



(51) МПК
C07D 211/64 (2006.01)
A61P 19/10 (2006.01)

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
 ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
 ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: 2004126953/04, 07.02.2003

(30) Приоритет: 08.02.2002 JP 2002-31602

(43) Дата публикации заявки: 27.01.2006 Бюл. № 03

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу: 08.09.2004

(86) Заявка РСТ:
 JP 03/01318 (07.02.2003)

(87) Публикация РСТ:
 WO 03/066590 (14.08.2003)

Адрес для переписки:
 129010, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3,
 ООО "Юридическая фирма Городисский и
 Партнеры", пат.пов. Г.Б. Егоровой

(71) Заявитель(и):
 ОНО ФАРМАСЬЮТИКАЛ КО., ЛТД. (JP)

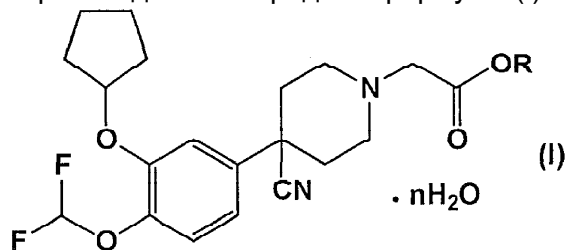
(72) Автор(ы):
 ОТИАЙ Хироси (JP),
 НИСИТА Йоситака (JP),
 ОХТАНИ Тазуми (JP),
 ХАМАНО Масая (JP)

(74) Патентный поверенный:
 Егорова Галина Борисовна

(54) **ПРОИЗВОДНОЕ ПИПЕРИДИНА И ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ КОМПОЗИЦИЯ, ВКЛЮЧАЮЩАЯ ЕГО В КАЧЕСТВЕ АКТИВНОГО ИНГРЕДИЕНТА**

Формула изобретения

1. Производное пиперидина формулы (I)



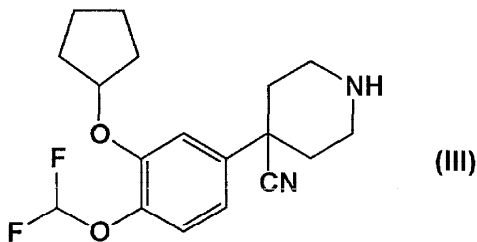
где R обозначает водород, атом щелочного металла, атом щелочно-земельного металл или органический амин, n равно целому числу от 1 до 5 или обозначает соответствующую фракцию или несоответствующую фракцию до 5.

2. Производное пиперидина по п.1, в котором R обозначает водород.

3. Производное пиперидина по п.1, в котором n равно 1.

4. Соединение по любому из пп.1-3, которое представляет собой моногидрат 2-(4-(3-циклопентилокси-4-дифторметоксифенил)-4-цианопиперидин-1-ил)уксусной кислоты.

5. 4-(3-циклопентилокси-4-дифторметоксифенил)-4-цианопиперидин формулы (III) или его кислотно-аддитивная соль



6. Способ получения 2-(4-(3-циклопентилокси-4-дифторметоксифенил)-4-цианопиперидин-1-ил)уксусной кислоты nH_2O , где n имеет значение, указанное в п.1, который включает проведение перекристаллизации из спиртового растворителя, необязательно смешанного с водой и/или из одного или более органического растворителя.

7. Ингибитор ФДЭ4, включающий соединение по любому из пп.1-4 в качестве активного ингредиента.

8. Композиция для предупреждения и/или лечения воспалительных заболеваний, диабета, аллергических заболеваний, аутоиммунных заболеваний, глазных болезней, остеопороза, перелома кости, остеоартрита, ожирения, булимии, депрессии, болезни Паркинсона, деменции, ишемического реперфузионного повреждения, лейкемии, СПИДа, шока, системных воспалительных заболеваний (SIRS), включающая соединение по любому из пп. 1-4 в качестве активного ингредиента.

9. Композиция для предупреждения и/или лечения по п.8, отличающаяся тем, что указанное воспалительное заболевание представляет собой астму, хроническую обструктивную болезнь легких, сепсис, саркоидоз, нефрит, гепатит или энтерит.

10. Композиция для предупреждения и/или лечения по п.8, отличающаяся тем, что указанное аллергическое заболевание представляет собой аллергический ринит или атопический дерматит.

11. Композиция для предупреждения и/или лечения по п.8, отличающаяся тем, что указанное аутоиммунное заболевание представляет собой язвенный колит, болезнь Крона, ревматизм, псориаз, рассеянный склероз или коллагеновую болезнь.

12. Композиция для предупреждения и/или лечения по п.8, отличающаяся тем, что указанная глазная болезнь представляет собой аллергический конъюнктивит или сезонный конъюнктивит.