (٥)-مثيل.

وتمثل R^h ذرة هيدروجين.

وتمثل m^h العدد ١.

٥ (٢١) المركبات الموصوفة في (١) والتي تختار من المركبات التالية :

- أ { ٥-٤-١-مثيل بنزايميدازوليل (٢)-مثوكسي) بنزيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
 ب { ٥-٤-٦-مثوكسي-١-مثيل بنزايميدازوليل (٢)-مثوكسي) بنزيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون (والذي يدعى لاحقاً في هذا البيان " المركب ب ").
 ج { ٥-٤-٥-مثوكسي-١-مثيل بنزايميدازوليل (٢)-مثوكسي) بنزيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

د { ٥-٤-١-بنزيل بنزايميدازوليل (٥)-مثوكسي) بنزيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

هـ { ٥-٤-٥-هيدروكسي-١-٧،٦،٤،١-رابع مثيل بنزايميدازوليل (٢)-مثوكسي) بنزيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

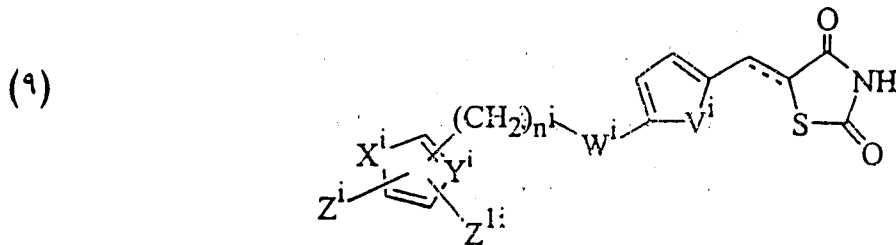
و { ٥-٤-٥-خليوكسي-١-٧،٦،٤،١-رابع مثيل بنزايميدازوليل (٢)-مثوكسي) بنزيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

١٥ ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

تاسعا- يصف طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ١-٢٧٢٥٧٤ ونشرة البراءات الاوروبية

رقم ٣٣٢٣٣٢ ما يلي :

(١) مركب وفق الصيغة (٩) التالية :



٢٠. حيث :

تمثل --- رابطة أحادية أو مزدوجة.

وتمثل V^i مجموعة وفق الصيغة $-CH=CH-$ أو $-N=CH-$ أو $-CH=N-$ أو ذرة كبريت.

وتمثل W^i مجموعة وفق الصيغة $CH_2 >$ أو $CHOH >$ أو $CO >$ أو $C=NOR^i >$ أو $-$.

$CH=CH-$

وتمثل X^i ذرة كبريت أو أكسجين أو مجموعة وفق الصيغة $NR^{ii} >$ أو $-CH=N-$.

٥ أو $-N=CH-$

وتمثل Y^i مجموعة وفق الصيغة $=CH-$ أو ذرة نيتروجين.

وتمثل Z^i ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٧ ذرات كربون أو مجموعة الكيل حلقي تحتوي من ٣ إلى ٧ ذرات كربون أو مجموعة فنيل أو مجموعة نفطيل أو مجموعة بيريديل أو مجموعة فوريل أو مجموعة ثينيل أو مجموعة فنيل بها بديل واحد أو ١. بديلين تختار من المجموعة التي تشتمل على مجاميع الكيل تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون أو مجاميع ثالث فلورومثيل أو مجاميع الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون أو ذرات فلور أو ذرات كلور أو ذرات بروم.

وتمثل Z^{ii} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون.

وتمثل R^i و R^{ii} ، بشكل مستقل، ذرة هيدروجين أو مجموعة مثيل.

١٥ وتمثل n^i ١ أو ٢ أو ٣؛

واملاحها المقبولة صيدليا.

وبالنسبة لمركبات الصيغة (٩)، فقد وصفت تفاصيل مثل تعاريف V^i و W^i و X^i و Y^i و Z^i و Z^{ii} و R^i و R^{ii} و n^i وأنواع الملح المقبول صيدليا، وعملية تحضير مركبات الصيغة (٩)، وامثلة على المركبات وامثلة على التحضير، في طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم هيه ٢٠١٢-٢٧٢٥٧٤ ونشرة البراءات الاوروبية رقم ٣٣٣١٣٣٢، والتي ادمجت محتوياتها في هذا البيان كمرجع.

وعلى سبيل المثال، عندما تمثل Z^i مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٧ ذرات كربون أو عندما تمثل Z^{ii} أو البديل على مجموعة الفينيل الممثلة بـ Z^i مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون، فانها قد تختار من المجاميع المناظرة المعرفة والمذكورة امثلتها أعلاه

بالنسبة للبدايل ١١. وعندما تمثل Z^i مجموعة الكيل، حلقي تحتوي من ٣ إلى ٧ ذرات كربون، فانها قد تكون مجموعة بروبييل حلقي أو بوتيل حلقي أو بنتيل حلقي أو هكسيل حلقي أو هبتيل حلقي. وتشمل الامثلة المفضلة لمركبات الصيغة (٩) ما يلي :

(٢) المركبات الموصوفة في (١)، حيث لا يكون الخط المتقطع رابطة، وتمثل W^i مجموعة وفق الصيغة $CO >$ أو $CHOH >$.

(٣) المركبات الموصوفة في (٢)، حيث تمثل V^i مجموعة وفق الصيغة - $CH=CH-$ أو $-CH=N-$ أو ذرة كبريت، وتمثل n^i العدد ٢.

(٤) المركبات الموصوفة في (٣)، حيث تمثل X^i ذرة اكسجين، وتمثل Y^i ذرة نيتروجين تشكل مجموعة أو كسازوليل (٤)، وتمثل Z^i مجموعة (٢-ثينيل) أو (٢-فوريل) فنيل أو ١. مجموعة فنيل أو نفطيل بها بدائل، وتمثل Z^i مجموعة ٥-مثيل.

(٥) المركبات الموصوفة في (٤)، حيث تمثل V^i مجموعة وفق الصيغة $-CH=N-$ أو ذرة كبريت، وتمثل Z^i مجموعة ٢-فنيل.

(٦) المركبات الموصوفة في (١)، حيث تمثل V^i مجموعة وفق الصيغة $-CH=CH-$ ، وتمثل W^i مجموعة وفق الصيغة $CO >$ ، وتمثل Z^i مجموعة ٢-(٢-فوريل) أو ٢-فنيل أو ٢-(٤-مثيل فنيل) أو ٢-(٢-نفطيل).

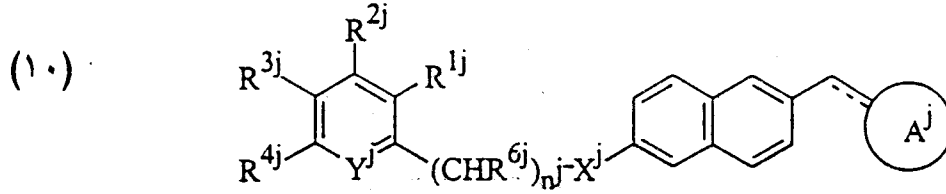
(٧) المركبات الموصوفة في (٣)، حيث تمثل X^i ذرة اكسجين أو كبريت، وتمثل Y^i ذرة نيتروجين تشكل مجموعة أو كسازوليل (٥) أو ثيازوليل (٤) أو ثيازوليل (٥).

(٨) المركبات الموصوفة في (٣)، حيث تمثل X^i مجموعة وفق الصيغة $-CH=N-$ ، وتمثل Y^i شق CH الذي يشكل بيريديل (٢)، أو تمثل X^i ذرة اكسجين، وتمثل Y^i شق CH الذي يشكل ٢. مجموعة فوريل (٢).

(٩) المركب الموصوف في (١) والذي يكون ٥-{٤-٣-(٥-مثيل-٢-فنيل او كسازوليل (٤))} بروبيونيل [بنزيل] ثيازوليدين-٢، ٤، ٥-ديون.

عاشرا : يصف طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم ٦-٢٤٧٩٤٥ ونشرة البراءات الاوروبية رقم ٦٠٤٩٨٣ ما يلي :

(١) مشتق نفطالين وفق الصيغة (١٠) التالية :

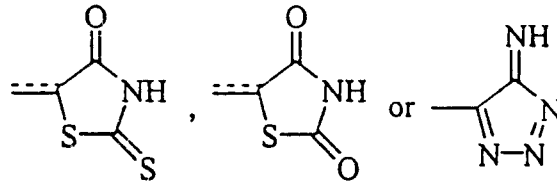


حيث :

تمثل



مجموعة وفق الصيغة



وتمثل X^j - ذرة اكسجين أو كبريت.

وتمثل $Y^j = N$ - شق أو مجموعة وفق الصيغة $=CR^{5j}$.

- ١٠ وتمثل R^{1j} و R^{2j} و R^{3j} و R^{4j} و R^{5j} ، بشكل مستقل، ذرة هيدروجين أو ذرة هالوجين أو مجموعة الكيل أو مجموعة اريل أو مجموعة الكوكسي أو مجموعة الكوكسي الكوكسي أو مجموعة اريلوكسي أو مجموعة الكانويلوكسي أو مجموعة اريل كربونيلوكسي أو مجموعة كربونيل أو مجموعة الكوكسي كربونيل أو مجموعة اريلوكسي كربونيل أو مجموعة كربامويل أو مجموعة الكيل امينو كربونيل أو مجموعة اريل امينوكربونيل أو مجموعة امينو أو مجموعة الكيل امينو أو مجموعة الكانويل امينو أو مجموعة اريل كربونيل امينو أو مجموعة اثيلين ثاني اوكسي مثيل أو مجموعة فورميل أو مجموعة سيانو أو مجموعة نيترو أو مجموعة ثالث هالو مثيل.

وتمثل R^{6j} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل قد تحتوي على بدائل أو مجموعة اريل قد تحتوي على بدائل.

وتمثل n صفراً أو عدداً صحيحاً من ١ إلى ٣.

وقد تمثل --- رابطة أحادية أو مزدوجة؛

٥ واملأها المقبولة صيدلياً.

وبالنسبة لمركبات الصيغة (١٠)، فقد وصفت تفاصيل مثل تعاريف A^i و X^i و Y^i و R^{1j} و R^{2j} و R^{3j} و R^{4j} و R^{5j} و R^{6j} و n وأنواع الملح المقبول صيدلياً، وعملية تحضير مركبات الصيغة (١٠)، وأمثلة على المركبات وأمثلة على التحضير، في طلب البراءة اليابانية كوكاي رقم ٦-٢٤٧٩٤٥ ونشرة البراءات الأوروبية رقم ٦٠٤٩٨٣، والتي ادمجت محتوياتها في هذا ١٠ البيان كمرجع.

وعندما تمثل R^{1j} أو R^{2j} أو R^{3j} أو R^{4j} أو R^{5j} ذرة هالوجين أو مجموعة الكيل أو مجموعة اريل أو مجموعة الكوكسي، فإنها قد تكون كما تم تعريفها وإدراج أمثلتها أعلاه بالنسبة للبديل χ أو R^{3c} أو R^{4d} على الترتيب. وعندما تمثل R^{1j} أو R^{2j} أو R^{3j} أو R^{4j} أو R^{5j} مجموعة الكوكسي الكوكسي أو مجموعة اريلوكسي أو مجموعة الكانويوكسي أو مجموعة ١٥ اريل كربونيلوكسي أو مجموعة الكوكسي كربونيل أو مجموعة اريلوكسي كربونيل أو مجموعة الكيل امينوكربونيل أو مجموعة اريل امينوكربونيل أو مجموعة الكانويل امينو أو مجموعة اريل كربونيل امينو، فقد تكون الاجزاء المعنية من هذه المجاميع كما تم تعريفها وإدراج أمثلتها أعلاه.

وعندما تمثل R^{1j} أو R^{2j} أو R^{3j} أو R^{4j} أو R^{5j} مجموعة الكيل امينو، فإنها قد تكون كما ٢٠ تم تعريفها وإدراج أمثلتها أعلاه بالنسبة للبديل χ .

وعندما تمثل R^{1j} أو R^{2j} أو R^{3j} أو R^{4j} أو R^{5j} مجموعة ثالث هالومثيل، فإنها قد تكون مجموعة ثالث فلورومثيل أو ثالث كلورومثيل أو ثالث برومومثيل أو ثالث يودومثيل، ويفضل منها مجموعة ثالث فلورومثيل.

وتشمل الأمثلة المفضلة لمركبات الصيغة (١٠) ما يلي :

(٢) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

يمثل كل من R^{1j} و R^{2j} و R^{3j} و R^{4j} و R^{5j} ، بشكل مستقل، ذرة هيدروجين أو ذرة هالوجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٢ ذرة كربون أو مجموعة الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون أو مجموعة الكوكسي الكوكسي تحتوي من ٢ إلى ٦ ذرات كربون أو مجموعة اريلوكسي تحتوي من ٦ إلى ١٢ ذرة كربون أو مجموعة الكانويلوكسي تحتوي من ٢ إلى ٩ ذرات كربون أو مجموعة اريل كربونيلوكسي تحتوي من ٧ إلى ١٣ ذرة كربون أو مجموعة كربوكسيل أو مجموعة الكوكسي كربونيل تحتوي من ٢ إلى ٩ ذرات كربون أو مجموعة اريلوكسي كربونيل تحتوي من ٧ إلى ١٣ ذرة كربون أو مجموعة كربامويل أو مجموعة الكيل امينو كربونيل تحتوي من ٢ إلى ٩ ذرات كربون أو مجموعة اريل امينو كربونيل تحتوي من ٧ إلى ١٣ ذرة كربون أو مجموعة امينو أو مجموعة الكيل امينو تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون أو مجموعة الكانويل امينو تحتوي من ٢ إلى ٩ ذرات كربون أو مجموعة اريل كربونيل امينو تحتوي من ٧ إلى ١٣ ذرة كربون أو مجموعة اثيلين ثاني اوكسي مثيل أو مجموعة فورميل أو مجموعة سيانو أو مجموعة نيترو أو مجموعة ثالث هالو مثيل.

١٥ وتمثل R^{6j} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على مجاميع الفينيل وذرات الهالوجين ومجاميع النيترو ومجاميع السيانو، أو تشتمل على مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٢ ذرة كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على مجاميع الالكيل التي تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون، وذرات هالوجين ٢٠ ومجاميع نيترو ومجاميع سيانو.

(٣) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

يمثل كل من R^{1j} و R^{2j} و R^{3j} و R^{4j} و R^{5j} ، بشكل مستقل، ذرة هيدروجين أو ذرة هالوجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون أو مجموعة الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون أو مجموعة الكوكسي الكوكسي تحتوي من ٢ إلى ٦ ذرات كربون

أو مجموعة الكانويوكسي تحتوي من ٢ إلى ٩ ذرات كربون أو مجموعة اريل كربونيلوكسي تحتوي من ٧ إلى ١٣ ذرة كربون أو مجموعة كربوكسيل أو مجموعة الكوكسي كربونيل تحتوي من ٢ إلى ٩ ذرات كربون أو مجموعة كربامويل أو مجموعة الكيل امينوكربونيل تحتوي من ٢ إلى ٩ ذرات كربون أو مجموعة اريل امينوكربونيل تحتوي من ٧ إلى ١٣ ذرة كربون أو مجموعة امينو أو مجموعة الكيل امينو تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون أو مجموعة الكانويل امينو تحتوي من ٢ إلى ٩ ذرات كربون أو مجموعة اريل كربونيل امينو تحتوي من ٧ إلى ١٣ ذرة كربون أو مجموعة اثيلين ثاني اوكسي مثيل أو مجموعة فورميل أو مجموعة سيانو أو مجموعة نيترو أو مجموعة ثالث هالومثيل.

وتمثل R^{6j} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون أو ١٠ مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٢ ذرة كربون التي يمكن أن يكون بها بديل من ذرة هالوجين.

(٤) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

تمثل X^i - ذرة اكسجين.

وتمثل Y^i مجموعة وفق الصيغة $=CR^{5j}$.

١٥ ويمثل كل من R^{1j} و R^{2j} و R^{3j} و R^{4j} و R^{5j} ، بشكل مستقل، ذرة هيدروجين أو ذرة هالوجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٥ ذرات كربون أو مجموعة الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٥ ذرات كربون أو مجموعة الكوكسي الكوكسي تحتوي من ٢ إلى ٦ ذرات كربون أو مجموعة الكانويوكسي تحتوي من ٢ إلى ٦ ذرات كربون أو مجموعة كربوكسيل أو مجموعة الكوكسي كربونيل تحتوي من ٢ إلى ٦ ذرات كربون أو مجموعة اريل امينو ٢٠ كربونيل تحتوي من ٧ إلى ١٣ ذرة كربون أو مجموعة امينو أو مجموعة الكانويل امينو تحتوي من ٢ إلى ٦ ذرات كربون أو مجموعة اثيلين ثاني اوكسي مثيل أو مجموعة فورميل أو مجموعة سيانو أو مجموعة نيترو أو مجموعة ثالث هالومثيل.

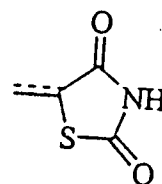
وتمثل R^{6j} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٥ ذرات كربون أو مجموعة أريل تحتوي من ٦ إلى ١٢ ذرة كربون والتي يمكن أن يكون بها بديل من ذرة هالوجين.

(٥) المركبات الموصوفة في (١)، حيث :

٥ تمثل



مجموعة وفق الصيغة



وتمثل X^j - ذرة اكسجين، وتمثل Y^i مجموعة وفق الصيغة $=CR^{5j}$.

١٠ ويمثل كل من R^{1j} و R^{2j} و R^{3j} و R^{4j} ، بشكل مستقل، ذرة هيدروجين أو ذرة هالوجين.

وتمثل R^{5j} ذرة هيدروجين.

وتمثل R^{6j} ذرة هيدروجين.

وتمثل n^i العدد ١.

وتمثل --- رابطة أحادية.

١٥ (٦) المركب الموصوف في (١) الذي يكون ٥- [٦- (٢-فلوروبنزيلوكسي)-٢-نفطيل ميثيل]

ثيازوليدين-٢،٤-ديون.

وعندما يتواجد أي مركب من المركبات وفق الصيغة (١) إلى (١٠) أو ملحه المقبول

صيدليا، على شكل زميرات متنوعة، مثلا على شكل زميرات فراغية اساسها ذرة كربون

لامتناظرة [على سبيل المثال ذرة الكربون في الموقع الثاني من حلقة كرومان أو عند الموقع

٢٠ الخامس من حلقة ثيازوليدين لمركبات الصيغة (١) بصفتها ذرة كربون لامتناظرة]، أو زميرات

فراغية اساسها ذرة كربون لامتناظرة من هذا القبيل ومخاليط منها باية نسبة منها ممثلة كلها بنفس الصيغة. وعلى هذا الاساس فان الاختراع الراهن يشمل كل تلك الزميرات ومخاليطها. وعلى سبيل المثال، تحتوي حاقة ٤،٢-ثاني اوكسو ثيازوليدينيل (٥)-مثيل على صنوان متنوعة وذلك في كل مركب من مركبات الصيغ (١) إلى (١٠) التي تمثل فيها كل هذه ٥ الصنوان ومخاليطها باية نسبة وبنفس الصيغة. وبذلك، فان الاختراع الراهن يضم كل هذه الزميرات ومخاليطها.

وفي الاختراع الراهن، عندما يشكل أي مركب من مركبات الصيغ (١) إلى (١٠) أو املاحه المقبولة صيدليا مادة متداوبة (مثلا هيدرات)، فانها تكون كذلك مشمولة بالاختراع الراهن. فعلى سبيل المثال، يشكل كل مركب من مركبات الصيغ (١) إلى (١٠) واملاحه ١. المقبولة صيدليا، هيدرات عندما تركه في الهواء أو عند اعادة تبلوره في وجود الماء، حيث يمتص الماء. ويشمل الاختراع الراهن كذلك المتداوبات من هذا القبيل.

كما يشمل الاختراع الراهن أيضا كل اسلاف العقاقير، أي المركبات التي هي عبارة عن مشتقات مركبات الصيغ (١) إلى (١٠) وتتحول تحت الظروف البيولوجية إلى مركبات الصيغ (١) إلى (١٠) أو تتحول إلى املاحها المقبولة صيدليا.

١٥ وتشمل الامثلة المفضلة لمركبات الاختراع الراهن الممثلة بكل صيغة من الصيغ (١) إلى (١٠) ما يلي :

(أ) ٥- [٤- (٦-هيدروكسي-٨،٧،٥،٢-رابع مثيل كرومانيل (٢) اثوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤،٢-ديون (عقار تروجليتازون).

(ب) ٥- [٤- (٦-هيدروكسي-٢-مثيل-٧-ثلاثي بوتيل كرومانيل (٢) مئوكسي) بنزيل] ٢. ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

(ج) ٥- [٤- (٦-هيدروكسي-٢-اثيل-٨،٧،٥-ثالث مثيل كرومانيل (٢) مئوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

(د) ٥- [٤- (٦-هيدروكسي-٢-ايزوبوتيل-٨،٧،٥-ثالث مثيل كرومانيل (٢) مئوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

هـ) ٥-٤-٦-خليلوكسي-٨,٧,٥,٢-رابع مئيل كرومانيل (٢) مئوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤,٢-ديون.

و) ٥-٤-٦-اٲوكسي كربونيلوكسي-٨,٧,٥,٢-رابع مئيل كرومانيل (٢) مئوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤,٢-ديون.

٥ ز) ٥-٤-٢-٣-اٲيل-٢-بيريديل) اٲوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤,٢-ديون.

ح) ٥-٤-٢-٤-اٲيل-٢-بيريديل) اٲوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤,٢-ديون.

ط) ٥-٤-٢-٥-اٲيل-٢-بيريديل) اٲوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤,٢-ديون (عقار بيوجليتازون).

ي) ٥-٤-٢-٦-اٲيل-٢-بيريديل) اٲوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤,٢-ديون.

١٠ ك) ٥-٢-٢-٣,٢-ثاني هيدروبنزوفوراني (٥) مئيل] ثيازوليدين-٤,٢-ديون.

ل) ٥-٢-٢-٤,٣-ثاني هيدرو-٢-بنزوبيراني (٦) مئيل] ثيازوليدين-٤,٢-ديون.

م) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٢-بنزوثيازوليل) امينو] اٲوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤,٢-ديون.

ن) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٢-بيريميدينيل) امينو] اٲوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤,٢-ديون.

١٥ س) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٥,٤-ثاني مئيل ثيازوليل (٢) امينو] اٲوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤,٢-ديون.

ع) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٢-ثيازوليل (٢) امينو] اٲوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤,٢-ديون.

ف) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٤-فنييل ثيازوليل (٢) امينو] اٲوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤,٢-ديون.

٢٥ ص) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٤-فنييل-٥-مئيل ثيازوليل (٢) امينو] اٲوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤,٢-ديون.

ق) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٤-مئيل-٥-فنييل ثيازوليل (٢) امينو] اٲوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤,٢-ديون.

ر) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٥-فئيلوكسازوليل ((٢) امينو) ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

ش) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٥،٤-ثاني مئيلوكسازوليل ((٢) امينو) ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

٥ ت) ٥-٤-٢-٢-بيريميدينيل امينو) ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

ث) ٥-٤-٢-N-خليل-N-٢-بيريميدينيل ((٢) امينو) ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

خ) ٥-٤-٢-N-٢-بنزوئيازوليل-N-بنزيل امينو) ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

١٠ ذ) ٥-٤-٣-N-مئيل-N-٢-بنزووكسازوليل امينو) بروبووكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

ض) ٥-٤-٢-N-مئيل-N-٢-بيريديل ((٢) امينو) ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون (العقار روسيجليتازون).

ظ) ٥-٤-٢-١-٤-ثاني فئيليل) ائيليدين امينو اوكسي { ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون ١٥.

غ) ٥-٤-٢-١-٤-فئيل كبريتونيل فئيل) ائيليدين امينو اوكسي { ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

ا) ٥-٤-٢-١-٤-بيريديل ((٢) فئيل) ائيليدين امينو اوكسي { ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

٢٠ اب) ٥-٤-٢-١-٤-بيريديل ((٣) فئيل) ائيليدين امينو اوكسي { ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

اج) ٥-٤-٢-١-٤-بيريديل ((٤) فئيل) ائيليدين امينو اوكسي { ائوكسي { بنزيل } ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

ا (ع) ٥-٤-٥-هيدروكسي-٣-مثيل ايميدازو [b-٥،٤] بيريدينيل (٢) مٲوكسي) بنزيل { ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

اف (ع) ٥-٤-٥-اٲوكسي-٣-مثيل ايميدازو [b-٥،٤] بيريدينيل (٢) مٲوكسي) بنزيل { ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

٥ اص (ع) ٥-٤-٥-ايزوبروبوكسي-٣-مثيل ايميدازو [b-٥،٤] بيريدينيل (٢) مٲوكسي) بنزيل { ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

اق (ع) ٥-٤-٥-١-مثيلين دولينيل (٢) مٲوكسي) بنزيل { ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

ار (ع) ٥-٤-٥-١-مثيل بنزايميدازوليل (٢) مٲوكسي) بنزيل { ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

اش (ع) ٥-٤-٥-٦-مٲوكسي-١-مثيل بنزايميدازوليل (٢) مٲوكسي) بنزيل { ثيازوليدين-٤،٢-١٠ ديون (المركب ب).

ات (ع) ٥-٤-٥-٥-مٲوكسي-١-مثيل بنزايميدازوليل (٢) مٲوكسي) بنزيل { ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

اث (ع) ٥-٤-٥-١-بنزيل بنزايميدازوليل (٥) مٲوكسي) بنزيل { ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

اخ (ع) ٥-٤-٥-٥-هيدروكسي-١،٤،٦،٧-رابع مثيل بنزايميدازوليل (٢) مٲوكسي) بنزيل { ١٥ ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

اذ (ع) ٥-٤-٥-٥-خيلوكسي-١،٤،٦،٧-رابع مثيل بنزايميدازوليل (٢) مٲوكسي) بنزيل { ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

اض (ع) ٥-٤-٥-٣-٥-مثيل-٢-فنييل اوكسازوليل (٤)) بروبيونيل { بنزيل { ثيازوليدين-٤،٢-ديون

٢. اظ (ع) ٥-٦-٢-فلوروبنزيلوكسي)-٢-نفطيل مثيل { ثيازوليدين-٤،٢-ديون؛
واملاحها المقبولة صيدليا.

ومن بين هذه المركبات تفضل المركبات التالية :

ا (ع) ٥-٤-٥-٦-هيدروكسي-٢،٥،٧،٨-رابع مثيل كرومانيل (٢) اٲوكسي) بنزيل { ثيازوليدين-٤،٢-ديون (عقار تروجليتازون).

ب) ٥-٤-٦-خليلوكسي-٨،٧،٥،٢-رابع مئيل كرومانيل (٢) مئوكسي) بنزيل
ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

ج) ٥-٤-٦-اٲوكسي كربونيلوكسي-٨،٧،٥،٢-رابع مئيل كرومانيل (٢) مئوكسي) بنزيل
ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

٥ د) ٥-٤-٢-٥-اٲيل-٢-بيريديل) اٲوكسي) بنزيل} ثيازوليدين-٤،٢-ديون (عقار
بيوجلينازون).

هـ) ٥-٢-٢-بنزيل-٤،٣-ٲاني هيدرو-٢-H-بنزوبيرانييل (٦)) مئيل} ثيازوليدين-٤،٢-ديون
(العقار انجلينازون).

و) ٥-٤-٢-٢-N-مئيل-N-بيريديل (٢) امينو) اٲوكسي) بنزيل} ثيازوليدين-٤،٢-ديون
١٠ (العقار روسيجلينازون).

ز) ٥-٤-٢-١-٤-بيريديل (٢) فنييل) اٲيليدين امينو اوكسي) اٲوكسي) بنزيل} ثيازوليدين-
٤،٢-ديون.

ح) ٤-٤-٢-٢-٢-فنييل-٥-مئيل-٤-اوكسازوليل) اٲوكسي) بنزيل}-٥،٣-ايزوكسازوليدين
ديون.

١٥ ط) ٥-٤-٥-مئوكسي-٣-مئيل ايميدازو [b-٥،٤] بيريدينيل (٢) مئوكسي) بنزيل}
ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

ي) ٥-٤-١-١-مئيلين دولينيل (٢) مئوكسي) بنزيل} ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

ك) ٥-٤-١-١-مئيل بنزايميدازوليل (٢) مئوكسي) بنزيل} ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

ل) ٥-٤-٦-٦-مئوكسي-١-مئيل بنزايميدازوليل (٢) مئوكسي) بنزيل} ثيازوليدين-٤،٢-ديون
٢٠ (المركب ب).

م) ٥-٤-٥-هيدروكسي-٧،٦،٤،١-رابع مئيل بنزايميدازوليل (٢) مئوكسي) بنزيل
ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

ن) ٥-٤-٣-٥-مئيل-٢-فنييل اوكسازوليل (٤)) بروبيونيل} بنزيل} ثيازوليدين-٤،٢-ديون

س) ٥-٦-٢-فلوروبنزيلوكسي)-٢-نفطيل مئيل} ثيازوليدين-٤،٢-ديون؛

واملاحها المقبولة صيدليا.

والمركبات التالية هي الأفضل من بين المركبات أعلاه :

أ) ٥-٤-٦-هيدروكسي-٨،٧،٥،٢-رابع مثيل كروماتيل (٢) اثوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤،٢-ديون (عقار تروجليتازون).

ب) ٥-٤-٢-٥-اثيل-٢-بيريديل) اثوكسي] بنزيل} ثيازوليدين-٤،٢-ديون (عقار بيوجليتازون).

ج) ٥-٤-٢-N-مثيل-N-بيريديل (٢) امينو) اثوكسي] بنزيل} ثيازوليدين-٤،٢-ديون (العقار روسيجليتازون).

د) ٥-٤-٢-١-٤-بيريديل (٢) فنيل) اثيليدين امينو) اثوكسي] بنزيل} ثيازوليدين-٤،٢-ديون (المركب أ).

هـ) ٥-٤-٦-مثوكسي-١-مثيل بنزايميدازوليل (٢) مثوكسي] بنزيل} ثيازوليدين-٤،٢-ديون (المركب ب)؛

واملاحها المقبولة صيدليا.

ويمكن قياس مستوى حمض اليوريك في الدم لمريض ما بأسلوب تقليدي. وعلى وجه التحديد، يؤخذ الدم قبل وبعد الاعطاء لعقار، لفترة محددة سلفا، الى مريض يعاني من فرط حمض اليوريك في الدم ثم يقاس مستوى حمض اليوريك في الدم، مثلا بواسطة طريقة الانزيم المؤكسد لانزيم حمض اليوريك [تتظر مقالة كاجياما في مجلة "الكيمياء الاكلينيكية"، المجلد ٣١، الصفحات ٤٢١-٤٢٦ (١٩٧١)]. وتوفر تجاريا عدة قياس تستخدم الطريقة أعلاه (الاسم التجاري "يوريكولور ٤٠٠"، وهو منتج شركة اونو فارماسيتوكل كو. ليمتد).

٢. ويمكن اعطاء معزز حساسية الانسولين المراد استخدامه في الاختراع الراهن بعدة اشكال. ولا يوجد تحديد معين على شكل الاعطاء، الذي يتحدد بالاعتماد على التركيب بالاضافة الى عمر وجنس المريض وحالته و/أو حدة المرض. فعلى سبيل المثال، لغرض الاعطاء الفموي، يمكن استخدام المركب على شكل قرص أو حبة أو مسحوق أو حبيبات أو عصير أو محلول أو معلق أو مستحلب أو كبسولة. ولغرض الاعطاء بالوريد يمكن استخدام

المركب على شكل حقنة، مع أو بدون الإضافات المستخدمة عادة، مثل الجلوكوز أو حمض اميني. ويمكن، عند الضرورة، اعطاء المركب لوحده بداخل العضل أو بداخل الجلد أو تحت الجلد أو بداخل الصفاق. وعادة يفضل الاعطاء الفموي.

ويمكن تشكيل شتى التراكيب الموصوفة أعلاه باستخدام اضافات مساعدة معروفة ٥ ومستخدمة عادة في هذا المجال، مثل السواغات والمواد الرابطة وعوامل التفتيت والمزلقات وعوامل التدبيب والمواد المعدلة وعوامل التكسية وما شابه.

وبالنسبة لتركيب قرص، يمكن استخدام حوامل شتى معروفة تقليديا في هذا المجال. وتشمل امثلتها السواغات مثل اللاكتوز والسكروز وكلوريد الصوديوم والجلوكوز واليوريا والنشاء وكربونات الكالسيوم والكاؤولين والسليلوز البلوري وحمض السيليسيك؛ والمواد ١٠ الرابطة مثل الماء والاثانول والبروبانول والعصير البسيط ومحلول الجلوكوز ومحلول النشاء ومحلول الجيلاتين وكربوكسي مثيل سليلوز واللثي ومثيل سليلوز وفسفات البوتاسيوم وسكر متعدد فنيل بيروليدون؛ وعوامل تفتيت مثل النشاء الجاف والجيلات الصوديوم ومسحوق الاجار ومسحوق اللاميناران وبيكاربونات الكالسيوم واسترات الحمض الدهني لمتعدد اوكسي اثيلين سوربيتان وكبريتات لاوريل الصوديوم وستياريك اول جليسريد والنشاء واللاكتوز؛ وموانع ١٥ التفتت مثل السكروز والستيارين وزبدة الكاكاو والزيت المهدرج؛ ومعززات الامتصاص مثل قواعد امونيوم رباعية وكبريتات لاوريل الصوديوم؛ وعوامل ترطيب مثل الجليسرين والنشاء؛ ومواد مازة مثل النشاء واللاكتوز والكاؤولين والبنتونايت وحمض السيليسيك الغرواني؛ ومزلاقات مثل الطلق المنقى والستيارات ومسحوق حمض البوريك ومتعدد اثيلين جليكول. ويمكن عند الضرورة تكسية القرص، مثلاً على شكل قرص مكسو بالسكر أو مكسو بالجيلاتين ٢٠ أو مكسو بمواد تذوب في الامعاء أو مكسو بغشاء؛ ويمكن تشكيل القرص على شكل قرص مزدوج الطبقة أو متعدد الطبقات.

ولغرض تشكيل الحبوب، يمكن استخدام شتى الانواع المعروفة من الحوامل، وتشمل امثلتها السواغات مثل الجلوكوز واللاكتوز والنشاء وزيت الكاكاو وزيت نباتي

مهذرج والكاؤولين والطلق؛ ومواد رابطة مثل مسحوق الصمغ العربي ومسحوق صمغ الكثيراء والجيلالين والاثانول؛ وعوامل تقطيت مثل اجار لاميناران.

ولغرض تشكيل التحاميل يمكن استخدام شتى انواع الحوامل المعروفة تقليديا في هذا المجال، وتشمل امثلتها متعدد اثيلين جليكول او زيت الكاكاو او كحولات مرتفعة الوزن الجزيئي او استرات كحولات مرتفعة الوزن الجزيئي او جيلاتين او جليسرين نصف مخلق.

ويفضل، عند تشكيل المركب على شكل حقنة، استخدام محلول معقم متساوي التوتر مع الدم. وعند تشكيل محلول او مستحلب او معلق يمكن استخدام أي مذيب يستخدم تقليديا في هذا المجال. وتشمل الامثلة الماء والكحول الايثيلي وبروبيلين جليكول وكحول ايزوستيارييل اثوكسيل وكحول ايزوستيارييل متعدد اثوكسيل واستر حمض دهني لمتعدد ١٠ اوكسي اثيلين سوربيتان. وفي هذه الحالة يمكن أن يشتمل على كلوريد الصوديوم أو الجلوكوز أو الجليسرين بمقدار كاف لتحضير محلول متساوي التوتر أو إضافة إضافية مساعدة تقليدية لغرض التدويب وعامل دارئ وعامل ملطف وما شابه. وعلاوة على ذلك، يمكن عند الضرورة اضافة مادة ملونة و/أو مادة حافظة و/أو مادة كيميائية معطرة و/أو منكهات و/أو عامل تحلية و/أو دواء آخر.

١٥ ولايوجد تحديد معين على مقدار المركب الفعال الذي ينبغي دمج في المستحضر الصيدلي أعلاه. ويمكن اختيار المقدار بحرية حسب الحاجة، لكن يفضل دمج المركب بمقدار يتراوح من ١ الى ٧٠% بالوزن، ويفضل من ١ الى ٣٠% بالوزن على اساس التركيب الكلي. ويمكن ان تتفاوت جرعة معزز حساسية الانسولين، حسب الاعراض والعمو ووزن الجسم وحالة المريض، بالاضافة الى طريقة الاعطاء وما شابه. وينشد في حالة الاعطاء عن طريق الفم، اعطاء مريض بشري بالغ ما لا يقل عن ٠,١ ملي جرام (ويفضل ١ ملي جرام)، والأفضل ما لايزيد عن ١٠٠٠ ملي جرام (ويفضل ٥٠٠ ملي جرام) في اليوم الواحد، حسب الاعراض. وقد يعطى التركيب في جرعة واحدة أو يقسم الى جرعات. وينشد في حالة الاعطاء عن طريق الوريد، اعطاء مقدار يساوي ٠,٠١ ملي جرام (ويفضل ٠,١ ملي جرام)

كحد أدنى، و ٥٠٠ ملي جرام (ويفضل ٢٠٠ ملي جرام) كحد أعلى للإنسان البالغ في اليوم الواحد، حسب الاعراض. وقد يعطي التركيب في جرعة واحدة أو يقسم الى جرعات. وسوف يوصف الاختراع الراهن بتفصيل اوفى بالرجوع الى المثال التالي الذي يبين فعالية المركبات وفق الاختراع الراهن، وبالرجوع الى امثلة التشكيل اللاحقة.

٥ مثال

حدوث التحسن في حالة فرط حمض اليوريك في الدم

اعطي عن طريق الفم ما مقداره ٢٠٠ ملي جرام من عقار تروجليتازون للشخص الواحد مرتين في اليوم (في الصباح وفي المساء)، الى ٤ مرضى بالغين يعانون من السكري ومن فرط حمض اليوريك في الدم حيث لم يقل عندهم مستوى حمض اليوريك في الدم عن ١٠،٧ ملي جرام/ديسيلتر. واستمرت عملية الاعطاء هذه اربعة اسابيع. وجمع الدم قبل وبعد الاعطاء وقيس مستوى حمض اليوريك في الدم.

ويبين الجدول التالي النتائج.

رقم المريض	السيرة المرضية لداء النقرس بما في ذلك المضاعفات	الاستخدام المصاحب لدواء آخر لعلاج فرط حمض اليوريك في الدم	مستوى حمض اليوريك في الدم (ملي جرام/ديسيلتر)	
			الاسبوع (صفر)	الاسبوع (٤)
١ (ذكر)	لا توجد	لا يوجد	٧,٢	٥,٢
٢ (ذكر)	لا توجد	لا يوجد	٧,٦	٥,٣
٣ (انثى)	لا توجد	لا يوجد	٧,٩	٥,٦
٤ (ذكر)	لا توجد	لا يوجد	٧,٢	٥,٢

وكما يظهر جليا من الجدول أعلاه، فقد نتج عن اعطاء عقار تروجليتازون الى مرضى يعانون من فرط حمض اليوريك في الدم الذي لم يقل مستواه عن ٧,٠ ملي جرام/ديسيلتر، حدوث انخفاض مستوى حمض اليوريك في الدم الى ٦,٠ ملي جرام/ديسيلتر أو أقل من ذلك، وهو ما يعادل المدى الطبيعي.

٥ اختبارات

السمية الحادة

تم قياس السمية الحادة لعقار تروجليتازون بطريقة تقليدية. وعلى وجه التحديد، أعطي عقار عن طريق الفم بمقدار ٣٠٠ مليجرام من العقار/كيلوجرام الى ثلاثة فئران نوع ddY (ذكور)، حيث تمت مراقبتها لمدة ٥ أيام. وقد بقيت كل الفئران على قيد الحياة.

١٠ مثال تشكيل (١)

مساحيق

يمكن الحصول على مساحيق بخلط ٥ جرام من عقار تروجليتازون و ٨٩٥ جرام من اللاكتوز و ١٠٠ جرام من نشاء الذرة في خلاط.

مثال تشكيل (٢)

١٥ حبيبات

يمكن الحصول على حبيبات بخلط ٥ جرام من عقار تروجليتازون و ٨٩٥ جرام من اللاكتوز و ١٠٠ جرام من هيدروكسي بروبيل سليولوز به بديل منخفض الوزن الجزيئي، ويضاف الى الخليط ٣٠٠ جرام من محلول مائي تركيزه ١٠% بالوزن/الحجم من هيدروكسي بروبيل سليولوز ثم يعجن المزيج الناتج وتحبب المادة المعجونة باستخدام جهاز تحبيب بالبتق، ثم يجفف المنتج الحبيبي.

مثال تشكيل (٣)

كبسولات

يمكن الحصول على كبسولات بخلط ٥ جرام من عقار تروجليتازون و ١١٥ جرام من اللاكتوز و ٥٨ جرام من نشاء الذرة و ٢ جرام من ستيارات المغنيسيوم في خلاط على شكل

حرف ٧ ثم تعبئة المزيج الناتج في كبسولات رقم (٣) بمعدل ١٨٠ ملي جرام للكبسولة الواحدة.

مثال تشكيل (٤)

اقراص

٥ يمكن الحصول على اقراص بخلط ٥ جرام من عقار تروجليتازون و ٩٠ جرام من اللاكتوز و ٣٤ جرام من نشاء الذرة و ٢٠ جرام من سليلوز بلوري و ١ جرام من ستيرات المغنيسيوم في خلاط ثم تشكيل اقراص من المزيج الناتج بواسطة ماكينة تشكيل اقراص.

مثال تشكيل (٥)

مساحيق

١٠ يمكن الحصول على مساحيق بخلط ٥ جرام من عقار بيوجليتازون و ٨٩٥ جرام من اللاكتوز و ١٠٠ جرام من نشاء الذرة في خلاط.

مثال تشكيل (٦)

حبيبات

يمكن تحضير حبيبات بخلط ٥ جرام من عقار روسـيجليتازون و ٨٦٥ جرام من اللاكتوز و ١٠٠ جرام من هيدروكسي بروبيل سليلوز به بديل منخفض الوزن الجزيئي، ويضاف الى الخليط ٣٠٠ جرام من محلول مائي تركيزه ١٠% بالوزن/الحجم من هيدروكسي بروبيل سليلوز ثم يعجن المزيج الناتج وتحبب المادة المعجونة باستخدام جهاز تحبيب بالبنق ثم يجفف المنتج الحبيبي.

مثال تشكيل (٧)

٢٠ كبسولات

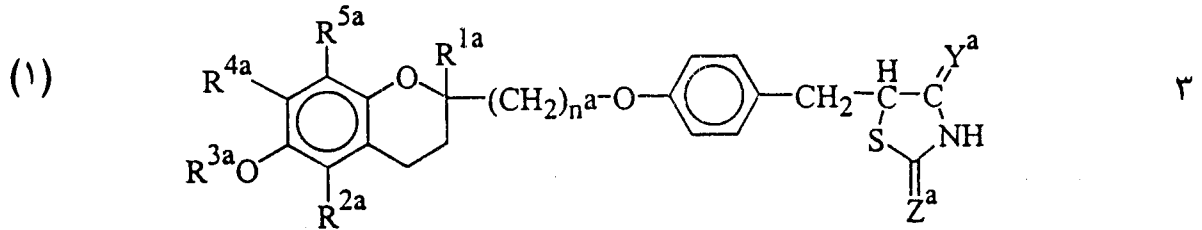
يمكن الحصول على كبسولات بخلط ٥ جرام من المركب (أ) و ١١٥ جرام من اللاكتوز و ٥٨ جرام من نشاء الذرة و ٢ جرام من ستيرات المغنيسيوم في خلاط على شكل حرف ٧ ثم تعبئة المزيج الناتج في كبسولات رقم (٣) بمعدل ١٨٠ ملي جرام للكبسولة الواحدة.

مثال تشكيل (٨)اقراص

يمكن الحصول على اقراص بخلط ٥ جرام من المركب (أ) و ٩٠ جرام من اللاكتوز و ٣٤ جرام من نشاء الذرة و ٢٠ جرام من سليلوز بلوري و ١ جرام من ستيرات المغنيسيوم ٥ في خلط ثم تشكيل اقراص من المزيج الناتج بواسطة ماكينة تشكيل اقراص.

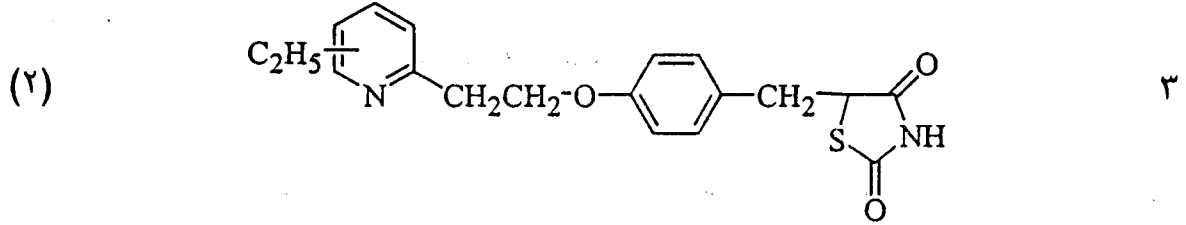
عناصر الحماية

- ١ - استخدام معزز حساسية انسولين لصنع دواء لعلاج فرط حمض اليوريك في الدم أو الوقاية منه. ٢
- ١ -٢ الاستخدام وفق مطلب الحماية (١)، حيث يختار معزز حساسية الانسولين المذكور من المجموعة التي تشتمل على مركبات ثيازوليدين ديون ومركبات إيمينوثيازوليدينون ومركبات ثاني إيمينوثيازوليدين ومركبات ثيوكسوثيرازوليدينون ومركبات إيمينوثالثazol ومركبات أوكسازوليدين ديون ومركبات إيزوكسازوليدين ديون ومركبات أوكسا ثاني أزيدين ديون. ٥
- ١ -٣ الاستخدام وفقاً لمطلب الحماية (١)، حيث يختار معزز حساسية الانسولين المذكور من المجموعة التي تشتمل على مركبات ثيازوليدين ديون ومركبات إيمينوثيازوليدينون ومركبات ثاني إيمينوثيازوليدين. ٣
- ١ -٤ الاستخدام وفقاً لمطلب الحماية (١)، حيث يختار معزز حساسية الانسولين المذكور من المجموعة التي تشتمل على مركبات ثيازوليدين ديون. ٢
- ١ -٥ الاستخدام وفقاً لمطلب الحماية (١)، حيث يكون معزز حساسية الانسولين المذكور مركباً وفق الصيغة (١) التالية : ٢



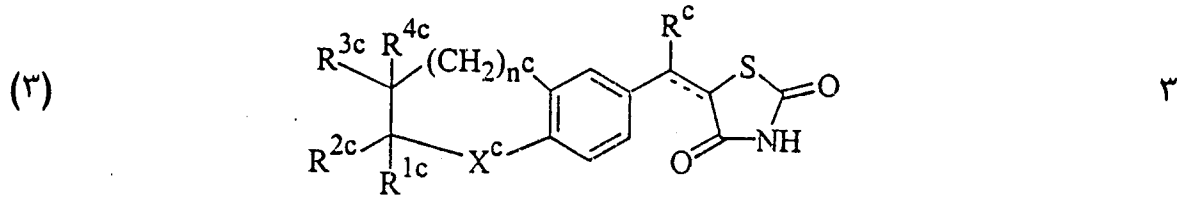
- ٤ حيث :
- ٥ يكون R^{1a} و R^{2a} متماثلين أو مختلفين، ويمثل كل منهما ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل
- ٦ تحتوي من ١ إلى ٥ ذرات كربون؛
- ٧ وتمثل R^{3a} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو
- ٨ مجموعة الكيل كربونيل حلقي تحتوي من ٦ إلى ٨ ذرات كربون، أو مجموعة بنزويل
- ٩ أو نפטويل تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي
- ١٠ تشتمل على البدائل (χ) المعرفة في أدناه، أو مجموعة أسيل حلقي مغلقة حيث
- ١١ يحتوي القسم المخطط منها من ٤ إلى ٧ ذرات حلقة منها ١ إلى ٣ ذرات متباينة
- ١٢ تكون ذرة نيتروجين متباينة و/أو ذرة أكسجين متباينة و/أو ذرة كبريت متباينة، أو
- ١٣ مجموعة فنيل خليل، أو مجموعة فنيل خليل أو فنيل بروبيونيل بها بديل واحد على
- ١٤ الأقل من ذرة هالوجين، أو مجموعة الكوكسي كربونيل تحتوي من ٢ إلى ٧ ذرات
- ١٥ كربون، أو مجموعة بنزيلوكسي كربونيل؛
- ١٦ ان البديل المذكور χ هو عبارة عن مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون،
- ١٧ أو مجموعة الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة هيدروكسي، أو
- ١٨ ذرة هالوجين، أو مجموعة امينو، أو مجموعة الكيل امينو تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات
- ١٩ كربون، أو مجموعة ثاني الكيل امينو تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون في كل
- ٢٠ مجموعة الكيل، أو مجموعة نيترو؛
- ٢١ ويكون R^{4a} و R^{5a} متماثلين أو مختلفين ويمثل كل منهما ذرة هيدروجين، أو مجموعة
- ٢٢ الكيل تحتوي من ١ إلى ٥ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٥
- ٢٣ ذرات كربون، أو يمثل R^{4a} و R^{5a} معا مجموعة الكيلين ديوكسي تحتوي من ١ إلى ٤
- ٢٤ ذرات كربون؛
- ٢٥ ويكون Y^a و Z^a متماثلين أو مختلفين ويمثل كل منهما ذرة أكسجين أو مجموعة امينو؛
- ٢٦ وتمثل n^a عددا صحيحا من ١ إلى ٣.
- ٢٧ أو ملحه المقبول صيدليا.

- ١ -٦ الاستخدام وفقا لمطلب الحماية (١)، حيث يكون معزز حساسية الانسولين المذكور
٢ مركبا وفق الصيغة (٢) التالية :



٤ أو ملحه المقبول صيدليا.

- ١ -٧ الاستخدام وفقا لمطلب الحماية (١)، حيث يكون معزز حساسية الانسولين المذكور
٢ مركبا وفق الصيغة (٣) التالية :



٤ حيث :

٥ تمثل --- رابطة أحادية أو مزدوجة؛

٦ وتمثل n° صفر أو ١ أو ٢؛

٧ وتمثل X° ذرة اكسجين أو كبريت أو مجموعة كبريتينيل أو مجموعة كبريتونيل؛

٨ وتمثل R° ذرة هيدروجين أو مجموعة ميثيل أو مجموعة اثيل؛

٩ وتمثل R^{1c} مجموعة الكيل حلقي تحتوي من ٥ إلى ٧ ذرات كربون، أو مجموعة الكيل

١٠ حلقي تحتوي من ٥ إلى ٧ ذرات كربون بها بديل من مجموعة ميثيل، أو مجموعة

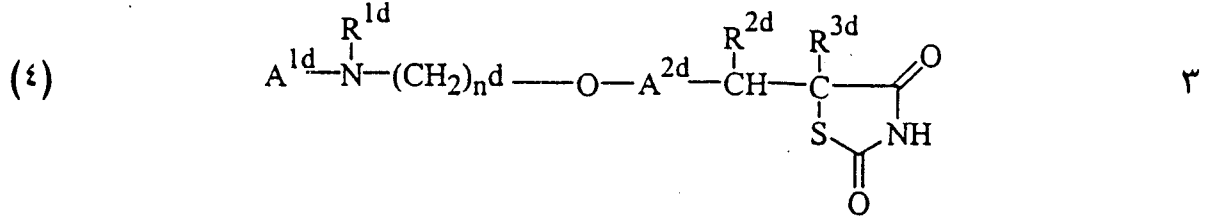
١١ بيريديل، أو مجموعة ثينيل أو مجموعة فزيريل، أو مجموعة نفطيل أو مجموعة ثاني

١٢ فنيل اولي أو مجموعة رابع هيدرو فورانيل أو مجموعة رابع هيدرو ثينيل أو مجموعة

١٣ رابع هيدرو بيرانيل، أو مجموعة وفق الصيغة C₆H₄W^{2c} حيث :

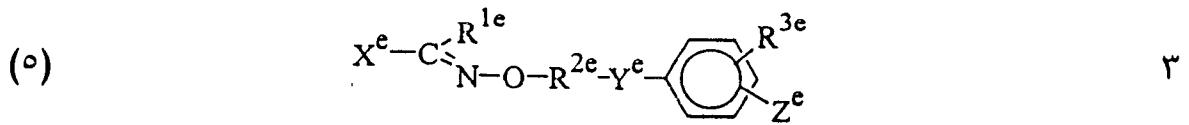
- ١٤ تمثل W^{2C} ذرة هيدروجين أو مجموعة هيدروكسي أو ذرة هالوجين أو مجموعة الكيل
- ١٥ تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون أو مجموعة الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات
- ١٦ كربون أو مجموعة الكيل ثيو تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.
- ١٧ أو مجموعة وفق الصيغة $alk-W^{1C}$ ، حيث :
- ١٨ تمثل alk مجموعة الكيلين تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو مجموعة اثيلدين أو
- ١٩ مجموعة ايزوبروبيلدين؛ وتمثل W^{1C} ذرة هيدروجين، أو مجموعة هيدروكسي، أو
- ٢٠ مجموعة الكوكسي تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكيل ثيو تحتوي
- ٢١ من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة بيريديل، أو مجموعة فوريل، أو مجموعة
- ٢٢ ثينيل، أو مجموعة رابع هيدروفوريل، أو مجموعة رابع هيدروثينيل، أو مجموعة
- ٢٣ نفطيل، أو مجموعة الكيل حلقي تحتوي من ٥ إلى ٧ ذرات كربون، أو مجموعة وفق
- ٢٤ الصيغة $C_6H_4W^{2C}$ حيث تكون W^{2C} كما تم تعريفها في أعلاه؛
- ٢٥ وتمثل R^{2C} ذرة هيدروجين أو مجموعة مثيل؛
- ٢٦ وتمثل R^{3C} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون أو
- ٢٧ مجموعة وفق الصيغة $C_6H_4W^{2C}$ حيث :
- ٢٨ تكون W^{2C} كما تم تعريفها في أعلاه، أو مجموعة بنزيل؛
- ٢٩ وتمثل R^{4C} ذرة هيدروجين؛ أو
- ٣٠ تشكل R^{1C} و R^{2C} معاً مجموعة الكيلين تحتوي من ٤ إلى ٦ ذرات كربون؛
- ٣١ ويمثل كل من R^{3C} و R^{4C} ذرة هيدروجين؛ أو
- ٣٢ تشكل R^{3C} و R^{4C} معاً مجموعة الكيلين تحتوي من ٣ إلى ٤ ذرات كربون، ويمثل كل
- ٣٣ من R^{1C} و R^{2C} ذرة هيدروجين؛ أو
- ٣٤ تشكل R^{2C} و R^{3C} معاً مجموعة الكيلين تحتوي من ٣ إلى ٤ ذرات كربون، ويمثل كل
- ٣٥ من R^{1C} و R^{4C} ذرة هيدروجين؛
- ٣٦ أو ملحه المقبول صيداليا.

- ١ -٨ الاستخدام وفقا لمطلب الحماية (١)، حيث يكون معزز حساسية الانسولين المذكور
٢ مركبا وفق الصيغة (٤) التالية :



- ٤ حيث :
٥ تمثل A^{1d} مجموعة عطرية حلقية مخططة بها بدائل أو تخلو من البدائل.
٦ وتمثل R^{1d} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل أو مجموعة اسيل أو مجموعة االكيل
٧ (ويمكن ان يحتوي شق الاريل في مجموعة الارالكيل المذكورة على بدائل أو يخلو من
٨ البدائل) أو مجموعة اريل بها بدائل أو تخلو من البدائل.
٩ ويمثل كل من R^{2d} و R^{3d} ذرة هيدروجين أو تشكلا معا رابطة.
١٠ وتمثل A^{2d} حلقة بنزين تحتوي على ما لا يزيد مجموعه عن ٥ بدائل.
١١ وتمثل n^d عددا صحيحا من ٢ إلى ٦؛
١٢ أو ملحه المقبول صيدليا.

- ١ -٩ الاستخدام وفقا لمطلب الحماية (١)، حيث يكون معزز حساسية الانسولين المذكور
٢ مركبا وفق الصيغة (٥) التالية :



- ٤ حيث :
٥ تمثل R^{1e} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة
٦ تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون.

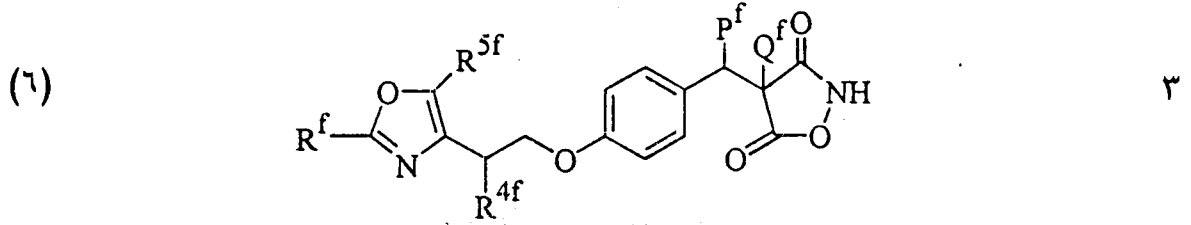
- ٧ وتمثل R^{2e} مجموعة الكيلين مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٢ إلى ٦ ذرات كربون. ٨
- ٩ وتمثل R^{3e} ذرة هيدروجين، أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين، أو مجموعة نيترو، أو مجموعة امينو أو مجموعة اول الكيل امينو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة ثاني الكيل امينو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون، أو مجموعة اركيل تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون. ١٧
- ١٨ وتمثل X^{4e} مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها ١٩ من ١ إلى ٣ بدائل من بدائل α ، المعرفة في أدناه، أو مجموعة عطرية مغلطة تخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل من بدائل α ، المعرفة في أدناه. ٢٠
- ٢١ ويمثل كل بديل من بدائل α المذكورة ما يلي :
- ٢٢ أ - مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو ٢٣
- ٢٤ ب - مجموعة هالوالكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو ٢٥
- ٢٦ ج - مجموعة هيدروكسي، أو ٢٧
- ٢٨ د - مجموعة اسيلوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ٢٩
- ٣٠ هـ - مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو

٣١	و -	مجموعة الكيلين ديوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١
٣٢		إلى ٤ ذرات كربون، أو
٣٣	ز -	مجموعة اركيلوكسي تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون، أو
٣٤	ح -	مجموعة الكيل ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤
٣٥		ذرات كربون، أو
٣٦	ط -	مجموعة الكيل كبريتونيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١
٣٧		إلى ٤ ذرات كربون، أو
٣٨	ي -	ذرة هالوجين، أو
٣٩	ك -	مجموعة نيترو، أو
٤٠	ل -	مجموعة امينو، أو
٤١	م -	مجموعة اول الكيل امينو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١
٤٢		إلى ٤ ذرات كربون، أو
٤٣	ن -	مجموعة ثاني الكيل امينو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة حيث يحتوي
٤٤		كل شق الكيل فيها من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو
٤٥	س -	مجموعة اركيل تحتوي من ٧ إلى ١٢ ذرة كربون، أو
٤٦	ع -	مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرة كربون تخلو من البدائل أو بها بديل
٤٧		واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β المعرفة في
٤٨		أدناه، أو
٤٩	ف -	مجموعة اريلوكسي تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها
٥٠		بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β المعرفة
٥١		في أدناه، أو
٥٢	ص -	مجموعة اريل ثيو تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها
٥٣		بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β المعرفة
٥٤		في أدناه، أو

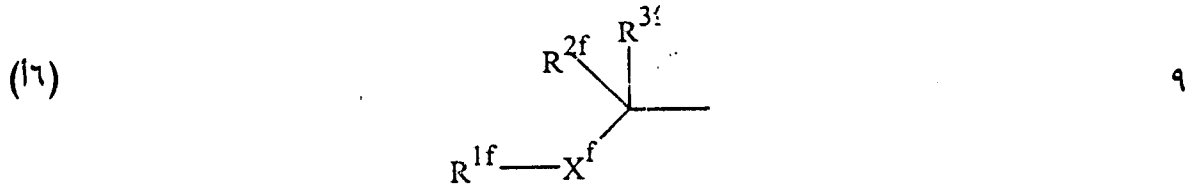
- ٥٥ ق - مجموعة اريل كبريتونيل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل
- ٥٦ أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل β
- ٥٧ المعرفة في أدناه، أو
- ٥٨ ر - مجموعة اريل كبريتونيل امينو تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من
- ٥٩ البدائل أو بها بديل واحد على الاقل يختار من المجموعة التي تشتمل على
- ٦٠ البدائل β المعرفة في أدناه، حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين في شق الامينو من
- ٦١ البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة
- ٦٢ تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو
- ٦٣ ش - مجموعة عطرية مخططة، أو
- ٦٤ ت - مجموعة اريلوكسي مخططة، أو
- ٦٥ ث - مجموعة اريل ثيو مخططة، أو
- ٦٦ خ - مجموعة اريل كبريتونيل مخططة، أو
- ٦٧ ذ - مجموعة كبريتونيل امينو عطرية مخططة حيث تخلو فيها ذرة النيتروجين
- ٦٨ في شق الامينو من البدائل أو بها بديل من مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو
- ٦٩ متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون.
- ٧٠ ويمثل البديل β المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة
- ٧١ تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون، أو مجموعة هالوالكيل مستقيمة السلسلة أو
- ٧٢ متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي
- ٧٣ مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو
- ٧٤ ذرة هالوجين، أو مجموعة الكيلين ديوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة
- ٧٥ السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون.
- ٧٦ وتمثل Y^e ذرة الكسجين أو ذرة كبريت أو مجموعة وفق الصيغة $N-R^{4e} >$ (حيث
- ٧٧ تمثل R^{4e} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة

- ٧٨ السلسلة تحتوي من ١ إلى ٦ ذرات كربون أو مجموعة أسيل مستقيمة السلسلة
- ٧٩ أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٨ ذرات كربون).
- ٨٠ وتمثل Z^e مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسو ثيازوليدينيدينيل (٥)-مثيل، أو ٤،٢-
- ٨١ ثاني اوكسو ثيازوليدينيدينيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسو اوكسا ثاني ازوليدينيدينيل
- ٨٢ (٢)-مثيل أو ٥،٣-ثاني اوكسو اوكسا ثاني ازوليدينيدينيل (٢)-مثيل.
- ٨٣ أو ملحه المقبول صيدليا.

- ١ ١٠- الاستخدام وفقا لمطلب الحماية (١)، حيث يتكون معزز حساسية الانسولين المذكور
- ٢ مركبا وفق الصيغة (٦) التالية :



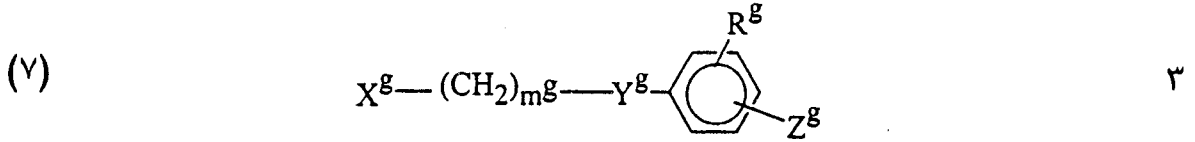
- ٤ حيث :
- ٥ تمثل R^f مجموعة هيدروكربونية عطرية قد تحتوي على بدائل، أو مجموعة
- ٦ هيدروكربونية اليفاتية حلقية قد تحتوي على بدائل، أو مجموعة حلقية مخططة قد
- ٧ تحتوي على بدائل، أو مجموعة حلقية مخططة منصهرة قد تحتوي على بدائل، أو
- ٨ مجموعة وفق الصيغة (١٦) التالية :



- ١٠ (حيث تمثل R^{1f} مجموعة هيدروكربونية عطرية والتي قد يكون بها بدائل، أو مجموعة
- ١١ هيدروكربونية اليفاتية حلقية قد يكون بها بدائل أو مجموعة حلقية مخططة قد يكون

- ١٢ بها بدائل أو مجموعة حلقية مخططة منصهرة قد يكون بها بدائل، وتكون R^{2f} و R^{3f}
- ١٣ متماثلة أو مختلفة، ويمثل كل منهما ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل منخفض الوزن
- ١٤ الجزيئي، وتمثل X^f ذرة اكسجين أو ذرة كلور أو مجموعة امينو ثانوية).
- ١٥ وتمثل R^{4f} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل منخفض الوزن الجزيئي.
- ١٦ وتمثل R^{5f} مجموعة الكيل منخفض الوزن الجزيئي.
- ١٧ ويمثل كل من P^f و Q^f ذرة هيدروجين أو يشكلان معا رابطة؛
- ١٨ أو ملحه المقبول صيدليا.

- ١ ١١- الاستخدام وفقا لمطلب الحماية (١)، حيث يكون معزز حساسية الانسولين المذكور
- ٢ مركبا وفق الصيغة (٧) التالية :

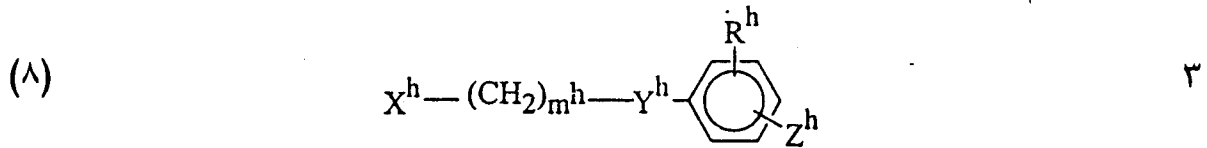


- ٤ حيث :
- ٥ تمثل X^g مجموعة اندول حلقية أو اندولين حلقية أو ازاندول حلقية أو ازاندولين حلقية أو
- ٦ ايميدازوبيريدين حلقية أو ايميدازوبيريدين حلقية والتي تخلو من البدائل أو بها من ١
- ٧ إلى ٣ بدائل تختار من المجموعة التي تشتمل على البديل δ المعروف في أدناه.
- ٨ وتمثل Y^g ذرة اكسجين أو ذرة كبريت.
- ٩ وتمثل Z^g مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسو ثيازوليدينيدينيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني
- ١٠ اوكسو ثيازوليدينيدينيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسو اوكسازوليدينيدينيل (٥)-مثيل أو ٥،٣-
- ١١ ثاني اوكسو اوكسانثاني زوليدينيدينيل (٢)-مثيل أو N -هيدروكسي يوريدومثيل.
- ١٢ وتمثل R^g ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة
- ١٣ تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة
- ١٤ السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين، أو مجموعة هيدروكسي

- ١٥ أو مجموعة نيترو أو مجموعة امينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار
- ١٦ من المجموعة التي تشتمل على البدائل ε ، المعرفة في أدناه، أو مجموعة اراكيل
- ١٧ مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون.
- ١٨ ويمثل البديل ε المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي
- ١٩ من ١ إلى ٨ ذرات كربون، أو مجموعة اراكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة
- ٢٠ تحتوي من تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون، أو مجموعة اريل مستقيمة السلسلة أو
- ٢١ متفرعة السلسلة تحتوي من تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون أو مجموعة اسيل
- ٢٢ اليفاتية مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ١١ ذرة كربون، أو
- ٢٣ مجموعة اسيل عطرية اليفاتية تحتوي من ٨ إلى ١٢ ذرة كربون أو مجموعة اسيل
- ٢٤ عطرية تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون.
- ٢٥ وتمثل m^8 عددا صحيحا من ١ إلى ٥.
- ٢٦ ويمثل البديل δ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي
- ٢٧ من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة
- ٢٨ السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة هالوجين أو
- ٢٩ مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خيلوكسي أو مجموعة فنيل ثيو أو مجموعة الكيل
- ٣٠ ثيو مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو
- ٣١ مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة نيترو أو مجموعة امينو تخلو من البدائل أو بها
- ٣٢ بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل ε ، المعرفة أعلاه،
- ٣٣ أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها بديل
- ٣٤ واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل φ أو مجموعة اراكيل
- ٣٥ مستقيمة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد
- ٣٦ على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل φ .
- ٣٧ ويمثل البديل φ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي
- ٣٨ من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة

- ٣٩ السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو
 ٤٠ مجموعة نيترو أو مجموعة فنيل أو مجموعة ثلاث فلورومثيل أو مجموعة امينو تـخلو
 ٤١ من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل
 ٤٢ ε، المعرفة أعلاه؛
 ٤٣ أو ملحه المقبول صيدليا.

- ١ ١٢- الاستخدام وفقا لمطلب الحماية (١)، حيث يكون معزز حساسية الانسولين المذكور
 ٢ مركبا وفق الصيغة (٨) التالية :



- ٤ حيث :
 ٥ تمثل X^h مجموعة بنزوايميدازول حلقية تـخلو من البدائل أو بها من ١ إلى ٣ بدائل
 ٦ تختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل γ المعرفة في أدناه.
 ٧ وتمثل Y^h ذرة اكسجين أو ذرة كبريت.
 ٨ وتمثل Z^h مجموعة ٤،٢-ثاني اوكسوإيازوليدينيلايدنيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني
 ٩ اوكسوإيازوليدينيلايدنيل (٥)-مثيل أو ٤،٢-ثاني اوكسوإيازوليدينيلايدنيل (٥)-مثيل أو ٥،٣-
 ١٠ ثاني اوكسوإيازوليدينيلايدنيل (٢)-مثيل أو N -هيدروكسي يوريدومثيل.
 ١١ وتمثل R^h ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة
 ١٢ تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة
 ١٣ السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين، أو مجموعة هيدروكسي
 ١٤ أو مجموعة امينو التي تـخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من
 ١٥ المجموعة التي تشتمل على البدائل η، المعرفة في أدناه، أو مجموعة اركيل
 ١٦ مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون.

- ١٧ ويمثل m^h عددا صحيحا من ١ الى ٥.
- ١٨ ويمثل البديل γ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي
- ١٩ من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة
- ٢٠ السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة بنزيلوكسي أو ذرة هالوجين أو
- ٢١ مجموعة هيدروكسي أو مجموعة خيلوكسي أو مجموعة فنيل ثيو أو مجموعة الكيل ثيو
- ٢٢ مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة
- ٢٣ ثالث فلورومثيل أو مجموعة نيترو أو مجموعة امينو تخلو من البدائل أو بها بديل واحد
- ٢٤ على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل η ، المعرفة أدناه، أو
- ٢٥ مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد
- ٢٦ على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل على البدائل λ ، المعرفة أدناه، أو
- ٢٧ مجموعة اركيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة
- ٢٨ كربون تخلو من البدائل أو بها بديل واحد على الأقل يختار من المجموعة التي تشتمل
- ٢٩ على البدائل λ ، المعرفة أدناه.
- ٣٠ ويمثل البديل η المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي
- ٣١ من ١ إلى ٨ ذرات كربون، أو مجموعة اركيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة
- ٣٢ تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرات كربون، أو مجموعة اريل تحتوي من ٦ إلى ١٠ ذرات
- ٣٣ كربون، أو مجموعة اسيل اليفاتية مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي من ١
- ٣٤ إلى ١١ ذرة كربون، أو مجموعة اسيل عطرية اليفاتية تحتوي من ٨ إلى ١٢ ذرة
- ٣٥ كربون أو مجموعة اسيل عطرية تحتوي من ٧ إلى ١١ ذرة كربون.
- ٣٦ ويمثل البديل λ المذكور مجموعة الكيل مستقيمة السلسلة أو متفرعة السلسلة تحتوي
- ٣٧ من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو مجموعة الكوكسي مستقيمة السلسلة أو متفرعة
- ٣٨ السلسلة تحتوي من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو ذرة هالوجين أو مجموعة هيدروكسي أو
- ٣٩ مجموعة نيترو أو مجموعة فنيل أو مجموعة ثالث فلورومثيل أو مجموعة امينو تخلو

١ ١٣- الاستخدام وفقا لمطلب الحماية (١)، حيث يكون معزز حساسية الانسولين المذكور
٢ مركبا وفق الصيغة (٩) التالية :



٤	حيث :
٥	تمثل --- رابطة أحادية أو مزدوجة.
٦	وتمثل V^i مجموعة وفق الصيغة $-CH=CH-$ أو $-N=CH-$ أو $-CH=N-$ أو ذرة كبريت.
٧	وتمثل W^i مجموعة وفق الصيغة $CH_2 >$ أو $CHOH >$ أو $CO >$ أو
٨	$C=NOR^i >$ أو $-CH=CH-$
٩	وتمثل X^i ذرة كبريت أو أكسجين أو مجموعة وفق الصيغة $NR^{ii} >$ أو -
١٠	$CH=N-$ أو $-N=CH-$
١١	وتمثل Y^i مجموعة وفق الصيغة $=CH-$ أو ذرة نيتروجين.
١٢	وتمثل Z^i ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٧ ذرات كربون أو
١٣	مجموعة الكيل حلقي تحتوي من ٣ إلى ٧ ذرات كربون أو مجموعة فنيل أو مجموعة
١٤	نفطيل أو مجموعة بيريديل أو مجموعة فوريل أو مجموعة ثينيل أو مجموعة فنيل بها
١٥	بديل واحد أو بديلين تختار من المجموعة التي تشتمل على مجاميع الكيل تحتوي من
١٦	١ إلى ٣ ذرات كربون أو مجاميع ثالث فنورومثيل أو مجاميع الكوكسي تحتوي من ١
١٧	إلى ٣ ذرات كربون، أو ذرات فلور أو ذرات كلور أو ذرات بروم.

- ١٨ وتمثل Z^{ii} ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل تحتوي من ١ إلى ٣ ذرات كربون.
- ١٩ وتمثل R^i و R^{ii} ، كل على حدة، ذرة هيدروجين أو مجموعة مثيل.
- ٢٠ وتمثل n^i العدد ١ أو ٢ أو ٣؛
- ٢١ أو ملحه المقبول صيدليا.
- ١ ١٤- الاستخدام وفقا لمطلب الحماية (١)، حيث يكون معزز حساسية الانسولين المذكور
- ٢ مركبا وفق الصيغة (٩) التالية :
- (١٠)
- ٣
- ٤ حيث :
- ٥ تمثل
- ٦
- ٧ مجموعة وفق الصيغة
- ٨
- ٩ وتمثل X^i - ذرة اكسجين أو كبريت.
- ١٠ وتمثل Y^i - شق $=N-$ أو مجموعة وفق الصيغة $=CR^{5j}$.
- ١١ وتمثل R^{ij} و R^{2j} و R^{3j} و R^{4j} ، بشكل مستقل، ذرة هيدروجين أو ذرة هالوجين أو
- ١٢ مجموعة الكيل أو مجموعة اريل أو مجموعة الكوكسي أو مجموعة الكوكسي الكوكسي
- ١٣ أو مجموعة اريلوكسي أو مجموعة الكانوييلوكسي أو مجموعة اريل كربونيلوكسي أو

- ١٤ مجموعة كربونيل أو مجموعة الكوكسي كربونيل أو مجموعة اريلوكسي كربونيل أو
 ١٥ مجموعة كربامويل أو مجموعة الكيل امينوكربونيل أو مجموعة اريل امينوكربونيل أو
 ١٦ مجموعة امينو أو مجموعة الكيل امينو أو مجموعة الكانويل امينو أو مجموعة اريل
 ١٧ كربونيل امينو أو مجموعة اثيلين ثاني أو كسي مثيل أو مجموعة فورميل أو مجموعة
 ١٨ سيانو أو مجموعة نيترو أو مجموعة ثالث هالو مثيل.
 ١٩ وتمثل R^6 ذرة هيدروجين أو مجموعة الكيل قد تحتوي على بدائل أو مجموعة اريل قد
 ٢٠ تحتوي على بدائل.
 ٢١ وتمثل n صفرا أو عددا صحيحا من ١ إلى ٣.
 ٢٢ وقد تمثل --- رابطة أحادية أو مزدوجة؛
 ٢٣ أو ملحه المقبول صيدليا.

- ١ ١٥- الاستخدام وفقا لمطلب الحماية (١)، حيث يكون معزز حساسية الانسولين المذكور ما
 ٢ يلي :
 ٣ (أ) ٥-٤-٦-هيدروكسي-٨،٧،٥،٢-رابع مثيل كرومانيل (٢) اثوكسي) بنزيل
 ٤ ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
 ٥ (ب) ٥-٤-٦-هيدروكسي-٢-مثيل-٧-ثلاثي بوتيل كرومانيل (٢) مثوكسي)
 ٦ بنزيل] ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
 ٧ (ج) ٥-٤-٦-هيدروكسي-٢-اثل-٨،٧،٥-ثالث مثيل كرومانيل (٢) مثوكسي)
 ٨ بنزيل] ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
 ٩ (د) ٥-٤-٦-هيدروكسي-٢-ايزوبوتيل-٨،٧،٥-ثالث مثيل كرومانيل (٢)
 ١٠ مثوكسي) بنزيل] ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
 ١١ (هـ) ٥-٤-٦-خليلوكسي-٨،٧،٥،٢-رابع مثيل كرومانيل (٢) مثوكسي) بنزيل
 ١٢ ثيازوليدين-٤،٢-ديون.

۱۳	(و) ۵- [۴- (۶- ائوكسى كاربونيلوكسى- ۸،۷،۵،۲- رابع مئيل كرومانيل (۲) مئوكسى) بنزيل] ثيازوليدين- ۴،۲- ديون.
۱۴	۵- [۴- (۲- (۳- ائيل- ۲- بيريديل) ائوكسى) بنزيل] ثيازوليدين- ۴،۲- ديون.
۱۵	(ز) ۵- [۴- (۲- (۳- ائيل- ۲- بيريديل) ائوكسى) بنزيل] ثيازوليدين- ۴،۲- ديون.
۱۶	(ح) ۵- [۴- (۲- (۴- ائيل- ۲- بيريديل) ائوكسى) بنزيل] ثيازوليدين- ۴،۲- ديون.
۱۷	(ط) ۵- [۴- (۲- (۵- ائيل- ۲- بيريديل) ائوكسى) بنزيل] ثيازوليدين- ۴،۲- ديون.
۱۸	(ي) ۵- [۴- (۲- (۶- ائيل- ۲- بيريديل) ائوكسى) بنزيل] ثيازوليدين- ۴،۲- ديون.
۱۹	(ك) ۵- [۲- بنزيل- ۳،۲- ثاني هيدروبنزوفورائيل (۵)] مئيل] ثيازوليدين- ۴،۲- ديون.
۲۰	
۲۱	(ل) ۵- [۲- بنزيل- ۴،۳- ثاني هيدرو- H۲- بنزوبيرائيل (۶)] مئيل] ثيازوليدين- ۴،۲- ديون.
۲۲	
۲۳	(م) ۵- [۴- (۲- N- مئيل- N- (۲- بنزوثيازوليل) امينو] ائوكسى] بنزيل] ثيازوليدين- ۴،۲- ديون.
۲۴	
۲۵	(ن) ۵- [۴- (۲- N- مئيل- N- (۲- بيريميدينيل) امينو] ائوكسى] بنزيل] ثيازوليدين- ۴،۲- ديون.
۲۶	
۲۷	(س) ۵- [۴- (۲- N- مئيل- N- (۵،۴- ثاني مئيل ثيازوليل (۲)] امينو] ائوكسى] بنزيل] ثيازوليدين- ۴،۲- ديون.
۲۸	
۲۹	(ع) ۵- [۴- (۲- N- مئيل- N- (۲- امينو) ائوكسى] بنزيل] ثيازوليدين- ۴،۲- ديون.
۳۰	
۳۱	(ف) ۵- [۴- (۲- N- مئيل- N- (۴- فنيل ثيازوليل (۲)] امينو] ائوكسى] بنزيل] ثيازوليدين- ۴،۲- ديون.
۳۲	
۳۳	(ص) ۵- [۴- (۲- N- مئيل- N- (۴- فنيل- ۵- مئيل ثيازوليل (۲)] امينو] ائوكسى] بنزيل] ثيازوليدين- ۴،۲- ديون.
۳۴	
۳۵	(ق) ۵- [۴- (۲- N- مئيل- N- (۴- مئيل- ۵- فنيل ثيازوليل (۲)] امينو] ائوكسى] بنزيل] ثيازوليدين- ۴،۲- ديون.
۳۶	

۳۷	ر)	۵- (۴-۲-N-مئیل-N-۵-فنیلوکسازولیل (۲)) امینو [اثوکسی] بنزیل
۳۸		تیازولیدین-۴،۲-دیون.
۳۹	ش)	۵- (۴-۲-N-مئیل-N-۵،۴-ثانی مئیلوکسازولیل (۲)) امینو [اثوکسی]
۴۰		بنزیل) تیازولیدین-۴،۲-دیون.
۴۱	ت)	۵- (۴-۲-۲-بیریمیدینیل امینو) اثوکسی] بنزیل) تیازولیدین-۴،۲-دیون.
۴۲	ث)	۵- (۴-۲-N-خلیل-N-بیریمیدینیل (۲) امینو) اثوکسی] بنزیل
۴۳		تیازولیدین-۴،۲-دیون.
۴۴	خ)	۵- (۴-۲-N-۲-بنزوئیل-۲-بنزولیل) بنزیل امینو [اثوکسی] بنزیل
۴۵		تیازولیدین-۴،۲-دیون.
۴۶	ذ)	۵- (۴-۳-N-مئیل-N-۲-بنزوکسازولیل) امینو [بروبوکسی] بنزیل
۴۷		تیازولیدین-۴،۲-دیون.
۴۸	ض)	۵- (۴-۲-N-مئیل-N-بیریدیل (۲) امینو) اثوکسی] بنزیل) تیازولیدین-
۴۹		۴،۲-دیون.
۵۰	ظ)	۵- (۴-۲-۱-۴-ثانی فنیل) اتیلیدین امینو اوکسی] اثوکسی] بنزیل
۵۱		تیازولیدین-۴،۲-دیون.
۵۲	غ)	۵- (۴-۲-۱-۴-فنیل کبریتونیل فنیل) اتیلیدین امینو اوکسی] اثوکسی] بنزیل
۵۳		تیازولیدین-۴،۲-دیون.
۵۴	ا)	۵- (۴-۲-۱-۴-بیریدیل (۲) فنیل) اتیلیدین امینو اوکسی] اثوکسی] بنزیل
۵۵		تیازولیدین-۴،۲-دیون.
۵۶	اب)	۵- (۴-۲-۱-۴-بیریدیل (۳) فنیل) اتیلیدین امینو اوکسی] اثوکسی] بنزیل
۵۷		تیازولیدین-۴،۲-دیون.
۵۸	اج)	۵- (۴-۲-۱-۴-بیریدیل (۴) فنیل) اتیلیدین امینو اوکسی] اثوکسی] بنزیل
۵۹		تیازولیدین-۴،۲-دیون.

۶۰	۵- (۴)- (۲)- (۱)- (۲- فنیل- ۵- بیریدیل) ائیلیدین امینو اوکسی [اٹوکسی { بنزیل
۶۱	تيازولیدین- ۴، ۲- دیون.
۶۲	۵- (۴)- (۲)- (۱)- (۲- مٹوکسی- ۵- بیریدیل) ائیلیدین امینو اوکسی [اٹوکسی {
۶۳	بنزیل) تيازولیدین- ۴، ۲- دیون.
۶۴	۵- (۴)- (۲)- (۱)- (۲- اٹوکسی- ۵- بیریدیل) ائیلیدین امینو اوکسی [اٹوکسی {
۶۵	بنزیل) تيازولیدین- ۴، ۲- دیون.
۶۶	۵- (۴)- (۲)- (۱)- (۲- ایزوبروبوکسی- ۵- بیریدیل) ائیلیدین امینو اوکسی [
۶۷	اٹوکسی { بنزیل) تيازولیدین- ۴، ۲- دیون.
۶۸	۵- (۴)- (۲)- (۱)- (۲- بنزیل- ۵- بیریدیل) ائیلیدین امینو اوکسی [اٹوکسی { بنزیل
۶۹	تيازولیدین- ۴، ۲- دیون.
۷۰	۴- (۴)- (۲)- (۲- فنیل- ۵- مٹیل- ۴- اوکسازولیل) اٹوکسی [بنزیل]- ۵، ۳-
۷۱	ایزوکسازولیدین دیون.
۷۲	۴- (۴)- (۲)- (۲- فنیل- ۵- مٹیل- ۴- اوکسازولیل) اٹوکسی [بنزیلیدین]- ۵، ۳-
۷۳	ایزوکسازولیدین دیون.
۷۴	۴- (۴)- (۲)- (۲- بنزوئینیل- ۵- مٹیل- ۴- اوکسازولیل) اٹوکسی [بنزیل]- ۵، ۳-
۷۵	ایزوکسازولیدین دیون.
۷۶	۴- (۴)- (۲)- (۲- مٹیل- ۲)- (۱)- (۲- بیریدیل ثیو) ائیل]- ۴- اوکسازولیل { اٹوکسی
۷۷	بنزیل]- ۵، ۳- ایزوکسازولیدین دیون.
۷۸	۵- (۴)- (۳- مٹیل ایمیدازو [b- ۵، ۴] بیریدینیل (۲) مٹوکسی) بنزیل { تيازولیدین-
۷۹	۴، ۲- دیون.
۸۰	۵- (۴)- (۵- کلورو- ۳- مٹیل ایمیدازو [b- ۵، ۴] بیریدینیل (۲) مٹوکسی) بنزیل {
۸۱	تيازولیدین- ۴، ۲- دیون.
۸۲	۵- (۴)- (۵- مٹوکسی- ۳- مٹیل ایمیدازو [b- ۵، ۴] بیریدینیل (۲) مٹوکسی) بنزیل {
۸۳	تيازولیدین- ۴، ۲- دیون.

٨٤	٨٤ (ع) ٥-٤-٥ (هيدروكسي-٣-مثيل ايميدازو [b-٥،٤] بيريدينيل (٢) مٲوكسي) بنزيل {ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
٨٥	٨٥ (ف) ٥-٤-٥ (اٲوكسي-٣-مثيل ايميدازو [b-٥،٤] بيريدينيل (٢) مٲوكسي) بنزيل {ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
٨٦	٨٦ (ص) ٥-٤-٥ (ايزوبروبوكسي-٣-مثيل ايميدازو [b-٥،٤] بيريدينيل (٢) مٲوكسي) بنزيل {ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
٨٧	٨٧ (ق) ٥-٤-٥ (١-مثيلين دولينيل (٢) مٲوكسي) بنزيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
٨٨	٨٨ (ر) ٥-٤-٥ (١-مثيل بنزايמידازوليل (٢) مٲوكسي) بنزيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
٨٩	٨٩ (ش) ٥-٤-٥ (٦-مٲوكسي-١-مثيل بنزايמידازونيل (٢) مٲوكسي) بنزيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
٩٠	٩٠ (ت) ٥-٤-٥ (٥-مٲوكسي-١-مثيل بنزايמידازوليل (٢) مٲوكسي) بنزيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
٩١	٩١ (ٲ) ٥-٤-٥ (١-بنزيل بنزايמידازوليل (٥) مٲوكسي) بنزيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
٩٢	٩٢ (خ) ٥-٤-٥ (٥-هيدروكسي-١،٤،٦،٧-رابع مٲيل بنزايמידازوليل (٢) مٲوكسي) بنزيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
٩٣	٩٣ (ذ) ٥-٤-٥ (٥-خيلوكسي-١،٤،٦،٧-رابع مٲيل بنزايמידازوليل (٢) مٲوكسي) بنزيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
٩٤	٩٤ (ض) ٥-٤-٥ (٣-٥-مٲيل-٢-فنييل اوكسي-ازوليل (٤)) بروبيونيل [بنزيل {ثيازوليدين-٤،٢-ديون
٩٥	٩٥ (ظ) ٥-٤-٥ (٢-فلوروبنزيلوكسي)-٢-نفطيل مٲيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون؛
٩٦	٩٦ (ٲ) ٥-٤-٥ (٢-فلوروبنزيلوكسي)-٢-نفطيل مٲيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون؛

١-١٦ - الاستخدام وفقا لمطلب الحماية (١)، حيث يٲتار معزز حساسية الانسولين المذكور من المجموعة التي تشتمل على الآتي :

۳	(ا)	۵-۴-۶-هیدروکسی-۸،۷،۵،۲-رابع مثیل کرومانیل (۲) ائوکسی) بنزیل
۴		تيازوليدین-۴،۲-دیون.
۵	(ب)	۵-۴-۶-خلیلوکسی-۸،۷،۵،۲-رابع مثیل کرومانیل (۲) مئوکسی) بنزیل
۶		تيازوليدین-۴،۲-دیون.
۷	(ج)	۵-۴-۶-ائوکسی کربونیلوکسی-۸،۷،۵،۲-رابع مثیل کرومانیل (۲)
۸		مئوکسی) بنزیل] تيازوليدین-۴،۲-دیون.
۹	(د)	۵-۴-۲-۵-ائیل-۲-بیریدیل) ائوکسی) بنزیل] تيازوليدین-۴،۲-دیون.
۱۰	(هـ)	۵-۲-بنزیل-۴،۳-ثانی هیدرو-۲-بنزوبیرانیل (۶)) مئیل] تيازوليدین-
۱۱		۴،۲-دیون.
۱۲	(و)	۵-۴-۲-N-مئیل-N-بیریدیل (۲) امینو) ائوکسی) بنزیل] تيازوليدین-
۱۳		۴،۲-دیون.
۱۴	(ز)	۵-۴-۲-۱-۴-بیریدیل (۲) فنیل) ائیلیدین امینو اوکسی) ائوکسی) بنزیل]
۱۵		تيازوليدین-۴،۲-دیون.
۱۶	(ح)	۴-۴-۲-۲-فنیل-۵-مئیل-۴-اوکسازولیل) ائوکسی) بنزیل]-۵،۳-
۱۷		ایزوکسازولیدین دیون.
۱۸	(ط)	۵-۴-۵-مئوکسی-۳-مئیل ایمیدازو [b-۵،۴] بیریدینیل (۲) مئوکسی) بنزیل]
۱۹		تيازوليدین-۴،۲-دیون.
۲۰	(ي)	۵-۴-۱-مئیلین دولینیل (۲) مئوکسی) بنزیل] تيازوليدین-۴،۲-دیون.
۲۱	(ك)	۵-۴-۱-مئیل بنزایمیدازولیل (۲) مئوکسی) بنزیل] تيازوليدین-۴،۲-دیون.
۲۲	(ل)	۵-۴-۶-مئوکسی-۱-مئیل بنزایمیدازولیل (۲) مئوکسی) بنزیل] تيازوليدین-
۲۳		۴،۲-دیون.
۲۴	(م)	۵-۴-۵-هیدروکسی-۷،۶،۴،۱-رابع مثیل بنزایمیدازولیل (۲) مئوکسی)
۲۵		بنزیل] تيازوليدین-۴،۲-دیون.

٢٦	(ن) ٥-٤-٣-٥-مثيل-٢-فنييل او كسازوليل (٤)) بروبيونيل [بنزيل] ثيازوليدين-
٢٧	٤،٢-ديون
٢٨	(س) ٥-٦-٢-فلوروبنزيلوكسي)-٢-نفطيل مثيل [ثيازوليدين-٤،٢-ديون؛
٢٩	أو ملحه المقبول صيدليا.

١	١٧- الاستخدام وفقا لمطلب الحماية (١)، حيث يكون معزز حساسية الانسولين المذكور ما
٢	يلي :
٣	(ا) ٥-٤-٦-هيدروكسي-٨،٧،٥،٢-رابع مثيل كرومانيل (٢) اوكسي) بنزيل [
٤	ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
٥	(ب) ٥-٤-٢-٥-اثيل-٢-بيريديل) اوكسي] بنزيل { ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
٦	(ج) ٥-٤-٢-(N-مثيل-N-بيريديل (٢) امينو) اوكسي] بنزيل { ثيازوليدين-٤،٢-
٧	ديون.
٨	(د) ٥-٤-٢-١-٤-بيريديل (٢) فنييل) اثيليدين امينو اوكسي] اوكسي) بنزيل (
٩	ثيازوليدين-٤،٢-ديون.
١٠	(هـ) ٥-٤-٦-مئوكسي-١-مثيل بنزايميدازوليل (٢) مئوكسي) بنزيل [ثيازوليدين-
١١	٤،٢-ديون؛
١٢	أو ملحه المقبول صيدليا.

١	١٨- مركب لعلاج فرط ارتفاع حمض اليوريك في الدم أو الوقاية من في كائن لبون يعاني
٢	من فرط حمض اليوريك في الدم، ويشتمل المركب على مقدار فعال من معزز حساسية
٣	انسولين.

١	١٩- المركب وفقا لمطلب الحماية (١٨) حيث يختار فيه معزز حساسية الانسولين المذكور
٢	من المجموعة التي تشتمل على مركبات ثيازوليدين ديون ومركبات ايمينوثيازوليدينون

- ٣ ومركبات ثاني ايمينوثيازوليددين ومركبات ثيوكسوثيرازوليددينون ومركبات ايمينوثالث
٤ ازول ومركبات اوكسازوليددين ديون ومركبات ايزوكسازوليددين ديون ومركبات اوكسا
٥ ثاني ازوليددين ديون.

- ١ ٢٠- التركيب وفقا لمطلب الحماية (١٨) حيث يكون معزز حساسية الانسولين المذكور
٢ مركب ثيازوليددين ديون.

- ١ ٢١- التركيب وفقا لمطلب الحماية (١٨) حيث يكون معزز حساسية الانسولين المذكور ما
٢ يلي:

- ٣ (ا) ٥-٤-٦-هيدروكسي-٨،٧،٥،٢-رابع مثيل كرومانيل (٢) موكسي) بنزيل]
٤ ثيازوليددين-٤،٢-ديون.

- ٥ (ب) ٥-٤-٢-٥-اثيل-٢-بيريديل) اوكسي] بنزيل} ثيازوليددين-٤،٢-ديون.

- ٦ (ج) ٥-٤-٢-N-مثيل-N-بيريديل (٢) امينو) اوكسي] بنزيل] ثيازوليددين-٤،٢-
٧ ديون.

- ٨ (د) ٥-٤-٢-١-٤-بيريديل (٢) فنيل) اثيليددين امينو اوكسي] اوكسي] بنزيل)
٩ ثيازوليددين-٤،٢-ديون.

- ١٠ (هـ) ٥-٤-٦-موكسي-١-مثيل بنزايميدازوليل (٢) موكسي] بنزيل] ثيازوليددين-
١١ ٤،٢-ديون؛

- ١٢ أو ملحه المقبول صيدليا.