



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2020113329, 13.09.2018

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
14.09.2017 JP 2017-176891

(43) Дата публикации заявки: 15.10.2021 Бюл. № 29

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 14.04.2020(86) Заявка РСТ:  
JP 2018/033909 (13.09.2018)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2019/054427 (21.03.2019)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр. 3, ООО  
"Юридическая фирма Городисский и  
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

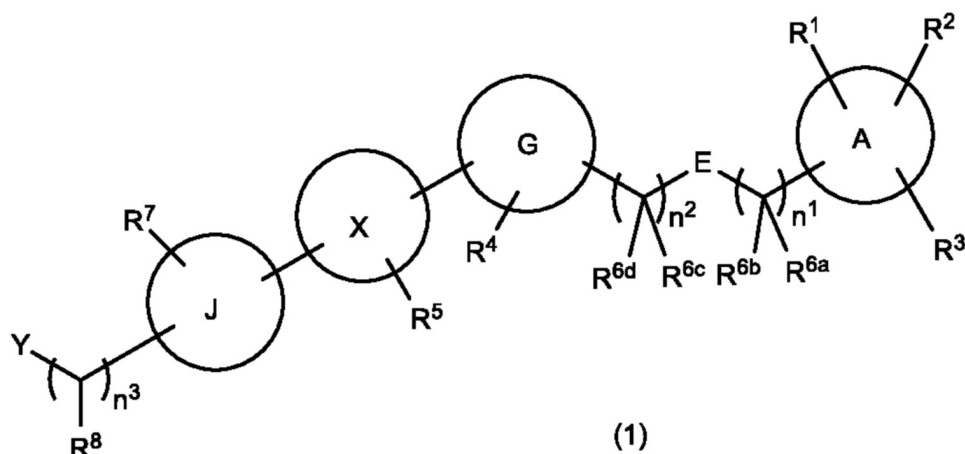
**ДАЙТИ САНКИО КОМПАНИ,  
ЛИМИТЕД (JP)**

(72) Автор(ы):

**ТАНИГУТИ, Тору (JP),  
ИВАМОТО, Осаму (JP),  
САИТО, Кеидзи (JP),  
НАКАДЗИМА, Кацуси (JP),  
ОГАВА, Ясуюки (JP),  
КУРИКАВА, Нобуя (JP),  
НАГАТА, Сейко (JP),  
ИТО, Каори (JP),  
КИОИ, Эрико (JP)**(54) **СОЕДИНЕНИЕ, ОБЛАДАЮЩЕЕ ЦИКЛИЧЕСКОЙ СТРУКТУРОЙ**

(57) Формула изобретения

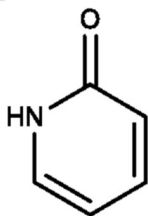
1. Соединение общей формулы (1) или его фармакологически приемлемая соль:



(1)

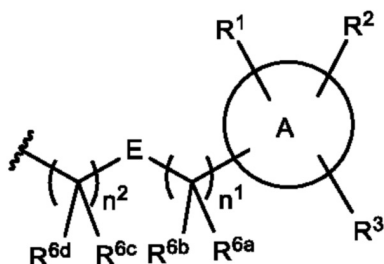
где обозначения в формуле определены ниже:

А: 5- - 6-членный ароматический гетероцикл, 4- - 7-членный насыщенный гетероцикл, бензол, циклогексан или кольцо, обладающее приведенной ниже структурой, где каждое из колец содержит по меньшей мере одну связь;



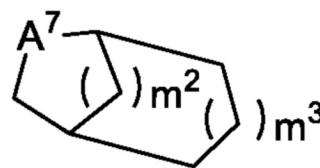
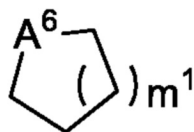
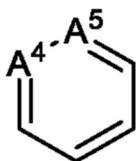
E:  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{O}-$  или ординарная связь;

G: 5-членный ароматический гетероцикл, где кольцо содержит по меньшей мере две связи; если кольцо содержит атом (атомы) азота, то по меньшей мере один из атомов азота находится после атома, который присоединен к правому фрагменту, где правый фрагмент означает приведенный ниже фрагмент соединения общей формулы (1):



где обозначения, указывающие соответствующие заместители, являются такими же, как определено выше;

X: любое кольцо, выбранное из числа приведенных ниже колец, где любое кольцо включает кольцо, сконденсированное с дополнительными атомами с образованием бициклического кольца, и где любое кольцо содержит по меньшей мере две связи:



где

$A^4$ ,  $A^5$ : все независимо означают  $-\text{CH}=\text{}$  или  $-\text{N}=\text{}$ ,

$A^6$ ,  $A^7$ : все независимо означают  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{O}-$ , или  $-\text{NH}-$ ,

$m^1$ ,  $m^2$ ,  $m^3$ : все независимо равны 0, 1, 2 или 3;

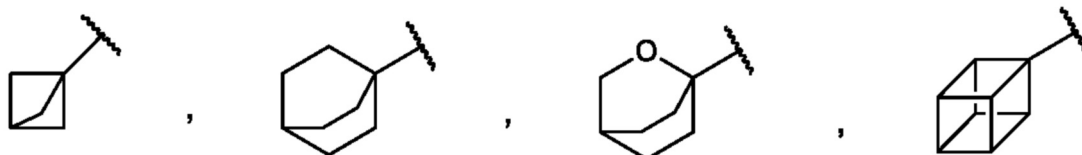
J: 5-членный ароматический гетероцикл, где J необязательно сконденсирован с X с образованием бициклической структуры, или 5-членный ненасыщенный гетероцикл, где кольцо содержит по меньшей мере две связи;

Y:

аминогруппа, необязательно замещенная 1-2 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^1$ ,

фенильная группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^1$ ,

C3-C8 циклоалкильная группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^1$ , где C3-C8 циклоалкильная группа необязательно описывается приведенными ниже мостиковыми структурами:

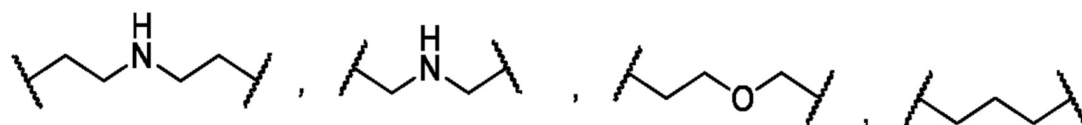


C3-C8 циклоалкенильная группа, обязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^1$ ,

4- - 7-членная насыщенная гетероциклическая группа, обязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^1$ ,

4- - 7-членная ненасыщенная гетероциклическая группа, обязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^1$ , или

группа, образованная путем присоединения к  $R^7$ , обязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^1$ , выбранных из числа следующих:



замещающая группа  $Y^1$ :

гидроксигруппа,

аминогруппа, обязательно замещенная 1-2 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^2$ ,

цианогруппа,

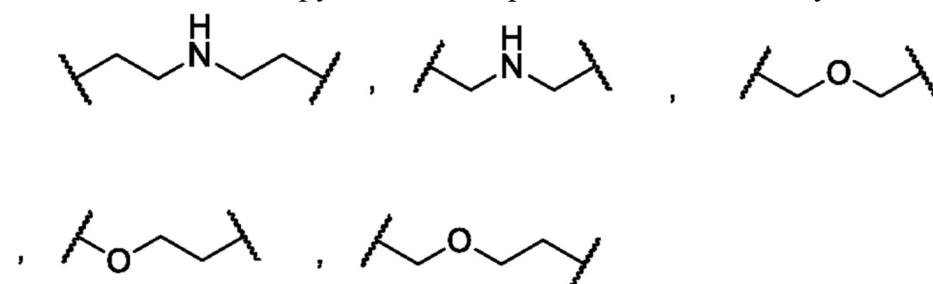
атом галогена,

C1-C6 алкильная группа, обязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^2$ ,

C1-C6 алкоксигруппа, обязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^2$ ,

4- - 7-членная насыщенная гетероциклическая группа, обязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^2$ , и

любая группа, обязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^2$ , выбранных из числа следующих:



замещающая группа  $Y^2$ :

гидроксигруппа,

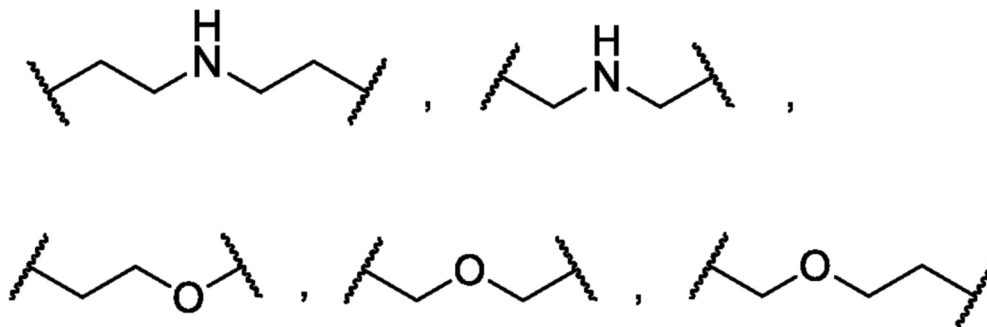
атом галогена,

C1-C6 алкильная группа, обязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^3$ ,

C1-C6 алкоксигруппа, обязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^3$ ,

аминогруппа, необязательно замещенная 1-2 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^3$ ,

4- - 7-членная насыщенная гетероциклическая группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^3$ , и любая группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^3$ , выбранных из числа следующих:

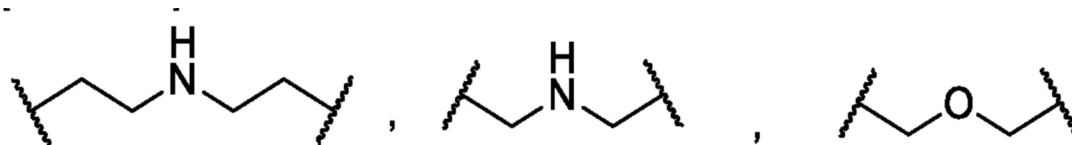


замещающая группа  $Y^3$ :

гидроксигруппа,  
атом галогена,  
цианогруппа,

C1-C6 алкильная группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^4$ ,

C1-C6 алкоксигруппа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^4$ , и любая группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^4$ , выбранных из числа следующих:



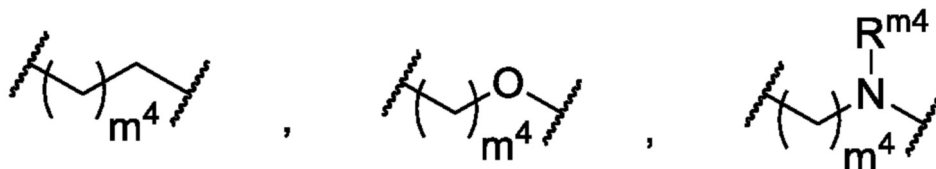
замещающая группа  $Y^4$ :

атом фтора;

$R^1, R^2, R^3$ : все независимо означают атом водорода, карбоксигруппу, цианогруппу, атом галогена, C1-C6 алкильную группу, C1-C6 алкоксигруппу, C3-C8 циклоалкильную группу, C3-C8 циклоалкоксигруппу, гидроксигруппу C1-C6 алкильную группу, галоген C1-C6 алкильную группу, галоген C1-C6 алкоксигруппу, C1-C6 алкоксикарбонильную группу, C1-C6 алкил C3-C8 циклоалкильную группу, C3-C8 циклоалкил C1-C6 алкоксигруппу, 4- - 7-членную ненасыщенную гетероциклическую группу, C1-C6 алкил-4- - 7-членную ненасыщенную гетероциклическую группу, ди(C1-C6 алкил)амино-4- - 7-членную ненасыщенную гетероциклическую группу, 4- - 7-членную ненасыщенную гетероциклическую карбонильную группу или C3-C8 циклоалкилкарбонильную группу;

$R^4$ : атом водорода, C1-C6 алкильная группа, галоген C1-C6 алкильная группа или группа, образованная путем присоединения к  $R^{6c}$  или  $R^{6d}$ , выбранных из числа следующих:

[Формула 10]



где  $m^4$  равно 0, 1 или 2, и  $R^{m4}$  означает атом водорода или метильную группу,  
 $R^5$ : атом водорода, атом галогена, или C1-C6 алкильная группа;  
 $R^{6a}$ ,  $R^{6b}$ ,  $R^{6c}$ ,  $R^{6d}$ : все независимо означают атом водорода или C1-C6 алкильную группу;

$R^7$ : ординарная связь, атом водорода или метильная группа;

$R^8$ : атом водорода или метильная группа; и

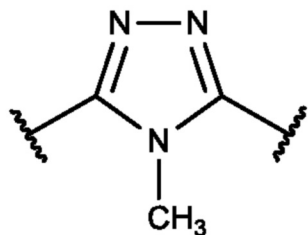
$n^1$ ,  $n^2$ ,  $n^3$ : все независимо равны 0, 1 или 2.

2. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по п. 1, где А означает 6-членный ароматический гетероцикл или бензол, каждый из которых содержит по меньшей мере одну связь.

3. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по п. 1, где А означает пиридин или бензол, каждый из которых содержит по меньшей мере одну связь.

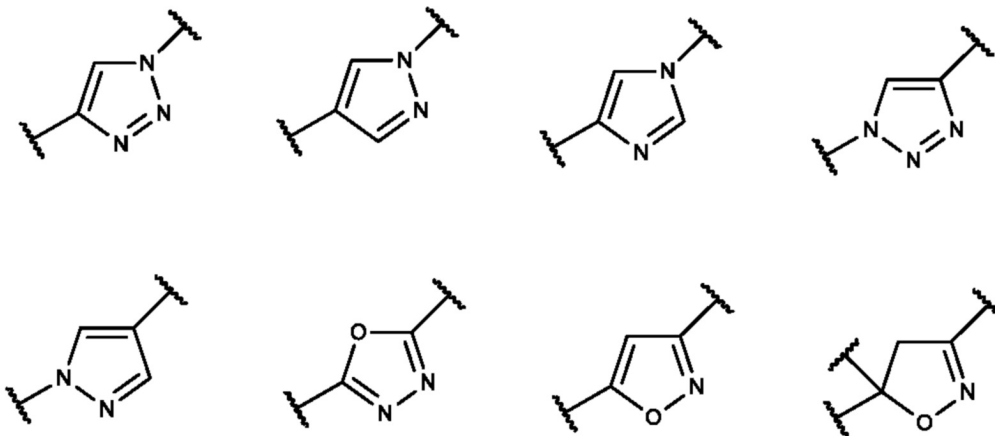
4. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по любому из пп. 1-3, где каждый из  $R^{6a}$ ,  $R^{6b}$ ,  $R^{6c}$  означает атом водорода,  $R^{6d}$  означает атом водорода или метильную группу,  $n^1$  равно 0,  $n^2$  равно 1 и Е означает -О-.

5. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по любому из пп. 1-4, где G представляет собой следующее:



6. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по любому из пп. 1-5, где Х означает бензол, пиридин или циклогексан, каждый из которых содержит по меньшей мере две связи, и  $R^5$  является таким, как определено выше.

7. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по любому из пп. 1-6, где J означает кольцо, выбранное из числа приведенных ниже кольцевых групп:



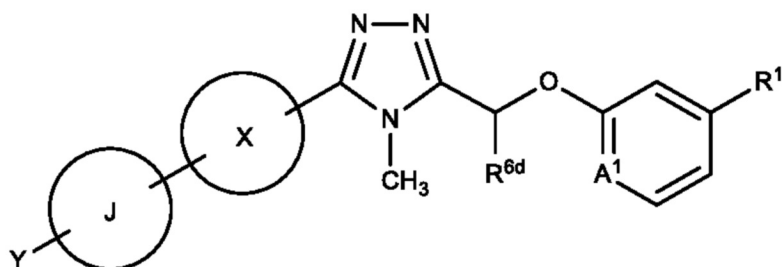
и  $R^7$  означает атом водорода или ординарную связь.

A 6 2 3 3 2 9 2 0 2 0 1 1 0 2 0 2 R U

R U 2 0 2 0 1 1 3 3 2 9 A

8. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по любому из пп. 1-7, где  $R^1$ ,  $R^2$ , и  $R^3$  все независимо означают атом водорода, карбоксигруппу, цианогруппу, атом фтора, атом хлора, метильную группу, изопропильную группу, трет-бутильную группу, трифторметильную группу, трифторметоксигруппу, циклопропилметоксигруппу, 1,1-дифтор-2-метилпропильную группу, 1,1-дифтор-2,2-диметилпропильную группу, 1-метил-1-циклобутильную группу, метоксикарбонильную группу, этоксикарбонильную группу, изопропоксикарбонильную группу, 1-гидрокси-1-метилэтильную группу, азетидин-1-карбонильную группу, 3-метилоксетан-3-ильную группу, 4,5-дигидрооксазол-2-ильную группу или циклопропилкарбонильную группу.

9. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по п. 1, которое представляет собой соединение общей формулы (1') или его фармакологически приемлемую соль:



(1')

где обозначения в формуле определены ниже:

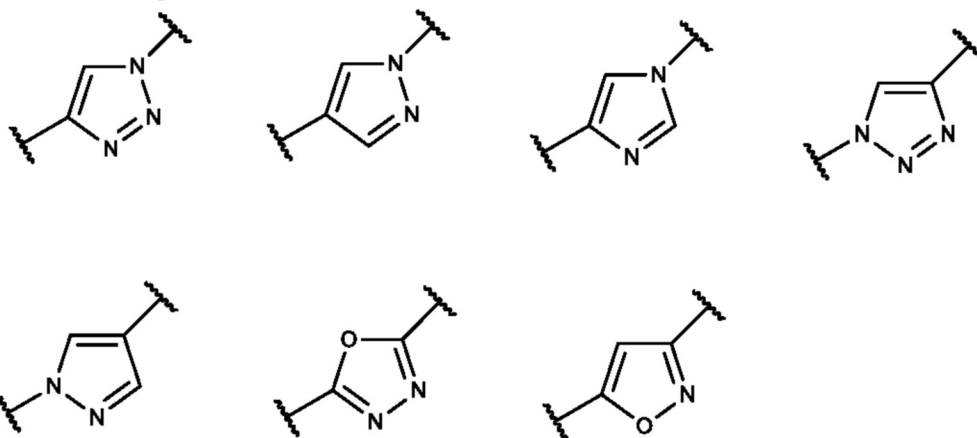
$R^1$ : атом водорода, карбоксигруппу, цианогруппа, атом фтора, атом хлора, метильная группа, изопропильная группа, трет-бутильная группа, трифторметильная группа, трифторметоксигруппа, циклопропилметоксигруппа, 1,1-дифтор-2-метилпропильная группа, 1,1-дифтор-2,2-диметилпропильная группа, 1-метил-1-циклобутильная группа, метоксикарбонильная группа, этоксикарбонильная группа, изопропоксикарбонильная группа, 1-гидрокси-1-метилэтильная группа, азетидин-1-карбонильная группа, 3-метилоксетан-3-ильная группа, 4,5-дигидрооксазол-2-ильная группа или циклопропилкарбонильная группа;

$R^{6d}$ : атом водорода или метильная группа;

$A^1$ : =N-, или =CH-;

X: бензол, пиридин или циклогексан, каждый из которых содержит 2 связи;

J: любое кольцо, выбранное из числа приведенных ниже кольцевых групп:



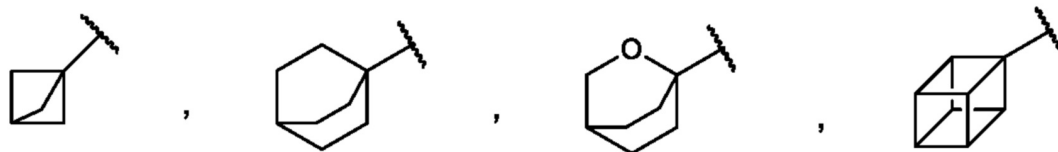
Y:

аминогруппа, необязательно замещенная 1-2 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^1$ ,

фенильная группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^1$ ,

любая группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^1$ , выбранных из числа следующих:

циклобутильная группа, циклопентильная группа, циклогексильная группа,



циклогексенильная группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^1$ ,

любая группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^1$ , выбранных из числа следующих:

пиперидинильная группа, азетидинильная группа, тетрагидропиранильная группа, морфолинильная группа или

тетрагидропиридинильная группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^1$ ;

замещающая группа  $Y^1$ :

гидроксигруппа,

аминогруппа, необязательно замещенная 1-2 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^2$ ,

цианогруппа,

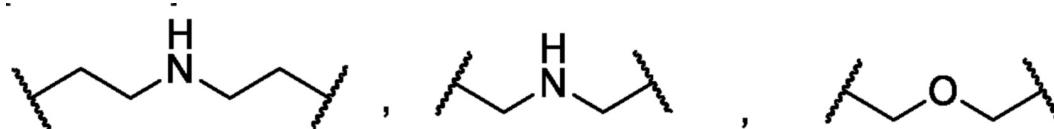
атом фтора,

метильная группа, этильная группа или изопропильная группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^2$ ,

метоксигруппа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^2$ ,

азетидинильная группа, пирролидинильная группа или морфолинильная группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^2$ , и

любая группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^2$ , выбранных из числа следующих:



замещающая группа  $Y^2$ :

гидроксигруппа,

атом фтора,

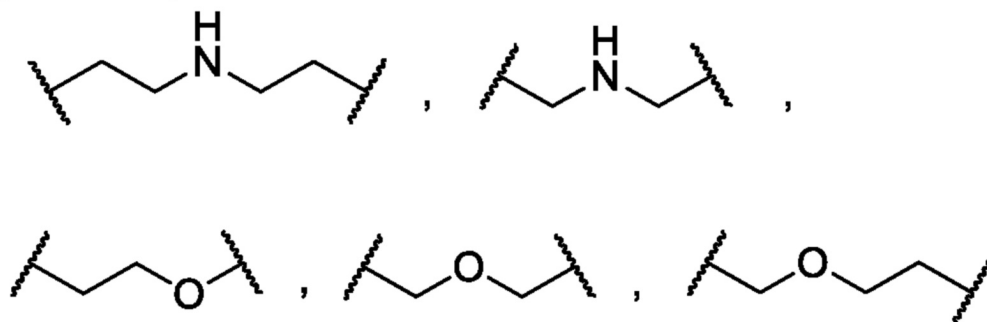
метильная группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^3$ ,

метоксигруппа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^3$ ,

аминогруппа, необязательно замещенная 1-2 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^3$ ,

азетидинильная группа, пирролидинильная группа или морфолинийная группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^3$ , и

любая группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными из числа заместителей группы  $Y^3$ , выбранных из числа следующих:



замещающая группа  $Y^3$ :

гидроксигруппа,

атом фтора,

цианогруппа,

метильная группа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными

из числа заместителей группы  $Y^4$ , и

метоксигруппа, необязательно замещенная 1-3 группами, независимо выбранными

из числа заместителей группы  $Y^4$ ;

замещающая группа  $Y^4$ :

атом фтора.

10. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по п. 1, выбранное из следующей группы:

4-Фтор-1-метил-4-{1-[транс-4-(4-метил-5-{(1R)-1-[3-(пропан-2-ил)фенокси]этил]-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)циклогексил]-1Н-1,2,3-триазол-4-ил}пиперидин,

4-{4-[(1R)-1-(Азетидин-1-ил)этил]фенил}-1-[транс-4-(4-метил-5-{[3-(пропан-2-ил)фенокси]метил}-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)циклогексил]-1Н-1,2,3-триазол,

(3R,6S)-N,N-Диметил-6-{1-[транс-4-(4-метил-5-{(1R)-1-[3-(пропан-2-ил)фенокси]этил]-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)циклогексил]-1Н-1,2,3-триазол-4-ил}тетрагидро-2Н-пиран-3-амин,

4-Фтор-1-метил-4-{1-[(3R,6S)-6-(4-метил-5-{[3-(пропан-2-ил)фенокси]метил}-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)тетрагидро-2Н-пиран-3-ил]-1Н-1,2,3-триазол-4-ил}пиперидин,

3-{транс-4-[4-(4-Фтор-1-метилпиперидин-4-ил)-1Н-1,2,3-триазол-1-ил]циклогексил}-8-[3-(трифторметил)фенокси]-5,6,7,8-тетрагидро[1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин,

1,5-Ангидро-6-азетидин-1-ил-2,3,4,6-тетрадезоксид-2-{4-[транс-4-(4-метил-5-{[3-(трифторметил)фенокси]метил}-4Н-1,2,4-триазол-3-ил)циклогексил]-1Н-1,2,3-триазол-1-ил}-D-эритро-гексит,

2-({5-[транс-4-(1-{транс-4-[3-(Фторметил)азетидин-1-ил]циклогексил]-1Н-1,2,3-триазол-4-ил)циклогексил]-4-метил-4Н-1,2,4-триазол-3-ил}метокси)-4-(трифторметил)пиридин,

3-(транс-4-{1-[транс-4-(Азетидин-1-ил)циклогексил]-1Н-пиразол-4-ил}циклогексил)-4-метил-5-{[3-(трифторметил)фенокси]метил}-4Н-1,2,4-триазол,

4-[транс-4-(4-{транс-4-[4-Метил-5-({[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]окси}метил)-4Н-1,2,4-триазол-3-ил]циклогексил]-1Н-пиразол-1-ил)циклогексил]морфолин,

6-[транс-4-(4-{транс-4-[4-Метил-5-({[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]окси}метил)-



4H-1,2,4-триазол-3-ил]циклогексил}-1H-пиразол-1-ил]циклогексил]-2-окса-6-азаспиро [3.3]гептан,

6-[транс-4-(4-{ транс-4-[4-Метил-5-({[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]окси} метил)-4H-1,2,4-триазол-3-ил]циклогексил}-1H-пиразол-1-ил]циклогексил]-1-окса-6-азаспиро [3.3]гептан,

2-[транс-4-(4-{ транс-4-[4-Метил-5-({[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]окси} метил)-4H-1,2,4-триазол-3-ил]циклогексил}-1H-пиразол-1-ил]циклогексил]-6-окса-2-азаспиро [3.4]октан,

{1-[транс-4-(4-{ транс-4-[4-Метил-5-({[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]окси} метил)-4H-1,2,4-триазол-3-ил]циклогексил}-1H-пиразол-1-ил]циклогексил]азетидин-3,3-диил} диметанол,

Метил-3-{[4-метил-5-(транс-4-{1-[транс-4-(2-окса-6-азаспиро[3.3]гепт-6-ил) циклогексил]-1H-пиразол-4-ил} циклогексил)-4H-1,2,4-триазол-3-ил]метокси}бензоат, и

8-Метил-3-[транс-4-(4-метил-5-{(1R)-1-[3-(пропан-2-ил)фенокси]этил}-4H-1,2,4-триазол-3-ил]циклогексил]-1-окса-2,8-диазаспиро[4.5]дец-2-ен.

11. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по п. 1, которое представляет собой 4-Фтор-1-метил-4-{1-[транс-4-(4-метил-5-{(1R)-1-[3-(пропан-2-ил)фенокси]этил}-4H-1,2,4-триазол-3-ил]циклогексил]-1H-1,2,3-триазол-4-ил} пиперидин.

12. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по п. 1, которое представляет собой (3R,6S)-N,N-Диметил-6-{1-[транс-4-(4-метил-5-{(1R)-1-[3-(пропан-2-ил)фенокси]этил}-4H-1,2,4-триазол-3-ил]циклогексил]-1H-1,2,3-триазол-4-ил} тетрагидро-2H-пиран-3-амин.

13. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по п. 1, которое представляет собой 2-({5-[транс-4-(1-{ транс-4-[3-(Фторметил)азетидин-1-ил]циклогексил}-1H-1,2,3-триазол-4-ил]циклогексил]-4-метил-4H-1,2,4-триазол-3-ил} метокси)-4-(трифторметил)пиридин.

14. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по п. 1, которое представляет собой 6-[транс-4-(4-{ транс-4-[4-Метил-5-({[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]окси} метил)-4H-1,2,4-триазол-3-ил]циклогексил}-1H-пиразол-1-ил]циклогексил]-2-окса-6-азаспиро[3.3]гептан.

15. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по п. 1, которое представляет собой 6-[транс-4-(4-{ транс-4-[4-Метил-5-({[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]окси} метил)-4H-1,2,4-триазол-3-ил]циклогексил}-1H-пиразол-1-ил]циклогексил]-1-окса-6-азаспиро[3.3]гептан.

16. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по п. 1, которое представляет собой 2-[транс-4-(4-{ транс-4-[4-Метил-5-({[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]окси} метил)-4H-1,2,4-триазол-3-ил]циклогексил}-1H-пиразол-1-ил]циклогексил]-6-окса-2-азаспиро[3.4]октан.

17. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по п. 1, которое представляет собой метил-3-{[4-метил-5-(транс-4-{1-[транс-4-(2-окса-6-азаспиро[3.3]гепт-6-ил)циклогексил]-1H-пиразол-4-ил} циклогексил)-4H-1,2,4-триазол-3-ил]метокси}бензоат.

18. Соединение или его фармакологически приемлемая соль по любому из пп. 1-17 для увеличения содержания II.

19. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение или его фармакологически приемлемую соль по любому из пп. 1-18 в качестве активного ингредиента.

20. Фармацевтическая композиция по п. 19 для предупреждения и/или лечения воспалительного заболевания.

21. Фармацевтическая композиция по п. 20, где воспалительное заболевание

представляет собой периферическое воспалительное заболевание.

22. Фармацевтическая композиция по п. 20, где воспалительное заболевание представляет собой центральное воспалительное заболевание.

23. Фармацевтическая композиция по п. 21, где периферическим воспалительным заболеванием является заболевание, выбранное из группы, включающей ревматоидный артрит, системную красную волчанку, склеродермию, бронхиальную астму, астматический бронхит, диффузная интерстициальная пневмония, хроническое обструктивное заболевание легких, язвенный колит, болезнь Крона, целиакию, анальную фистулу, лучевой энтероколит, острый гепатит, хронический гепатит, скоротечный гепатит, аутоиммунный гепатит, первичный билиарный цирроз, первичный склерозирующий холангит, алкогольный гепатит, неалкогольный стеатогепатит, цирроз, периферический неврит, анкилозирующий спондилит, экзему (острую, подострую, хроническую), контактный дерматит, солнечный (вызванный ультрафиолетовым излучением) дерматит, лучевой дерматит, атопический дерматит, себоррейный дерматит, псориаз, артропатический псориаз, псориаз эритродермию, пустулезный псориаз, красный плоский лишай, эритему, розовые угри, крапивницу, гнездную алопецию, пузырчатку, эритродермию, обыкновенные угри, пролежень, рану, ожог, конъюнктивит, кератит, склерит, острый/хронический отит среднего уха, круглогодичный аллергический ринит, сенную лихорадку, синусит, ларингит, эзофагит, устойчивый стоматит, глоссит, острое/хроническое воспаление слюнной железы, ангулярный хейлит, хейлит, болезнь Бехчета, рассеянный склероз, диабет типа I, диабет типа II, атеросклероз, панкреатит и хроническую сердечную недостаточность.

24. Фармацевтическая композиция по п. 21, где периферическим воспалительным заболеванием является заболевание, выбранное из группы, включающей ревматоидный артрит, системную красную волчанку, бронхиальную астму, язвенный колит, болезнь Крона, целиакию, анальную фистулу, лучевой энтероколит, острый гепатит, аутоиммунный гепатит, первичный билиарный цирроз, первичный склерозирующий холангит, алкогольный гепатит, неалкогольный стеатогепатит, анкилозирующий спондилит, контактный дерматит, солнечный (вызванный ультрафиолетовым излучением) дерматит, атопический дерматит, себоррейный дерматит, псориаз, артропатический псориаз, псориаз эритродермию, пустулезный псориаз, красный плоский лишай, эритему, розовые угри, гнездную алопецию, пузырчатку, эритродермию, обыкновенные угри, пролежень, рану, ожог, синусит, ларингит, эзофагит, устойчивый стоматит, глоссит, острое/хроническое воспаление слюнной железы, ангулярный хейлит, хейлит и болезнь Бехчета.

25. Фармацевтическая композиция по п. 21, где периферическим воспалительным заболеванием является заболевание, выбранное из группы, включающей ревматоидный артрит, системную красную волчанку, язвенный колит, болезнь Крона, целиакию, анальную фистулу, лучевой энтероколит, аутоиммунный гепатит, алкогольный гепатит, неалкогольный стеатогепатит, анкилозирующий спондилит, рану, устойчивый стоматит, глоссит и болезнь Бехчета.

26. Фармацевтическая композиция по п. 22, где центральным воспалительным заболеванием является заболевание, выбранное из группы, включающей болезнь Альцгеймера, болезнь Паркинсона, слабоумие с тельцами Леви, мультисистемную атрофию, болезнь Пика, прогрессирующий супрануклеарный паралич, дегенерацию базального ядра, долевою лобно-височную дегенерацию, болезнь Гентингтона, боковой амиотрофический склероз, бульбарную спинальную мышечную атрофию, спинальную мышечную атрофию, спиноцеребеллярную дегенерацию, рассеянный склероз, болезнь Крейтцфельда-Якоба, летальную семейную инсомнию, синдром Герстманна-Штреусслера-Шейнкера, синдром Дауна, болезнь Ниманна-Пика, амилоидную

ангиопатию головного мозга, HIV энцефалопатию, энцефалопатию, ассоциированную с вирусом гриппа, печеночную энцефалопатию, прогрессирующую мультифокальную лейкоэнцефалопатию, аутоиммунный анти-NMDA рецепторный энцефалит, цереброваскулярное нарушение, травматическое повреждение головного мозга, повреждение спинного мозга, гипоксическую энцефалопатию, эпилепсию, неврит зрительного нерва, врожденное метаболическое заболевание головного мозга, энцефалопатию Вернике, нарушение аутистического спектра, синдром дефицита внимания с гиперактивностью, тикозное расстройство, шизофрению, биполярное расстройство, большую депрессию (терапевтически резистентную депрессию, послеродовую депрессию), устойчивое депрессивное нарушение (дистимию), предменструальное расстройство настроения вследствие дискомфорта, тревожное нарушение, локализованную фобию, паническое расстройство, обсессивно-компульсивное расстройство, связанное с травмой и стрессовым фактором нарушение, пищевое расстройство, расстройство цикла сон/бодрствование вследствие нарушения циркадного ритма, нарколепсию, связанное с приемом веществ нарушение (алкоголизм, зависимость от лекарственного средства или наркотика), нарушение контроля импульсов, бред, личностное нарушение и синдром Ретта.

27. Фармацевтическая композиция по п. 22, где центральным воспалительным заболеванием является заболевание, выбранное из группы, включающей болезнь Альцгеймера, болезнь Паркинсона, слабоумие с тельцами Леви, мультисистемную атрофию, болезнь Пика, прогрессирующий супрануклеарный паралич, дегенерацию базального ядра, долевою лобно-височную дегенерацию, болезнь Гентингтона, боковой амиотрофический склероз, бульбарную спинальную мышечную атрофию, спинальную мышечную атрофию, спиноцеребеллярную дегенерацию, рассеянный склероз, болезнь Крейтцфельда-Якоба, шизофрению, биполярное расстройство, большую депрессию (терапевтически резистентную депрессию, послеродовую депрессию), устойчивое депрессивное нарушение (дистимию), предменструальное расстройство настроения вследствие дискомфорта, тревожное нарушение, локализованную фобию, паническое расстройство, обсессивно-компульсивное расстройство, связанное с травмой и стрессовым фактором нарушение, пищевое расстройство, расстройство цикла сон/бодрствование вследствие нарушения циркадного ритма, нарколепсию, связанное с приемом веществ нарушение (алкоголизм, зависимость от лекарственного средства или наркотика), нарушение контроля импульсов, бред, личностное нарушение и синдром Ретта.

28. Фармацевтическая композиция по п. 22, где центральным воспалительным заболеванием является заболевание, выбранное из группы, включающей шизофрению, биполярное расстройство, большую депрессию (терапевтически резистентную депрессию, послеродовую депрессию), устойчивое депрессивное нарушение (дистимию), предменструальное расстройство настроения вследствие дискомфорта, тревожное нарушение, локализованную фобию, паническое расстройство и обсессивно-компульсивное расстройство.

29. Применение соединения или его фармакологически приемлемой соли по любому из пп. 1-17 для приготовления лекарственного средства для применения для лечения воспалительного заболевания.

30. Способ предупреждения и/или лечения воспалительного заболевания, включающий введение эффективного количества фармацевтической композиции по п. 19.

31. Кристалл соединения по п. 11, обладающий пиками при углах дифракции ( $2\theta(^{\circ})$ ), равных примерно 3,9, 4,1, 8,34, 12,6, 16,2, 18,4, 19,5 и 22,3, определенных с помощью порошковой рентгенографии.

32. Кристалл соединения по п. 11, обладающий порошковой рентгенограммой,

приведенной на фиг. 1.

33. Кристалл соединения по п. 12, обладающий пиками при углах дифракции ( $2\theta(^{\circ})$ ), равных примерно 3,8, 16,4, 18,0, 18,6, 19,8, 21,2 и 22,7, определенных с помощью порошковой рентгенографии.

34. Кристалл соединения по п. 12, обладающий порошковой рентгенограммой, приведенной на фиг. 2.

35. Кристалл соединения по п. 13, обладающий пиками при углах дифракции ( $2\theta(^{\circ})$ ), равных примерно 13,5, 15,7, 17,2, 17,8, 18,2, 19,2, 20,4, 20,8, 22,0 и 27,2, определенных с помощью порошковой рентгенографии.

36. Кристалл соединения по п. 13, обладающий порошковой рентгенограммой, приведенной на фиг. 3.

37. Кристалл соединения по п. 14, обладающий пиками при углах дифракции ( $2\theta(^{\circ})$ ), равных примерно 3,3, 13,4, 15,5, 16,8, 17,5, 17,9, 18,9, 20,4, 21,8 и 26,9, определенных с помощью порошковой рентгенографии.

38. Кристалл соединения по п. 14, обладающий порошковой рентгенограммой, приведенной на фиг. 4.

39. Кристалл соединения по п. 15, обладающий пиками при углах дифракции ( $2\theta(^{\circ})$ ), равных примерно 13,2, 15,8, 16,5, 17,8, 18,1, 20,3, 20,8, 21,4 и 27,9, определенных с помощью порошковой рентгенографии.

40. Кристалл соединения по п. 15, обладающий порошковой рентгенограммой, приведенной на фиг. 5.

41. Кристалл соединения по п. 16, обладающий пиками при углах дифракции ( $2\theta(^{\circ})$ ), равных примерно 14,2, 16,8, 17,4, 18,2, 18,6, 19,5, 20,0, 20,9, 21,6 и 21,8, определенных с помощью порошковой рентгенографии.

42. Кристалл соединения по п. 16, обладающий порошковой рентгенограммой, приведенной на фиг. 6.

43. Кристалл соединения по п. 17, обладающий пиками при углах дифракции ( $2\theta(^{\circ})$ ), равных примерно 15,4, 17,6, 17,9, 18,4, 18,7, 19,2, 20,2, 20,7, 23,0 и 23,8, определенных с помощью порошковой рентгенографии.

44. Кристалл соединения по п. 17, обладающий порошковой рентгенограммой, приведенной на фиг. 7.