



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3183242 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 309/06 (2006.01)
A61K 31/133 (2006.01)
A61K 31/135 (2006.01)
A61K 31/353 (2006.01)
A61K 31/36 (2006.01)
A61K 31/47 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.09.27
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.05.19
(86)	European Application Nr.	15756772.8
(86)	European Filing Date	2015.08.20
(87)	The European Application's Publication Date	2017.06.28
(30)	Priority	2014.08.20, US, 201462039622 P
(84)	Designated Contracting States:	AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
	Designated Extension States:	BA ; ME
(73)	Proprietor	Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province Line Road, Princeton, NJ 08543, USA
(72)	Inventor	XIAO, Hai-Yun, c/o Bristol-Myers Squibb CompanyRoute 206 & Province Line Road, Princeton, New Jersey 08543, USA DYCKMAN, Alaric J., c/o Bristol-Myers Squibb CompanyRoute 206 & Province Line Road, Princeton, New Jersey 08543, USA XIAO, Zili, c/o Bristol-Myers Squibb CompanyRoute 206 & Province Line Road, Princeton, New Jersey 08543, USA YANG, Michael G., c/o Bristol-Myers Squibb CompanyRoute 206 & Province Line Road, Princeton, New Jersey 08543, USA DHAR, T.G. Murali, c/o Bristol-Myers Squibb CompanyRoute 206 & Province Line Road, Princeton, New Jersey 08543, USA GILMORE, John L., c/o Bristol-Myers Squibb CompanyRoute 206 & Province Line Road, Princeton, New Jersey 08543, USA MARCOUX, David, c/o Bristol-Myers Squibb CompanyRoute 206 & Province Line Road, Princeton, New Jersey 08543, USA
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54) Title **SUBSTITUTED BICYCLIC COMPOUNDS**

(56) References

Cited:

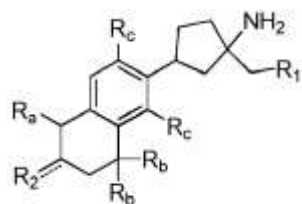
WO-A2-2014/130752

WO-A1-2008/079382

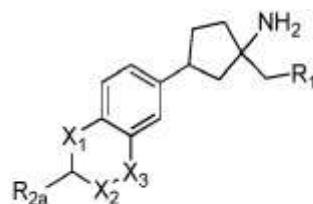
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

Patentkrav**1. Forbindelse av formel (I), (II), (III), (IV) eller (V):**

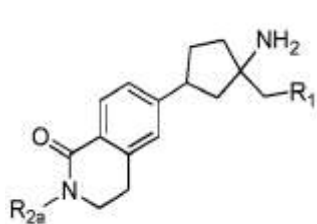
5



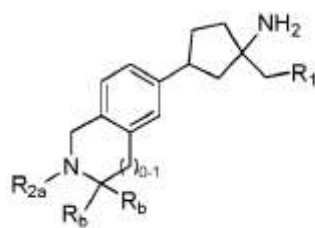
(I)



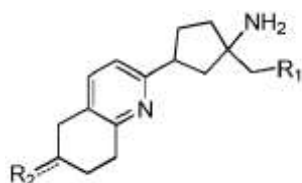
(II)



(III)



(IV)



(V)

10 eller et salt derav, hvori:

R₁ er -OH eller -OP(O)(OH)₂;X₁ er CH₂ eller O;X₂ er CH₂ eller O;X₃ er CH₂ eller O, forutsatt at X₂ bare er O dersom både X₁ og X₃ er hver CH₂;15 R₂ er R_{2a} eller R_{2b};----- representerer enten en enkeltbinding til R_{2a} eller en dobbeltbinding til R_{2b};

R_{2a} er -(CH₂)₃₋₆CH₃, -(CH₂)₁₋₄CH=CR_xR_x, -(CH₂)₁₋₄CH=CR_x(CH₂CH₃), -CH=CH(CH₂)₁₋₃C(R_x)₃, -CH=CH(CH₂)₁₋₃OCH₃, -(CH₂)₁₋₃CH=CHCH=CR_xR_x, -CH=CH(CH₂)₁₋₃CH=CR_xR_x, -CH=CHR_z, -(CH₂)₁₋₃R_z, -(CH₂)₁₋₃O(CH₂)₀₋₃R_z, -(CH₂)₁₋₃S(CH₂)₀₋₃R_z, -CH₂S(O)R_z,

20 -CH₂S(O)₂R_z, -O(CH₂)₁₋₂R_z, -O(CH₂)₁₋₂O(CH₂)₀₋₂R_z, -OC(O)R_z, -(CH₂)₁₋₄O(CH₂)₀₋₉C(R_x)₃, -(CH₂)₁₋₄O(CH₂)₀₋₉CF₃, -(CH₂)₁₋₄CR_xR_xO(CH₂)₀₋₄C(R_x)₃, -(CH₂)₁₋₃O(CH₂)₁₋₄CH=CR_x(CH₂)₀₋₃CH₃, -(CH₂)₁₋₃O(CH₂)₁₋₄CH=CR_xR_x, -(CH₂)₁₋₃O(CH₂)₁₋₄C(OH)R_xR_x, -(CH₂)₁₋₃O(CH₂)₁₋₄O(CH₂)₀₋₃CH₃, -(CH₂)₁₋₃S(CH₂)₀₋₄C(R_x)₃, -(CH₂)₀₋₃O(CH₂)₁₋₄S(CH₂)₀₋₃C(R_x)₃, -(CH₂)₁₋₃S(CH₂)₁₋₄Si(CH₃)₃, -(CH₂)₁₋₃S(O)(CH₂)₀₋₄C(R_x)₃, -(CH₂)₁₋₃S(O)₂(CH₂)₀₋₄C(R_x)₃,

25 -(CH₂)₁₋₅NR_xR_x, -O(CH₂)₁₋₇C(R_x)₃, -O(CH₂)₁₋₄O(CH₂)₀₋₄C(R_x)₃, -O(CH₂)₁₋₄CH=CR_x(CH₂)₀₋₃CH₃, -O(CH₂)₁₋₄O(CH₂)₀₋₃C(R_x)₃, -O(CH₂)₁₋₄O(CH₂)₁₋₃CH=CR_xR_x, -O(CH₂)₁₋₄O(CH₂)₁₋₃C≡CR_x, -C(O)(CH₂)₀₋₄C(R_x)₃, -OC(O)(CH₂)₀₋₄C(R_x)₃, -OC(O)CR_xR_x(CH₂)₀₋₄C(R_x)₃,

$-\text{OC}(\text{O})\text{NR}_x(\text{CH}_2)_{0-5}\text{C}(\text{R}_x)_3$, $-\text{NR}_x\text{C}(\text{O})\text{NR}_x(\text{CH}_2)_{0-5}\text{C}(\text{R}_x)_3$, $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-\text{O}(\text{CH}_2)_{0-5}\text{C}(\text{R}_x)_3$,
 $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-\text{O}(\text{CH}_2)_{1-2}(\text{fenyl})$, $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-\text{O}(\text{CH}_2)_{1-2}(\text{fluorfenyl})$, $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-\text{O}(\text{CH}_2)_{1-2}(\text{metoksyfenyl})$, fenyl eller pyridinyl;

R_{2b} er

- 5 (i) en 6-leddet spiroring som har ett oksygenatom og substituert med null eller $1-(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$; eller

(ii) $=\text{N}-\text{O}-(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$, $=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $=\text{N}-\text{OCH}_2\text{CH}_2(\text{fenyl})$ eller $=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{fenyl})$;

R_a er H eller $-\text{OH}$;

- 10 hver R_b er uavhengig H eller $-\text{CH}_3$;

hver R_c er uavhengig H, Cl, I eller $-\text{CH}_3$;

hver R_x er uavhengig H eller $-\text{CH}_3$; og

R_z er fenyl, imidazolyl, pyrazolyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, kinolinyl, tiofenyl, tiazolyl, oksetanyl, C_{3-6} sykloalkyl, adamantanyl eller tetrahydropyranyl, hver substituert

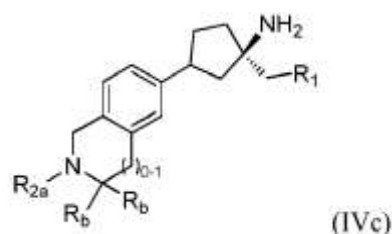
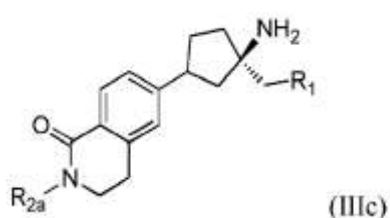
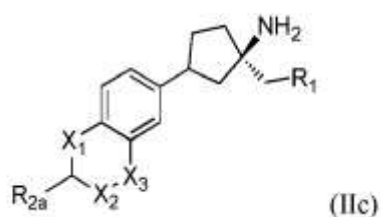
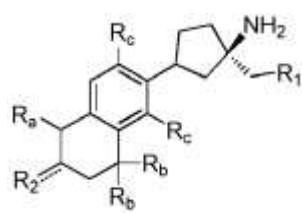
- 15 med null til 4 substituerter uavhengig valgt fra F, Cl, I,

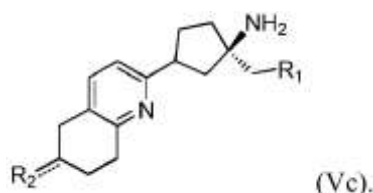
C_{1-4} alkyl, $-\text{O}(\text{C}_{1-3}\text{-alkyl})$, $-\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-(\text{CH}_2)_{1-6}\text{OCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{NR}_x\text{R}_x$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_x\text{R}_x$,
 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_x(\text{C}_{1-4}\text{alkyl})$ og $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}_x\text{R}_x$.

med forbehold om at (i) dersom forbindelsen har strukturen av formel (I) og R_2 er $-(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$, så er minst én av R_b og R_c ikke H; og (ii) dersom forbindelsen har strukturen

- 20 av formel (II) og X_1 , X_2 og X_3 er hver CH_2 , så er R_{2a} ikke $-(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$.

2. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen har strukturen av formel (Ic), (IIc), (IIIc), (IVc) eller (Vc):





3. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 2, som har strukturen av formel (I) eller et salt derav, hvori:

- 5 R_1 er -OH eller -OP(O)(OH)₂;
 R_2 er R_{2a} eller R_{2b} ;
 R_{2a} er -(CH₂)₃CH₃, -(CH₂)₅CH₃, -CH₂CH=CHCH₂CH₃, -CH₂CH₂CH=CHCH₂CH₃,
 -(CH₂)₃CH=CHCH₃, -(CH₂)₃CH=C(CH₃)₂, -(CH₂)₄CH=CH₂, -(CH₂)₄CH=CHCH₃,
 -CH=CH(CH₂)₃CH₃, -CH=CH(CH₂)₃OCH₃, -CH=CHCH₂CH₂CH(CH₃)₂,
 10 -CH=CHCH₂CH₂CH₂OCH₃, -CH₂CH=CHCH=CHCH₃, -CH=CHCH₂CH₂CH=CH₂,
 -CH=CH(fenyl) hvori fenylet er substituert med -CH₃
 eller -OCH₃; -CH=CH(tetrahydropyranyl), -(CH₂)₁₋₃(fenyl) hvori fenylet er substituert med
 null til 2 substituent uavhengig valgt fra F, I, -CH₃, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -OCH(CH₃)₂, og
 -CH₂C(O)N(CH₃)₂; -(CH₂)₂(metylimidazolyl), -(CH₂)₂(metylpyrazolyl), -(CH₂)₁₋₂(pyridinyl)
 15 hvori pyridinylet er substituert med null til 1 substituent valgt
 fra -OCH₃; -(CH₂)₂(pyrimidinyl), -(CH₂)₂(kinolinyl), -(CH₂)₂₋₃(tetrahydropyranyl),
 -CH₂O(CH₂)₃₋₄CH₃, CH₂OCH₂CH₂CH(CH₃)₂, -CH₂OCH₂CH₂C(CH₃)₃, -CH₂O(CH₂)₉CH₃,
 -CH₂OCH₂CH₂CH₂CF₃, -CH₂OCH₂CH=CHCH₂CH₃, -CH₂OCH₂CH=C(CH₃)₂,
 -CH₂OCH₂CH=CHCH₂CH₂CH₃, -CH₂OCH₂CH₂CH=CH₂, -CH₂OCH₂CH₂CH₂CH=CH₂,
 20 -CH₂OCH₂CH₂CH=C(CH₃)₂, -CH₂OCH₂CH₂CH(OH)CH₃, -CH₂OCH₂CH₂CH₂CH₂OH,
 -CH₂OCH₂CH₂CH₂C(CH₃)₂(OH), -CH₂OCH₂CH₂OCH₃, -CH₂OCH₂CH₂CH₂OCH₃,
 -CH₂OCH₂CH₂OCH₂CH₂CH₃, -CH₂O(fenyl) hvori fenylet er substituert med null til 3
 substituent uavhengig valgt fra F, Cl, -CH₃, -CH(CH₃)₂, -C(CH₃)₃, -OCH₃, -OCF₃,
 -(CH₂)₁₋₆OCH₃, -C(O)N(CH₃)₂, -CH₂N(CH₃)₂, -C(O)N(CH₂CH₃)(CH₃),
 25 -C(O)N(CH₃)(CH₂CH₂CH₂CH₃),
 og -C(O)N(CH₃)(CH₂CH(CH₃)₂); -CH₂O(metoksypyridinyl), -CH₂O(tetrahydropyranyl),
 -CH₂O(trifluormetyl, metylpyrazolyl), -CH₂OCH₂(fenyl) hvori fenylet er substituert med
 null til 1 substituent valgt fra -CH₃ og -OCH₃; -CH₂OCH₂(metylpyrazolyl),
 -CH₂OCH₂(tetrahydropyranyl), -CH₂OCH₂(tiofenyl), -CH₂OCH₂(trifluormetyltiofenyl),
 30 -CH₂OCH₂(etylthiofenyl), -CH₂OCH₂(dimetylthiofenyl), -CH₂CH₂OCH₂CH₃,
 -CH₂CH₂OCH₂CH(CH₃)₂, -CH₂CH₂O(metoksyfenyl), -CH₂CH₂OCH₂(syklopropyl),
 -CH₂CH₂SCH(CH₃)₂, -(CH₂)₃OCH₂CH₃, -(CH₂)₃OCH(CH₃)₂, -(CH₂)₃OCH₂CH₂CH=CH₂,
 -(CH₂)₃O(oksetanyl), -(CH₂)₃O(tetrametylsykloheksyl), -(CH₂)₃OCH₂SCH₃, -CH₂S(CH₂)₂-
 4CH₃, -CH₂SCH(CH₃)₂, -CH₂SCH₂CH(CH₃)₂, -CH₂SCH₂C(CH₃)₃, -CH₂SCH₂CH₂CH(CH₃)₂,
 35 -CH₂SCH₂CH₂C(CH₃)₃, -CH₂SCH₂CH₂Si(CH₃)₃, -CH₂CH₂S(CH₂)₁₋₂CH₃,

- CH₂CH₂SCH₂CH(CH₃)₂, -CH₂S(fenyl) hvori fenylet er substituert med null til 2 substituent uavhengig valgt fra -CH₃, -CH(CH₃)₂ og -OCH₃; -CH₂S(adamantanyl), -CH₂S(pyridinyl), -CH₂S(metylpyridinyl), -CH₂SCH₂CH₂(fenyl), -CH₂SCH₂CH₂(pyrazinyl), -CH₂SCH₂CH₂(pyridinyl), -CH₂S(O)(CH₂)₃CH₃, -CH₂S(O)₂(CH₂)₃CH₃, -CH₂S(O)(fenyl),
- 5 -CH₂S(O)₂(fenyl), -(CH₂)₄OCH(CH₃)₂, -(CH₂)₄CH(CH₃)OCH₃, -(CH₂)₄C(CH₃)₂OCH₃, -(CH₂)₅N(CH₃)₂, -O(CH₂)₄₋₇CH₃, -OCH₂CH₂O(CH₂)₂₋₄CH₃, -OCH₂CH₂OCH₂CH(CH₃)₂, -OCH₂CH=CH(CH₂)₂₋₃CH₃, -OCH₂CH₂OCH₂CH=CH₂, -OCH₂CH₂OCH₂CH=CH(CH₃), -OCH₂CH₂OCH₂CH=C(CH₃)₂, -OCH₂CH₂OCH₂CH₂C≡CH, -OCH₂CH₂O(CH₂)₂₋₃CH(CH₃)₂, -OCH₂CH₂S(CH₂)₂CH₃, -OCH₂(sykloheksyl), -OCH₂(tetrahydropyranyl), -OCH₂(fenyl) hvori
- 10 fenylet er substituert med null til 1 substituent valgt fra -CH₃, -CH₂CH₃, -OCH₃, -OCF₃, og -OCH₂CH₃; -OCH₂CH₂O(sykloheksyl), -OCH₂CH₂O(metylphenyl), -OCH₂CH₂OCH₂(syklobutyl), -OCH₂CH₂OCH₂(fenyl), -OCH₂CH₂OCH₂(tiazolyl), -OCH₂CH₂OCH₂(tiofenyl), -OC(O)(CH₂)₄CH₃, -OC(O)C(CH₃)₂(CH₂)₃CH₃, -OC(O)(fenyl), -OC(O)NH(CH₂)₃CH₃, -OC(O)NH(CH₂)₅CH₃, -OC(O)N(CH₃)(CH₂)₃CH₃,
- 15 -OC(O)N(CH₃)(CH₂)₄CH₃, -NHC(O)NH(CH₂)₃CH₃, -C(CH₃)=N-O(CH₂)₃CH₃, -C(CH₃)=N-OCH₂(fenyl), -C(CH₃)=N-OCH₂(fluorfenyl), -C(CH₃)=N-OCH₂(metoksyfenyl), -C(CH₃)=N-OCH₂CH₂(fenyl), -OC(O)NH(CH₂)₃CH₃, -OC(O)NH(CH₂)₅CH₃, -OC(O)N(CH₃)(CH₂)₃₋₄CH₃, -NHC(O)NH(CH₂)₃CH₃, fenyl eller pyridinyl;
- R_{2b} er:
- 20 (i) 6-leddet spiroring som har ett oksygenatom og er substituert med null eller 1 -(CH₂)₃CH₃; eller
- (ii) =N-O-(CH₂)₃CH₃, =N-O-CH₂CH(CH₃)₂, =N-OCH₂CH₂(fenyl) eller =N-O-CH₂CH₂CH₂(fenyl);
- R_a er H eller -OH;
- 25 hver R_b er uavhengig H eller -CH₃; og
- hver R_c er uavhengig H, Cl, I eller -CH₃.

4. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 2, som har strukturen av formel (II) eller et salt derav; hvori:

- 30 R₁ er -OH eller -OP(O)(OH)₂;
- X₁ er CH₂ eller O;
- X₂ er CH₂ eller O;
- X₃ er CH₂ eller O; forutsatt at X₂ er O bare dersom både X₁ og X₃ er hver CH₂; og
- R_{2a} er -(CH₂)₅₋₆CH₃ eller -CH₂O(CH₂)₃₋₄CH₃.

35

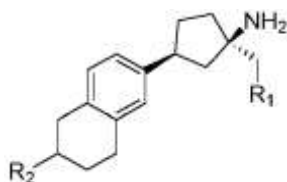
5. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 2, som har en struktur av formel (III), formel (IV) eller formel (V) eller et salt derav; hvori:

R₁ er -OH eller -OP(O)(OH)₂;

R_2 er R_{2a} ;

R_{2a} er $-(CH_2)_3CH_3$, $-(CH_2)_5CH_3$, $-(CH_2)_3(\text{fenyl})$ eller $-C(O)(CH_2)_4CH_3$; og
hver R_b er $-CH_3$.

- 5 **6.** Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen:

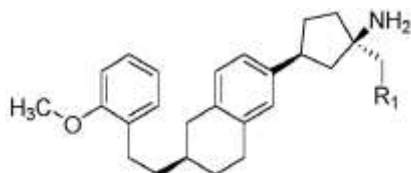


eller et salt derav; hvori:

R_1 er $-OH$ eller $-OP(O)(OH)_2$; og

- 10 R_2 er $-(CH_2)_5OCH_3$, $-(CH_2)_3OCH_2CH_3$, $-CH_2O(\text{metoksyfenyl})$,
eller $-CH_2CH_2(\text{metoksyfenyl})$.

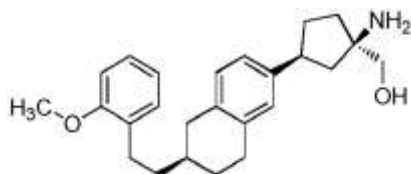
- 7.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst af kravene 1 til 3 og 6 som har strukturen:



eller et salt derav; hvori:

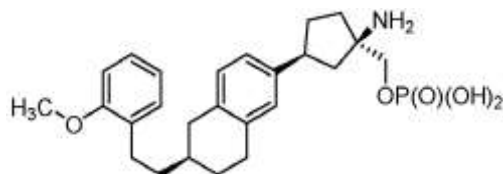
- 15 R_1 er $-OH$ eller $-OP(O)(OH)_2$.

- 8.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst af kravene 1 til 3 og 6 til 7 som har strukturen:



- 20 eller et salt derav.

- 9.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst af kravene 1 til 3 og 6 til 7 som har strukturen:



- 25 eller et salt derav.

10. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 9 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav; og en farmasøytisk akseptabel bærer.

5 **11.** Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 10, hvori R_1 er -OH i forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

12. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse som et medikament.

10

13. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ved behandling av en sykdom eller lidelse assosiert med aktiviteten til G-proteinkoblet reseptor $5P_1$, hvori sykdommen eller lidelsen velges fra transplantasjon av organer eller vev, transplantat-versus-mot-sykdommer forårsaket av transplantasjon, autoimmune syndromer inkludert revmatoid artritt, juvenil idiopatisk artritt, systemisk lupus erythematosus, kutan lupus erythematosus (inkludert diskoid lupus erythematosus og subakutt lupus erythematosus) og lupusnefritt, Hashimotos tyreoiditt, myasthenia gravis, diabetes type I, uveitt, koroiditt, allergisk encefalomyelitt, glomerulonefritt, post-infeksjonelle autoimmune sykdommer inkludert revmatisk feber og postinfeksiøs glomerulonefritt, inflammatoriske og hyperproliferative hudsykdommer, psoriasis, psoriasisartritt, atopisk dermatitt, kontaktdermatitt, eksematøs dermatitt, seboréisk dermatitt, lichen planus, pemphigus, bulløs pemfigoid, epidermolysis bullosa, urtikaria, angioødemer, vaskulitt inkludert ANCA-assosiert vaskulitt, kjempecellearteritt, Takayasu arteritt, mikroskopisk poliangiitt, vaskulitt i sentralnervesystemet, Churg-Strauss syndrom og revmatoid vaskulitt, erytem, kutan eosinofili, akne, alopecia areata, keratokonjunktivitt, vernal konjunktivitt, uveitt assosiert med Behcets sykdom, keratitt, herpetisk keratitt, konisk hornhinne, dystrophia epithelialis corneae, hornhinneleukom, okulær pemfigus, Moorens sår, skleritt, Graves oftalmopati, Vogt-Koyanagi-Harada syndrom, sarkoidose, pollenallergier, reversibel obstruktiv luftveissykdom, bronkialastma, allergisk astma, iboende astma, ekstrinsisk astma, støvastma, kronisk eller ufrivillig astma, senastma og luftveishyperrespons, bronkitt, magesår, vaskulær skade forårsaket av iskemiske sykdommer og trombose, iskemiske tarmsykdommer, inflammatoriske tarmsykdommer, nekrotiserende enterokolitt, tarmlesjoner assosiert med termiske forbrenninger, cøliaki, proktitt, eosinofil gastroenteritt, mastocytose, Crohns sykdom, ulcerøs kolitt, migrene, rhinitt, eksem, interstitiell nefritt, Goodpastures syndrom, hemolytisk-uremisk syndrom, diabetisk nefropati, multippel myositt, Guillain-Barré syndrom, Ménières sykdom, polynevritt, multippel nevritt, mononevritt, radikulopati, hypertyreoidisme, Basedows sykdom, ren rødcelleaplasi, aplastisk anemi,

15

20

25

30

35

hypoplastisk anemi, idiopatisk trombocytopenisk purpura, autoimmun hemolytisk anemi, agranulocytose, pernisiøs anemi, megaloblastisk anemi, anerytroplasi, osteoporose, sarkoidose, fibroid lunge, idiopatisk interstitiell lungebetennelse, dermatomyositt, leukoderma vulgaris, ichthyosis vulgaris, fotoallergisk følsomhet, kutant T-cellelymfom, arteriosklerose, aterosklerose, aortittsyndrom, polyarteritis nodosa, myokardose, skleroderma, Wegeners granulom, Sjögrens syndrom, adipose, eosinofil fascitt, lesjoner i gingiva, periodontium, alveolært bein, substantia ossea dentis, glomerulonefritt, mannlig mønster av skallethet eller alopecia senilis ved å forhindre epilering eller tilveiebringe hårspiring og/eller fremme hårgenerering og hårvekst, muskeldystrofi, pyodermi og Sezarys syndrom, Addisons sykdom, iskemi-reperfusjonsskade i organer som oppstår under konservering, transplantasjon eller iskemisk sykdom, endotoksinsjokk, pseudomembranøs kolitt, kolitt forårsaket av legemiddel eller stråling, iskemisk akutt nyresvikt, kronisk nyreinsuffisiens, toksinose forårsaket av lunge-oksygen eller legemidler, lungekreft, lungeemfysem, katarakta, siderose, retinitis pigmentosa, senil makuladegenerasjon, vitreal arrdannelse, hornhinnealkaliforbrenning, dermatitis erythema multiforme, lineær IgA balløs dermatitt og sementdermatitt, gingivitt, periodontitt, sepsis, pankreatitt, sykdommer forårsaket av miljøforurensning, aldring, karsinogenese, metastase av karsinom og hypobaropati, sykdom forårsaket av histamin eller leukotrien-C₄-frigjøring, Behcets sykdom, autoimmun hepatitt, primær biliær cirrose, skleroserende kolangitt, delvis leverreseksjon, akutt levernekrose, nekrose forårsaket av toksin, viral hepatitt, sjokk, eller anoksi, B-virushepatitt, ikke-A/ikke-B hepatitt, skrumplever, alkoholisk skrumplever, leversvikt, fulminant leversvikt, sendebutleversvikt, «akutt-på-kronisk» leversvikt, forsterkning av kjemoterapeutisk effekt, cytomegalovirusinfeksjon, HCMV-infeksjon, AIDS, kreft, senil demens, traumer, nevropatisk smerte, kronisk bakteriell infeksjon, trombocytopeni, IgA-nefropati, mesangioproliferativ glomerulonefritt, IgG4-relatert sykdom, ankyloserende spondylitt og tilbakefallende polykondritt.

14. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 13 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for behandling av en autoimmun sykdom eller en kronisk inflammatorisk sykdom.